

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6725522号
(P6725522)

(45) 発行日 令和2年7月22日(2020.7.22)

(24) 登録日 令和2年6月29日(2020.6.29)

(51) Int.Cl.

F 1

C07D 401/12	(2006.01)	C07D 401/12	C S P
C07D 401/14	(2006.01)	C07D 401/14	
C07D 409/14	(2006.01)	C07D 409/14	
C07D 405/14	(2006.01)	C07D 405/14	
C07D 413/14	(2006.01)	C07D 413/14	

請求項の数 25 (全 175 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2017-541623 (P2017-541623)
 (86) (22) 出願日 平成28年2月5日(2016.2.5)
 (65) 公表番号 特表2018-505887 (P2018-505887A)
 (43) 公表日 平成30年3月1日(2018.3.1)
 (86) 國際出願番号 PCT/EP2016/052445
 (87) 國際公開番号 WO2016/128298
 (87) 國際公開日 平成28年8月18日(2016.8.18)
 審査請求日 平成31年1月31日(2019.1.31)
 (31) 優先権主張番号 15154252.9
 (32) 優先日 平成27年2月9日(2015.2.9)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
歐州特許庁(EP)

(73) 特許権者 507203353
バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
ンゲゼルシャフト
ドイツ国、40789・モンハイム・アム
・ライン、アルフレートーノベルーシュト
ラーゼ・50
(74) 代理人 100114188
弁理士 小野 誠
(74) 代理人 100119253
弁理士 金山 賢教
(74) 代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明
(74) 代理人 100129713
弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

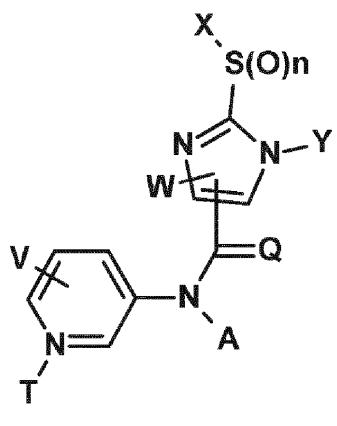
(54) 【発明の名称】有害生物防除剤としての置換されている2-チオイミダゾリルカルボキサミド類

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



〔式中、

Qは、酸素又は硫黄を表し；

20

Vは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、飽和又は不飽和であり、そして、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル（ここで、該シクロアルキルアルキルは、飽和又は不飽和であり、そして、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいアリール、ヘタリール、置換されていてもよいアリールアルキル、ヘタリールアルキル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Yは、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル（ここで、該シクロアルキルアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、アリールアルキル、ヘタリールアルキル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル並びに置換されていてもよいシクロアルキル及びシクロアルキルアルキル（ここで、これらは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

Tは、酸素又は電子対を表す】

で表される化合物及びその塩。

【請求項2】

Qは、酸素又は硫黄を表し；

Vは、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、C₁-C₈-アルキル、C₃-C₈-アルケニル、C₃-C₈-アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキル-S(O)_m、シアノ、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換又は多置換されていてもよい）；C₃-C₈-シクロアルキル又はC₅-C₈-シクロアルケニル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、シアノで1~4置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のC₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル又はC₅-C₈-シクロアルケニル-C₁-C₄-アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、シアノで1~4置換されていてもよい）；アリール（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキル-S(O)_m、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル-S(O)_m、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）；又は、ヘタリール（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキル-S(O)_m、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル-S(O)_m、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のアリール-C₁-C₄-アルキル、ヘタリール-C₁-C₄-アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-

10

20

30

40

50

ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1～3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;

Gは、O、N - CN、N - OR²を表し;

Yは、水素； $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで1置換又は多置換されていてもよい)； $C_3 - C_8$ - シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；直鎖若しくは分枝鎖の $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1～4置換されていてもよい)；アリールアルキル又はヘタリールアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1～3置換されていてもよい)；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素； $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで1置換又は多置換されていてもよい)； $C_3 - C_6$ - シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；及び、直鎖若しくは分枝鎖の $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し；

R²は、水素； $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - アルケニル、 $C_3 - C_8$ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - で1置換又は多置換されていてもよい)； $C_3 - C_8$ - シクロアルキル(ここで、これらは、O、 $S(O)_m$ で1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；直鎖若しくは分枝鎖の $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル(ここで、これらは、O、 $S(O)_n$ で1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；アリール、ヘタリール(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1～3置換されていてもよい)；及び、直鎖若しくは分枝鎖のアリール - $C_1 - C_4$ - アルキル、ヘタリール - $C_1 - C_4$ - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1～3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し；

R³は、水素； $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで1置換又は多置換されていてもよい)の群から

10

20

30

40

50

選択されるラジカルを表し；

R^4 は、水素； $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで1置換又は多置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $CONR^2R^3$ 及び COR^2 （ここで、 R^2 及び R^3 は上記のとおりである）を表し；

T は、酸素又は電子対を表す；

請求項1に記載の化合物及びその塩。

【請求項3】

Q は、酸素を表し；

V は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

W は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

X は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - $S(O)_m$ - 、エチル - $S(O)_m$ - 、シアノ、 $C(O)OR^2$ 、 $CONR^2R^3$ 、 $C(G)R^2$ で1～7置換されていてもよい）； $C_3 - C_6$ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、 CO 、 NR^4 で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖の $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_2$ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、 CO 、 NR^4 で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル、ナフチル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、フラニル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル（ここで、これらは、フェニル（ここで、該フェニルは、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル - $S(O)_m$ - 、エチル - $S(O)_m$ - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - $S(O)_m$ - 、ジフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、トリフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1～3置換されていてもよい）で置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル - $S(O)_m$ - 、エチル - $S(O)_n$ - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - $S(O)_m$ - 、ジフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、トリフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のフェニル - $C_1 - C_2$ - アルキル、ピリジル - $C_1 - C_2$ - アルキル、ピリミジル - $C_1 - C_2$ - アルキル、チアゾリル - $C_1 - C_2$ - アルキル、ピラゾリル - $C_1 - C_2$ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、Me - $S(O)_m$ - 、Et - $S(O)_m$ - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - $S(O)_m$ - 、ジフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、トリフルオロエチル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

G は、O、N - OR² を表し；

Y は、水素； $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - アルケニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニ

10

20

30

40

50

ル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - 、シアノで 1 ~ 5 置換されていてもよい）；C ₃ - C ₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖の C ₃ - C ₆ - シクロアルキル - C ₁ - C ₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S (O) _m 、CO、NR ⁴ で 1 回又は 2 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 ~ 4 置換されていてもよい）；アリール - C ₁ - C ₂ - アルキル又はヘタリール - C ₁ - C ₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、C ₁ - C ₄ - ハロアルキル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノ、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

m は、数 0、1 又は 2 を表し；

n は、数 0、1 又は 2 を表し；

A は、水素；C ₁ - C ₆ - アルキル、C ₃ - C ₆ - アルケニル、C ₃ - C ₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - 、シアノで 1 ~ 5 置換されていてもよい）；C ₃ - C ₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖の C ₃ - C ₆ - シクロアルキル - C ₁ - C ₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R ² は、水素；C ₁ - C ₆ - アルキル、C ₃ - C ₆ - アルケニル、C ₃ - C ₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - で 1 ~ 5 置換されていてもよい）；C ₃ - C ₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、O、S (O) _m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖の C ₃ - C ₆ - シクロアルキル - C ₁ - C ₂ - アルキル（ここで、これらは、O、S (O) _m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；フェニル又はピリジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S (O) _m - 、ジフルオロエチル - S (O) _m - 、トリフルオロエチル - S (O) _m - 、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；及び、直鎖若しくは分枝鎖のフェニル - C ₁ - C ₂ - アルキル、ピリジル - C ₁ - C ₂ - アルキル、ピリミジル - C ₁ - C ₂ - アルキル、チアゾリル - C ₁ - C ₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S (O) _n - 、ジフルオロエチル - S (O) _n - 、トリフルオロエチル - S (O) _n - 、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R ³ は、水素；C ₁ - C ₄ - アルキル、C ₃ - C ₄ - アルケニル、C ₃ - C ₄ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S (O) _m - 、エチル - S (O) _m - 、シアノで 1 ~ 5 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R ⁴ は、水素；C ₁ - C ₄ - アルキル、C ₃ - C ₄ - アルケニル、C ₃ - C ₄ - アルキ

10

20

30

40

50

ニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1～5置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルCONR²R³及びCOR²（ここで、R²及びR³は上記のとおりである）を表し；

Tは、酸素又は電子対を表す；

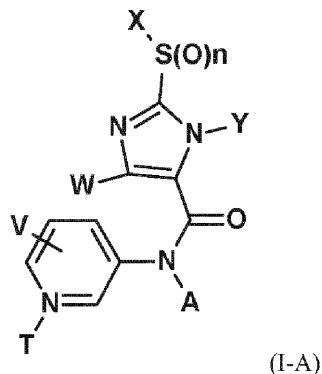
請求項1に記載の化合物及びその塩。

【請求項4】

請求項1～3のいずれかに記載の式(I-A)

【化2】

10



20

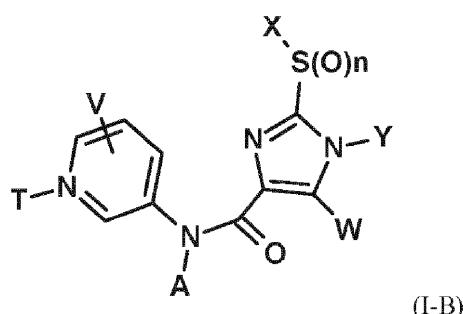
で表される化合物及びその塩。

【請求項5】

請求項1～3のいずれかに記載の式(I-B)

【化3】

30



で表される化合物及びその塩。

【請求項6】

40

Vは、水素、フッ素、塩素、メチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、C₁～C₆アルキル、C₃～C₄アルケニル、C₃～C₄アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1置換、2置換、3置換、4置換、5置換されていてもよく、及び、基C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換されていてもよい）；C₃～C₆シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置

50

換又は 2 置換されていてもよい) ; $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - メチル(ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル(ここで、これらは、フェニル(ここで、該フェニルは、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_n-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されている)で置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_n-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し ;

G は、O、N-O R² を表し ;

Y は、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル及びベンジル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1~3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し ;

m は、数 0、1 又は 2 を表し ;

n は、数 0、1 又は 2 を表し ;

A は、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロビルメチル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1~3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し ;

R² は、水素；C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-で1~3置換されていてもよい) ; C₃-C₆-シクロアルキル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; C₃-C₆-シクロアルキルメチル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; フェニル又はピリジル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し ;

R^3 は、水素； $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_4$ -アルケニル、 $C_3 - C_4$ -アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル- $S(O)_m$ -、エチル- $S(O)_m$ -、シアノで1～3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R^4 は、水素； $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_4$ -アルケニル、 $C_3 - C_4$ -アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル- $S(O)_m$ -、エチル- $S(O)_m$ -、シアノで1～3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $C O N R^2 R^3$ 及び $C O R^2$ （ここで、 R^2 及び R^3 は上記のとおりである）を表し；

T は、酸素又は電子対を表す；

10

請求項4又は5に記載の化合物及びその塩。

【請求項7】

V は、水素又はフッ素を表し；

W は、水素、塩素、臭素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し；

X は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2,2-ジメチルプロピル、ヘキシリル、ネオヘキシリル、アリル、メタリル、2-ブテニル、プロパルギル、2-ブチニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルで1～3置換されていてもよく、及び、基 $C(O)OR^2$ 、 $C(OR^2)R^3$ 、 $C(G)R^2$ で1置換されていてもよい）；シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル（ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシリルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、O、 $S(O)_m$ 、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾビリジニル（ここで、これらは、フェニルで置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル- $C_1 - C_2$ -アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル、ジフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

G は、O、N-OR²を表し；

Y は、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メ

20

30

40

50

トキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル及びベンジルの群から選択されるラジカルを表し；

m は、数0、1又は2を表し；

n は、数0、1又は2を表し；

A は、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルの群から選択されるラジカルを表し；

R^2 は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、アリル、メタリル、2-ブテニル、プロパルギル、2-ブチニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシで1～3置換されていてもよい）；シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル（ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル（ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル又はピリジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル、トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R^3 は、水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル及びアリルの群から選択されるラジカルを表し；

R^4 は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル及びアリル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1～3回置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルCO NR²R³及びCOR²（ここで、R²及びR³は上記のとおりである）を表し；

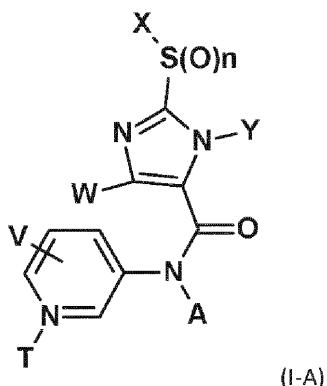
Tは、酸素又は電子対を表す；

請求項4又は5に記載の化合物及びその塩。

【請求項8】

請求項1に記載の式(I-A)

【化4】



〔式中、

Vは、水素を表し；

Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し；

Xは、メチル、エチル、n-ブチル、n-ペンチル、n-プロピル、イソプロピル、アリル、3,3-ジメチルアリル、プロパルギル、シクロヘキシリル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、3-オキセタニル、5-オキサ-[3.3.0]-ビシクロヘプタニル、メトキシエチル、メトキシプロピル、エトキシエチル、エチルチオエチル、メチルチオエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3-クロロ-2,2,3,3-テトラフルオロオロプロピル、3-フルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、2,2,2-トリフルオロエチルチオエチル、メチルカルボニルメチル、シクロプロピルカルボニルメチル、tert-ブチルカルボニルメチル、メトキカルボニルメチル、エトキカルボニルメチル、ヒドロキカルボニルメチル、カルバモイルメチル、N-メチルカルバモイルメチル、N-シクロプロピルカルバモイルメチル、N,N-ジメチルカルバモイルメチル、2-メトキシイミノプロピル、シクロプロピルメチル、フェニル、4-メチルフェニル、2-ニトロフェニル、3-メチルチオフェニル、4-クロロフェニル、4-フルオロフェニル、4-tert-ブチルフェニル、4-メトキシフェニル、4-ニトロフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、2-フルオロフェニル、2-メトキシフェニル、2-ジメチルアミノスルホニルフェニル、2-ジメチルアミノカルバモイルフェニル、3-ニトロフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル、2,4,5-トリクロロフェニル、2-ピリジル、5-(2-クロロ)ピリジル、2-(5-メチル)ピリジル、2-(6-メチル)ピリジル、2-(3-トリフルオロメチル)ピリジル、2-ピリミジル、2-(4-メチル)ピリミジル、2-(5-フルオロ)ピリミジル、2-(4-トリフルオロメチル)ピリミジル、2-(5-トリフルオロメチル)ピリミジル、2-(4,6-ジメチル)ピリミジル、2-(4,5-ジメチル)ピリミジル、2-(4,6-ジメトキシ)ピリミジル、-CH₂-2-ピリミジル、-CH₂-2-ピラジニル、-CH₂-5-(1-メチル)イミダゾリル、-CH₂-3-(1-メチル)ピラゾリル、-CH₂-4-ピリジル、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-2-(1-メチル)イミダゾリル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-2-フラニル、-CH₂-5-(2-クロロ)ピリジル、ベンジル、3,4-ジクロロベンジル、2,6-ジフルオロベンジル、2-フルオロ-6-メトキシベンジル、2,6-ジクロロベンジル、2-クロロ-6-トリフルオロメチルベンジル、2-クロロ-6-フルオロベンジル、-CH₂-2-(4,6-ジメトキシ)ピリミジル、2,6-ジメチルベンジル、-CH₂-1-(3-ニトロ-5-メチル)ピラゾリル、2-(1-メチル)ベンゾイミダゾリル、2-(5-メチル) 20

20

30

40

50

オキサジアゾリル、2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4.5]ピリジニル、3-[4-エチル-5-(トリフルオロメチル)]-1,2,4-トリアゾリル、3-[4-メチル-5-(ジフルオロメチル)]-1,2,4-トリアゾリル、2-(5-フェニル)-1,3,4-チアジアゾリル、2-(1-メチル-5-フェニル)イミダゾリル、2-(4,5-ジメチル)オキサゾリル、2-(1-メチル-5-メトキシカルボニル)イミダゾリル、2-(1-メチル)イミダゾリル、1,2-エタンジイルの群から選択されるラジカルを表し；

Yは、メチル、エチル又はベンジルを表し；

nは、数0又は2を表し；

Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し；

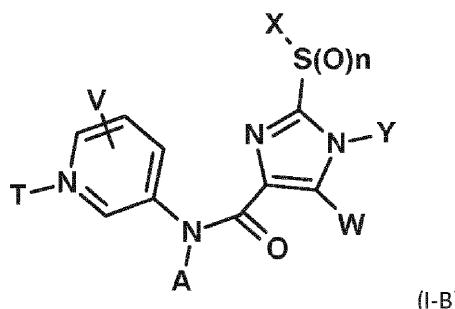
Tは、電子対を表す】

で表される化合物及びその塩；

及び、

請求項1に記載の式(I-B)

【化5】



〔式中、

Vは、水素を表し；

Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し；

Xは、4,6-ジメチルピリミジル、n-ブチル、n-ペンチル、ベンジル、メチル、3-メチルチオフェニル、2,2,2-トリフルオロエチル、フェニル、4-メチルフェニル、ピリミジル、エチルチオエチル、2-ニトロフェニル、シクロプロピルメチルの群から選択されるラジカルを表し；

Yは、メチルを表し；

nは、数0又は2を表し；

Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し；

Tは、電子対を表す】

で表される化合物及びその塩。

【請求項9】

式(I-A)のWが水素を表す、請求項8に記載の式(I-A)で表される化合物及びその塩及び式(I-B)で表される化合物及びその塩。

【請求項10】

式(I-A)のnが数0を表す、請求項8又は9に記載の式(I-A)で表される化合物及びその塩及び式(I-B)で表される化合物及びその塩。

【請求項11】

式(I-A)のAがメチルを表す、請求項8~10のいずれか一項に記載の式(I-A)で表される化合物及びその塩及び式(I-B)で表される化合物及びその塩。

【請求項12】

10

20

30

40

50

式(I - B)のWが水素を表す、請求項8～11のいずれか一項に記載の式(I - A)で表される化合物及びその塩及び式(I - B)で表される化合物及びその塩。

【請求項13】

式(I - B)のXがピリミジルラジカルを表す、請求項8～12のいずれか一項に記載の式(I - A)で表される化合物及びその塩及び式(I - B)で表される化合物及びその塩。

【請求項14】

式(I - B)のnが数0を表す、請求項8～13のいずれか一項に記載の式(I - A)で表される化合物及びその塩及び式(I - B)で表される化合物及びその塩。

【請求項15】

式(I - B)のAがメチルを表す、請求項8～14のいずれか一項に記載の式(I - A)で表される化合物及びその塩及び式(I - B)で表される化合物及びその塩。

【請求項16】

動物有害生物を防除するための組成物であって、請求項1～15のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物並びに慣習的な增量剤及び/又は界面活性剤を含んでいる、前記組成物。

【請求項17】

動物有害生物を防除する方法であって、請求項1～15のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物又は請求項16に記載の組成物を当該動物有害生物及び/又はそれらの生息環境に作用させる、前記方法、ただし、人における有害生物を防除する方法を除く。

【請求項18】

動物有害生物を防除するための、請求項1～15のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物又は請求項16に記載の組成物の使用、ただし、人への使用を除く。

【請求項19】

ヒト又は動物の身体の外科的な処置、治療的な処置及び診断的な処置は除外される、請求項17に記載の方法又は請求項18に記載の使用。

【請求項20】

植物の繁殖器官を保護するための、請求項1～15のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物の使用。

【請求項21】

農薬製剤であって、請求項1～15のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物を、その農薬製剤の重量に基づいて0.00000001～98重量%の生物学的に有効な量で含んでおり、並びに、增量剤及び/又は界面活性剤も含んでいる、前記農薬製剤。

【請求項22】

さらなる農薬活性化合物もさらに含んでいる、請求項21に記載の農薬製剤。

【請求項23】

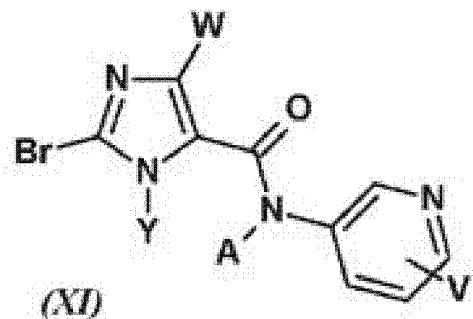
式(XI)、式(XXI)

10

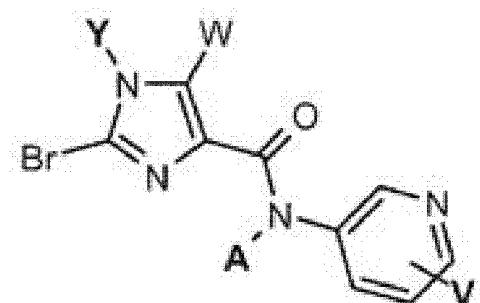
20

30

【化6】



10



20

(XXI),

〔式中、ラジカルA、Y、V及びWは、請求項1～15のいずれかに記載の意味を有している〕

で表される中間体。

【請求項24】

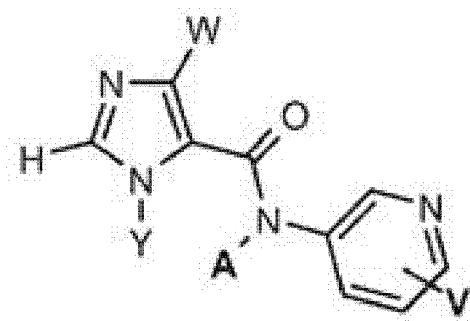
前記ラジカルA、Y、V及びWが請求項8～15のいずれかに記載の意味を有している
、請求項23に記載の式(XI)、式(XXI)で表される中間体。

30

【請求項25】

式(XV)

【化7】



40

(XV),

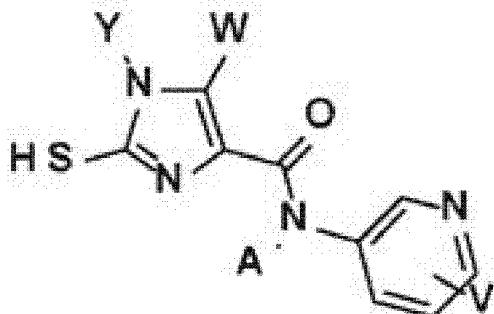
〔式中、

Vは、水素を表し；

Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し；

50

Yは、メチル、エチル又はベンジルを表し；及び
Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表す】
で表される中間体
及び
式(XXII)
【化8】



10

(XXII),

20

〔式中、
Vは、水素を表し；
Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し；
Yは、メチルを表し；及び
Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表す】
で表される中間体。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

30

本出願は、新規ヘテロ環式化合物、それらを調製するための方法及び中間体、並びに、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】

WO 2011/009804 A2には、殺虫剤として使用することが可能なヘテロ環式化合物（これは、とりわけ、イミダゾリルカルボキサミド類を包含する）が記載されている。

【0003】

現代の殺虫剤は、例えば、作用の程度、作用の持続性及び作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性に関する問題、有益種及び花粉媒介者の保護に関する問題、環境特性に関する問題、施用量に関する問題、別の活性成分又は製剤助剤との組合せ可能性に関する問題は、活性成分を合成するのに必要とされる努力の問題と同様に、ある種の役割を果たす。ほんの僅かな要因を挙げれば、さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由のみにより、新規作物保護組成物の探求は、完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して少なくとも個々の態様に関して改善されている特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

40

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献1】国際特許出願公開第2011/009804 A2号

50

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明の目的は、さまざまな局面下において有害生物防除剤（pesticide）のスペクトルを拡大させる化合物を提供することであった。

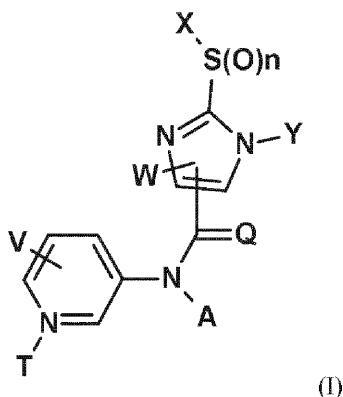
【課題を解決するための手段】

【0006】

この目的、及び、明示的には示されていないが本明細書中で論じられている文脈から認識又は誘導され得るさらなる目的は、式（I）

【化1】

10



(I)

20

【0007】

〔式中、

Qは、酸素又は硫黄を表し；

Vは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、飽和又は不飽和であり、そして、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル（ここで、該シクロアルキルアルキルは、飽和又は不飽和であり、そして、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいアリール、ヘタリール、置換されていてもよいアリールアルキル、ヘタリールアルキル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Yは、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル（ここで、該シクロアルキルアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）、アリールアルキル、ヘタリールアルキル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル並びに置換されていてもよいシクロアルキル及びシクロアルキルアルキル（ここで、これらは、ヘテロ原子で中断されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

Tは、酸素又は電子対を表す】

で表される化合物及びその塩を提供することによって達成される。

【発明を実施するための形態】

【0008】

30

式（I）で表される化合物において示されているラジカルに関する好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲（1）を形成する。

【0009】

40

Qは、酸素又は硫黄を表し；

Vは、水素、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、C₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - アルケニル、C₃ - C₈ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、シアノ、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換又は多置換されていてもよい）；C₃ - C₈ - シクロアルキル又はC₅ - C₈ - シクロアルケニル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、シアノで1~4置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のC₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル又はC₅ - C₈ - シクロアルケニル - C₁ - C₄ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、C(G)R²、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、シアノで1~4置換されていてもよい）；アリール（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）；又は、ヘタリール（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のアリール - C₁ - C₄ - アルキル、ヘタリール - C₁ - C₄ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

Gは、O、N - CN、N - OR²を表し；

Yは、水素；C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、シアノで1置換又は多置換されていてもよい）；C₃ - C₈ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；直鎖若しくは分枝鎖のC₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、シアノで1~4置換されていてもよい）；アリールアルキル又はヘタリールアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキル - S(O)_m -、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素；C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄

C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで 1 置換又は多置換されていてもよい) ; C_3 - C_6 - シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい) ; 及び、直鎖若しくは分枝鎖の C_3 - C_8 - シクロアルキル - C_1 - C_4 - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい) の群から選択されるラジカルを表し;

R^2 は、水素 ; C_1 - C_8 - アルキル、 C_3 - C_8 - アルケニル、 C_3 - C_8 - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - で 1 置換又は多置換されていてもよい) ; C_3 - C_8 - シクロアルキル(ここで、これらは、O、 $S(O)_m$ で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい) ; 直鎖若しくは分枝鎖の C_3 - C_8 - シクロアルキル - C_1 - C_4 - アルキル(ここで、これらは、O、 $S(O)_n$ で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい) ; アリール、ヘタリール(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - 、 C_1 - C_4 - ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで 1 ~ 3 置換されていてもよい) ; 及び、直鎖若しくは分枝鎖のアリール - C_1 - C_4 - アルキル、ヘタリール - C_1 - C_4 - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - 、 C_1 - C_4 - ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 - ハロアルキル - $S(O)_m$ - 、ニトロ及びシアノで 1 ~ 3 置換されていてもよい) の群から選択されるラジカルを表し;

R^3 は、水素 ; C_1 - C_6 - アルキル、 C_3 - C_6 - アルケニル、 C_3 - C_6 - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで 1 置換又は多置換されていてもよい) の群から選択されるラジカルを表し;

R^4 は、水素 ; C_1 - C_6 - アルキル、 C_3 - C_6 - アルケニル、 C_3 - C_6 - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、ハロゲン、 C_1 - C_4 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - アルキル - $S(O)_m$ - 、シアノで 1 置換又は多置換されていてもよい) の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $CONR^2R^3$ 及び COR^2 (ここで、好ましい範囲(1)の上記定義は、 R^2 及び R^3 に当てはまる)を表し;

T は、酸素又は電子対を表す;

及び、その塩。

【0010】

式(I)で表される化合物において示されているラジカルに関する特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲(2)を形成する。

【0011】

Q は、酸素を表し;

V は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し;

W は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ及びシアノの群から選択されるラジカルを表し;

X は、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_3 - C_6 - アルケニル、 C_3 - C_6 - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル -

10

20

30

40

50

S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノ、C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1~7置換されていてもよい)；C₃-C₆-シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；直鎖若しくは分枝鎖のC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；フェニル、ナフチル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、フラニル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル(ここで、これらは、フェニル(ここで、該フェニルは、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_n-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1~3置換されていてもよい)で置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_n-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)；直鎖若しくは分枝鎖のフェニル-C₁-C₂-アルキル、ピリジル-C₁-C₂-アルキル、ピリミジル-C₁-C₂-アルキル、チアゾリル-C₁-C₂-アルキル、ピラゾリル-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

Gは、O、N-OR²を表し；

Yは、水素；C₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-アルケニル、C₃-C₄-アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1~5置換されていてもよい)；C₃-C₆-シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)；直鎖若しくは分枝鎖のC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1~4置換されていてもよい)；アリール-C₁-C₂-アルキル又はヘタリール-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、C₁-C₄-ハロアルキル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノ、ニトロで1置換又は2置換されていてもよい)；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素；C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1~5置換されていてもよい)；C₃-C₆-シクロアルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素

10

20

30

40

50

、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 直鎖若しくは分枝鎖のC₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;

R²は、水素; C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m - 、エチル-S(O)_m - で1~5置換されていてもよい) ; C₃ - C₆ - シクロアルキル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 直鎖若しくは分枝鎖のC₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; フェニル又はピリジル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m - 、エチル-S(O)_m - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m - 、ジフルオロエチル-S(O)_m - 、トリフルオロエチル-S(O)_m - 、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、直鎖若しくは分枝鎖のフェニル - C₁ - C₂ - アルキル、ピリジル - C₁ - C₂ - アルキル、ピリミジル - C₁ - C₂ - アルキル、チアゾリル - C₁ - C₂ - アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m - 、エチル-S(O)_m - 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_n - 、ジフルオロエチル-S(O)_n - 、トリフルオロエチル-S(O)_n - 、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;

R³は、水素; C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m - 、エチル-S(O)_m - 、シアノで1~5置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;

R⁴は、水素; C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m - 、エチル-S(O)_m - 、シアノで1~5置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルCONR²R³及びCOR²(ここで、好ましい範囲(2)の上記定義は、R²及びR³に当てはまる)を表し;

Tは、酸素又は電子対を表す;

及び、その塩。

【0012】

式(I)で表される化合物において示されているラジカルの極めて特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮することにより、極めて特に好ましい構造(I-A)が得られる。それらの組合せは、好ましい範囲(3-A)を形成する。

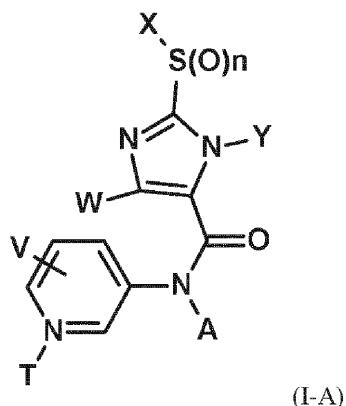
10

20

30

40

【化2】



【0013】

Vは、水素、フッ素、塩素、メチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；
Wは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1置換、2置換、3置換、4置換、5置換されていてもよく、及び、基C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル（ここで、これらは、フェニル（ここで、該フェニルは、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_n-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）で置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル-C₁ - C₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、Me-S(O)_m-、Et-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_n-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

Gは、O、N-OR²を表し；

Yは、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル及びベンジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1～3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表し；

10

20

30

40

50

n は、数 0、1 又は 2 を表し；

A は、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 ~ 3 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R² は、水素；C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メチル - S(O)_m -、エチル - S(O)_m - で 1 ~ 3 置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、O、S(O)_m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル - メチル（ここで、これらは、O、S(O)_m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；フェニル又はピリジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル - S(O)_m -、エチル - S(O)_m -、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S(O)_m -、ジフルオロエチル - S(O)_m -、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル - S(O)_m -、エチル - S(O)_m -、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S(O)_m -、ジフルオロエチル - S(O)_m -、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R³ は、水素；C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S(O)_m -、エチル - S(O)_m -、シアノで 1 ~ 3 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R⁴ は、水素；C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル - S(O)_m -、エチル - S(O)_m -、シアノで 1 ~ 3 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル CONR²R³ 及び COR²（ここで、好ましい範囲（3 Å）の上記定義は、R² 及び R³ に当てはまる）を表し；

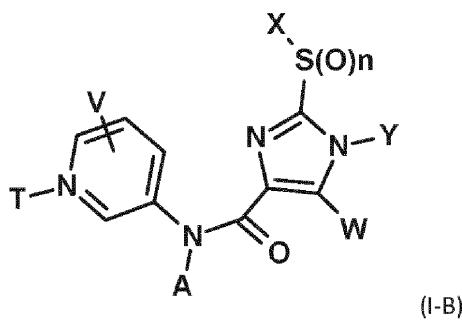
T は、酸素又は電子対を表す；

及び、その塩。

【0014】

式（I）で表される化合物において示されているラジカルの極めて特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮することにより、極めて特に好ましい構造（I-B）が得られる。それらの組合せは、好ましい範囲（3-B）を形成する。

【化3】



10

20

30

40

50

【0015】

Vは、水素、フッ素、塩素、メチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル及びシアノの群から選択されるラジカルを表し；

Xは、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m -、エチル-S(O)_m -、シアノで1～5置換されていてもよく、及び、基C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル - メチル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル（ここで、これらは、フェニル（ここで、該フェニルは、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m -、エチル-S(O)_n -、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S(O)_m -、ジフルオロエチル - S(O)_m -、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）で置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m -、エチル-S(O)_m -、ジフルオロメトキシ、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ジフルオロエチル - S(O)_m -、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；ベニジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル - C₁ - C₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、Me - S(O)_m -、Et - S(O)_m -、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル - S(O)_m -、ジフルオロエチル - S(O)_m -、トリフルオロエチル - S(O)_m -、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

Gは、O、N - OR²を表し；

Yは、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル及びベンジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1～3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表し；

nは、数0、1又は2を表し；

Aは、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1～3置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

R²は、水素；C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m -、エチル-S(O)_m -で1～3置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキル（ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；C₃ - C₆ - シクロアルキルメチル（ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；

10

20

30

40

50

換されていてもよい) ; フェニル又はピリジル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル-S(O)_m-、ジフルオロエチル-S(O)_m-、トリフルオロエチル-S(O)_m-、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;
10

R³は、水素; C₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-アルケニル、C₃-C₄-アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1~3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し;

R⁴は、水素; C₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-アルケニル、C₃-C₄-アルキニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチル-S(O)_m-、エチル-S(O)_m-、シアノで1~3置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルC O N R² R³及びC O R²(ここで、好ましい範囲(3B)の上記定義は、R²及びR³に当てはまる)を表し;
20

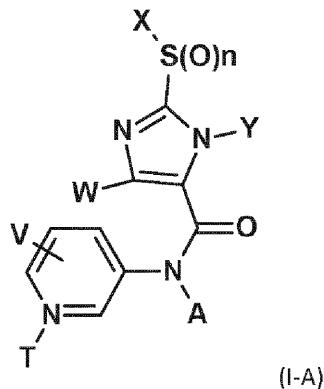
Tは、酸素又は電子対を表す;

及び、その塩。

【0016】

式(I)で表される化合物において示されているラジカルに関するとりわけ好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮することにより、とりわけ好ましい構造(I-A)が得られる。そのとりわけ好ましい置換基との組合せは、好ましい範囲(4-A)を形成する。

【化4】



【0017】

Vは、水素又はフッ素を表し;

Wは、水素、塩素、臭素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し;

Xは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2,2-ジメチルプロピル、ヘキシリル、ネオヘキシリル、アリル、メタリル、2-ブテニル、プロパルギル、2-ブチニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルで1~3置換されていてもよく、及び、基C(O)OR²、C

O N R² R³、C(G)R²で1置換されていてもよい) ; シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル(ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロベンチルメチル、シクロヘキシルメチル(ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾビリジニル(ここで、これらは、フェニルで置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル-C₁-C₂-アルキル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し ;

Gは、O、N-O R²を表し ;

Yは、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル及びベンジルの群から選択されるラジカルを表し ;

mは、数0、1又は2を表し ;

nは、数0、1又は2を表し ;

Aは、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルの群から選択されるラジカルを表し ;

R²は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、アリル、メタリル、2-ブテニル、プロパルギル、2-ブチニル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシで1~3置換されていてもよい) ; シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロベンチルメチル、シクロヘキシルメチル(ここで、これらは、O、S(O)_mで1回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; フェニル又はピリジル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルホニル、メチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい) ; 及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し ;

10

20

30

40

50

エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル、トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)；及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル(ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ニトロ及びシアノで1置換又は2置換されていてもよい)の群から選択されるラジカルを表す；

R^3 は、水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル及びアリルの群から選択されるラジカルを表し； 10

R^4 は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル及びアリル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで 1 ~ 3 回置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $C_0N R^2 R^3$ 及び C_0R^2 （ここで、好ましい範囲（4 Å）の上記定義は、 R^2 及び R^3 に当てはまる）を表し；

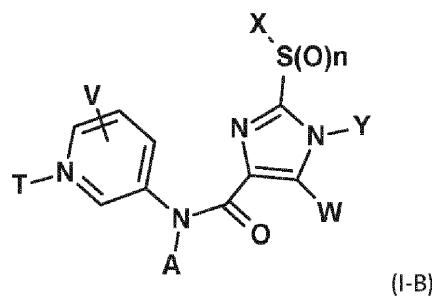
Tは、酸素又は電子対を表す；

及び、その塩。

【 0 0 1 8 】

式(Ⅰ)で表される化合物において示されているラジカルに関するとりわけ好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮することにより、とりわけ好ましい構造(Ⅰ-B)が得られる。そのとりわけ好ましい置換基との組合せは、好ましい範囲(4-B)を形成する。

【化 5】



【 0 0 1 9 】

▽は、水素又はフッ素を表し；

Wは、水素、塩素、臭素及びメチルの群から選択されるラジカルを表す；

Xは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2,2-ジメチルプロピル、ヘキシリ、ネオヘキシリ、アリル、メタリル、2-ブテニル、プロパルギル、2-ブチニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、シアノで1～3置換されていてもよく、及び、基C(O)OR²、CONR²R³、C(G)R²で1置換されていてもよい）；シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシリメチル（ここで、これらは、互いに独立して、O、S(O)_m、CO、NR⁴で1回又は2回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで1置換又は2置換されていてもよい）；フェニル、ピリジル、ピリミジル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル。

リル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ベンゾイミダゾリル、イミダゾピリジニル（ここで、これらは、フェニルで置換されていてもよく、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルフィニル トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル、ピラゾリル - C₁ - C₂ - アルキル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルフィニル トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；及び、シアノの群から選択されるラジカルを表し；

G は、O、N - O R² を表し；

Y は、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル及びベンジルの群から選択されるラジカルを表し；

m は、数 0、1 又は 2 を表し；

n は、数 0、1 又は 2 を表し；

A は、水素、メチル、エチル、プロピル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、アリル、プロパルギル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルの群から選択されるラジカルを表し；

R² は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、sec - ブチル、tert - ブチル、アリル、メタリル、2 - プテニル、プロパルギル、2 - ブチニル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシで 1 ~ 3 置換されていてもよい）；シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル（ここで、これらは、O、S(O)_m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロベンチルメチル、シクロヘキシルメチル（ここで、これらは、O、S(O)_m で 1 回中断されていてもよく、及び、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；フェニル又はピリジル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルスルファニル、エチルスルファニル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロエチルスルファニル、トリフルオロエチルスルフィニル、トリフルオロエチルスルホニル、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）；及び、ベンジル、ピリジルメチル、ピリミジルメチル、チアゾリルメチル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ニトロ及びシアノで 1 置換又は 2 置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し；

10

20

30

40

50

R³は、水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル及びアリルの群から選択されるラジカルを表し；

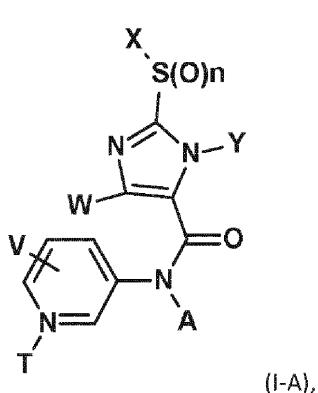
R⁴は、水素；メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル及びアリル（ここで、これらは、互いに独立して、フッ素、メトキシ、エトキシ、シアノで1～3回置換されていてもよい）の群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルCONR²R³及びCOR²（ここで、好ましい範囲（4B）の上記定義は、R²及びR³に当てはまる）を表し；

Tは、酸素又は電子対を表す；
及び、その塩。

【0020】

10

式（I）で表される化合物において示されているラジカルの極めて特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲（5）を形成する。
【化6】



20

【0021】

Vは、水素を表し；
Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し、及び、好ましくは、水素を表し；

Xは、メチル、エチル、n-ブチル、n-ペンチル、n-プロピル、イソプロピル、アリル、3,3-ジメチルアリル、プロパルギル、シクロヘキシリル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、3-オキセタニル、5-オキサ-[3.3.0]-ビシクロヘプタニル、メトキシエチル、メトキシプロピル、エトキシエチル、エチルチオエチル、メチルチオエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3-クロロ-2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、3-フルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、2,2,2-トリフルオロエチルチオエチル、メチルカルボニルメチル、シクロプロピルカルボニルメチル、tert-ブチルカルボニルメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、ヒドロキシカルボニルメチル、カルバモイルメチル、N-メチルカルバモイルメチル、N-シクロプロピルカルバモイルメチル、N,N-ジメチルカルバモイルメチル、2-メトキシイミノプロピル、シクロプロピルメチル、フェニル、4-メチルフェニル、2-ニトロフェニル、3-メチルチオフェニル、4-クロロフェニル、4-フルオロフェニル、4-tert-ブチルフェニル、4-メトキシフェニル、4-ニトロフェニル、4-ジメチルアミノフェニル、2-フルオロフェニル、2-メトキシフェニル、2-ジメチルアミノスルホニルフェニル、2-ジメチルアミノカルバモイルフェニル、3-ニトロフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル、2,4,5-トリクロロフェニル、2-ピリジル、5-(2-クロロ)ピリジル、2-(5-メチル)ピリジル、2-(6-メチル)ピリジル、2-(3-トリフルオロメチル)ピリジル、2-ピリミジル、2-(4-メチル)ピリミジル、2-(5-メチル)ピリミジル、2-(4-メトキシ)ピリミジル、2-(5-フルオロ)ピリミジル、2-(4-

40

50

トリフルオロメチル)ピリミジル、2-(5-トリフルオロメチル)ピリミジル、2-(4,6-ジメチル)ピリミジル、2-(4,5-ジメチル)ピリミジル、2-(4,6-ジメトキシ)ピリミジル、-CH₂-2-ピリミジル、-CH₂-2-ピラジニル、-CH₂-5-(1-メチル)イミダゾリル、-CH₂-3-(1-メチル)ピラゾリル、-CH₂-4-ピリジル、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-2-(1-メチル)イミダゾリル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-2-フラニル、-CH₂-5-(2-クロロ)ピリジル、ベンジル、3,4-ジクロロベンジル、2,6-ジフルオロベンジル、2-フルオロ-6-メトキシベンジル、2,6-ジクロロベンジル、2-クロロ-6-トリフルオロメチルベンジル、2-クロロ-6-フルオロベンジル、-CH₂-2-(4,6-ジメトキシ)ピリミジル、2,6-ジメチルベンジル、-CH₂-1-(3-ニトロ-5-メチル)ピラゾリル、2-(1-メチル)ベンゾイミダゾリル、2-(5-メチル)オキサジアゾリル、2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4.5]ピリジニル、3-[4-エチル-5-(トリフルオロメチル)]-1,2,4-トリアゾリル、3-[4-メチル-5-(ジフルオロメチル)]-1,2,4-トリアゾリル、2-(5-フェニル)-1,3,4-チアジアゾリル、2-(1-メチル-5-フェニル)イミダゾリル、2-(4,5-ジメチル)オキサゾリル、2-(1-メチル-5-メトキシカルボニル)イミダゾリル、2-(1-メチル)イミダゾリル、1,2-エタンジイルの群から選択されるラジカルを表し；

Yは、メチル、エチル又はベンジルを表し；

10

nは、数0又は2を表し、及び、好ましくは、0を表し；

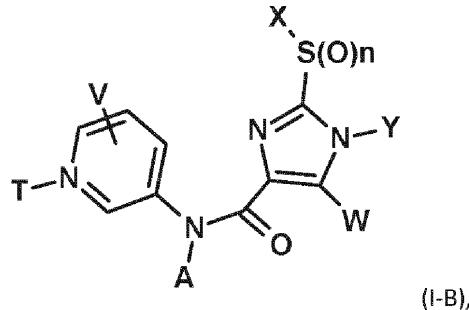
Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し、及び、好ましくは、メチルを表し；

Tは、電子対を表す；

及び、

式(I-B)で表される化合物

【化7】



【0022】

ここで、

Vは、水素を表し；

Wは、水素、塩素及び臭素の群から選択されるラジカルを表し、及び、好ましくは、水素を表し；

40

Xは、4,6-ジメチルピリミジル、n-ブチル、n-ペンチル、ベンジル、メチル、3-メチルチオフェニル、2,2,2-トリフルオロエチル、フェニル、4-メチルフェニル、2-ピリミジル、エチルチオエチル、2-ニトロフェニル、シクロプロピルメチルの群から選択されるラジカルを表し、及び、好ましくは、2-ピリミジルラジカルを表し；

Yは、メチルを表し；

nは、数0又は2を表し、及び、好ましくは、0を表し；

Aは、水素及びメチルの群から選択されるラジカルを表し、及び、好ましくは、メチルを表し；

50

Tは、電子対を表す；
及び、その塩。

【0023】

好ましい範囲(1-5)のうちの1つにおいて、XとYは、それらが結合している原子と一緒に、飽和又は不飽和の環を表すことも可能である。好ましくは、XとYは、それらが結合している原子と一緒に、飽和又は不飽和の5~7員の環を表す。極めて特に好ましくは、XとYは、それらが結合している原子と一緒に、飽和5員環を表す。

【0024】

好ましい範囲(1)において、別途示されていない限り、
ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フ
10 ッ素、塩素及び臭素からなる群から選択され；

ヘタリール(「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位(例えば、ヘタリールアルキル)の一部分としてのヘタリールを包含する)は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチ
20 エニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、ブリニル、ブテリジニル及びインドリジニルからなる群から選択され；

ヘテロシクリルは、1個若しくは2個の窒素原子及び/又は1個の酸素原子及び/又は1個の硫黄原子を含んでいる(しかしながら、2個の窒素原子は直接隣接することはできない)3員、4員、5員又は6員の飽和環、例えば、アジリジニル、アゼチジニル、アゾリジニル、アジナニル、オキシラニル、オキセタニル、オキソラニル、オキサニル、ジオキサニル、チイラニル、チエタニル、チオラニル、チアニル及びテトラヒドロフリルなどを表す。

【0025】

好ましい範囲(2)において、別途示されていない限り、
ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素及び臭
30 素を表し；

ヘタリール(これは、より大きな単位(例えば、ヘタリールアルキル)の一部分としてのヘタリールを包含する)は、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ベンジル、ピリジニルメチル及びチアゾリルメチルを表し；及び、

ヘテロシクリル(これは、より大きな単位(例えば、ヘテロシクリルアルキル)の一部分としてのヘテロシクリルを包含する)は、1個若しくは2個の窒素原子及び/又は1個の酸素原子及び/又は1個の硫黄原子を含んでいる(しかしながら、2個の窒素原子は直接隣接することはできない)3員、4員又は5員の飽和又は不飽和の環、例えば、1-アジリジニル若しくは2-アジリジニル、2-オキシラニル、2-チイラニル、1-アゼチジニル若しくは2-アゼチジニル、2-オキセタニル若しくは3-オキセタニル、2-チエタニル若しくは3-チエタニル、1,3-ジオキセタン-2-イル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル若しくは3-ピロリジニルなどを表す。

【0026】

好ましい範囲(3)において、別途示されていない限り、
ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素及び臭
50

素を表し；及び、

ヘテロシクリル（これは、より大きな単位（例えば、ヘテロシクリルアルキル）の一部分としてのヘテロシクリルを包含する）は、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は1個の酸素原子及び／又は1個の硫黄原子を含んでいる（しかしながら、2個の窒素原子は直接隣接することはできない）3員又は4員の飽和又は不飽和の環、例えば、1-アジリジニル若しくは2-アジリジニル、2-オキシラニル、2-チイラニル、1-アゼチジニル若しくは2-アゼチジニル、2-オキセタニル若しくは3-オキセタニル、2-チエタニル若しくは3-チエタニル、又は、1,3-ジオキセタン-2-イルなどを表す。ハロゲンで置換されているラジカル（例えば、ハロアルキル）は、別途特定されていない限り、1ハロゲン化されているか、又は、可能な置換基の最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なっていてもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に、フッ素、塩素又は臭素である。

【0027】

飽和又は不飽和の炭化水素ラジカル（例えば、アルキル又はアルケニル）は、それぞれ、可能である場合は、直鎖又は分枝鎖であることができ、このことは、例えばアルコキシにおける場合のように、ヘテロ原子と組み合わされている場合も包含する。

【0028】

別途示されていない限り、置換されていてもよいラジカルは、1置換又は多置換されることでき、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であっても又は異なっていてもよい。

【0029】

式（I）で表される化合物において、Tが酸素を表す場合、これらの化合物はN-オキシドとして存在している。

【0030】

式（I）で表される化合物において、Tが電子対を表す場合、これらの化合物はピリジンとして存在している。

【0031】

上記で概括的に又は好ましい範囲内において与えられているラジカルの定義又は説明は、最終生成物に当たはまり、並びに、対応するように、出発物質及び中間体に当たはまる。ラジカルについてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0032】

本発明によれば、好ましいのは、好ましいもの（好ましい範囲（1））として上記で記載されている意味の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物の使用である。

【0033】

本発明によれば、特に好ましいのは、特に好ましいもの（好ましい範囲（2））として上記で記載されている意味の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物の使用である。

【0034】

本発明によれば、極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（3A、及び／又は、3B））として上記で記載されている定義の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物の使用である。

【0035】

本発明によれば、とりわけ好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（4A、及び／又は、4B））として上記で記載されている定義の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物の使用である。

【0036】

本発明によれば、一層さらに好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（5））として上記で記載されている意味の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物

の使用である。

【0037】

式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、及び/又は、光学活性異性体の形態でも、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロブ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の混合物の両方を包含する。

【0038】

さらに、式(I)で表される新規化合物は、以下に記載されている調製方法によって調製することが可能であることが分かった。

10

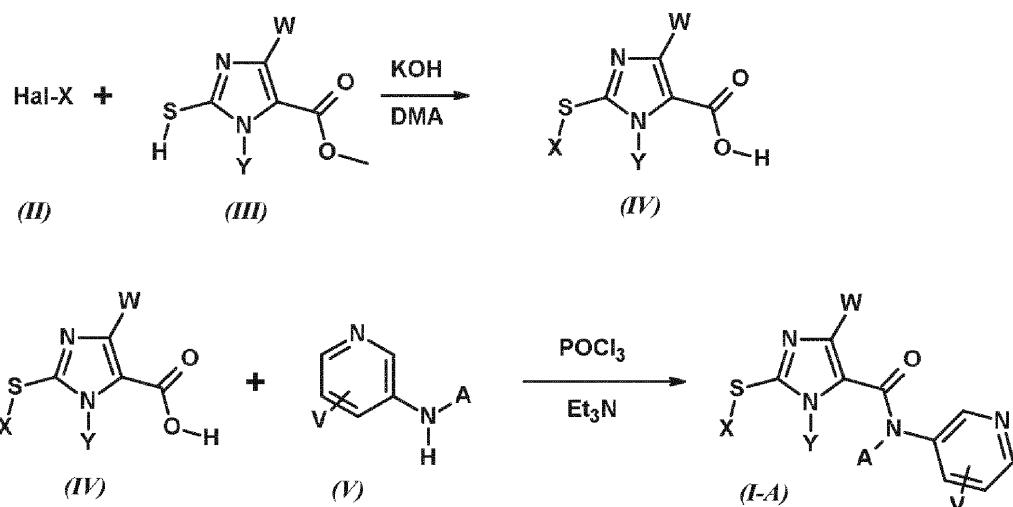
【0039】

式(I-A)で表される化合物は、例えば、下記スキームにおいて示されているように、調製方法A～調製方法Dに準じて、合成することができる。

【0040】

調製方法A-1

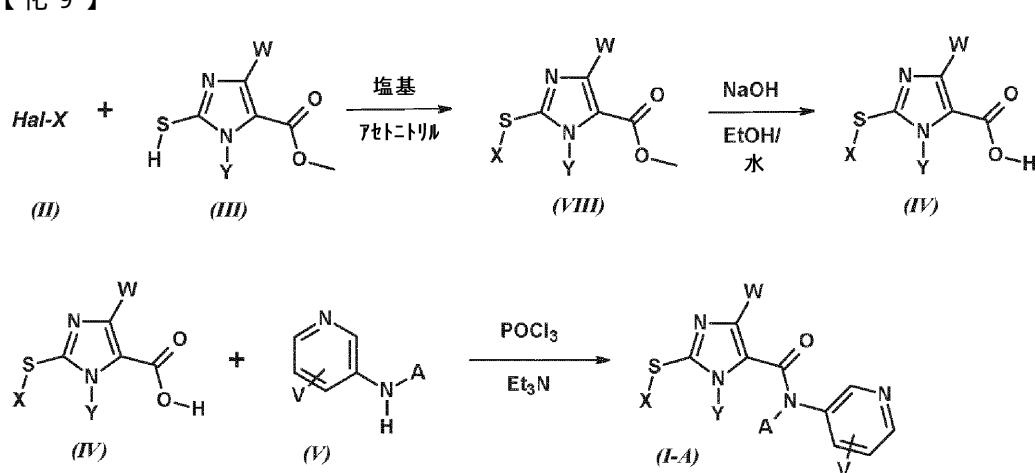
【化8】



【0041】

調製方法A-2

【化9】

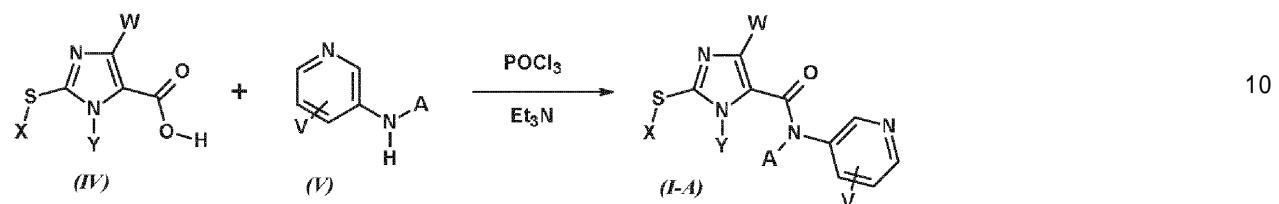
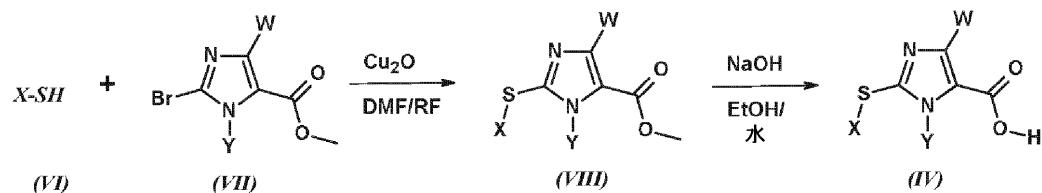


【0042】

調製方法B

50

【化 1 0】

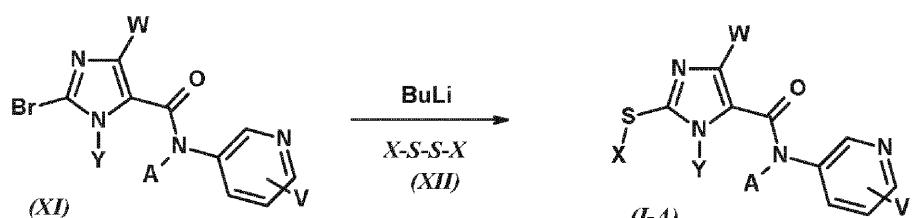
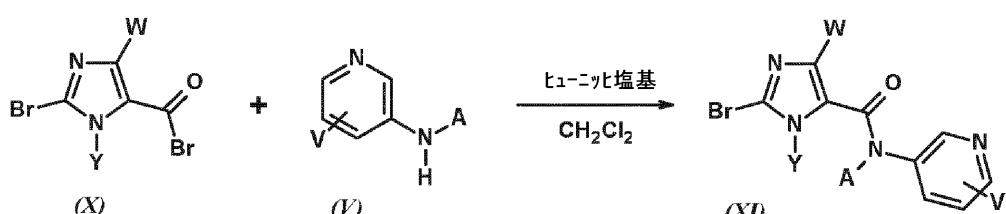
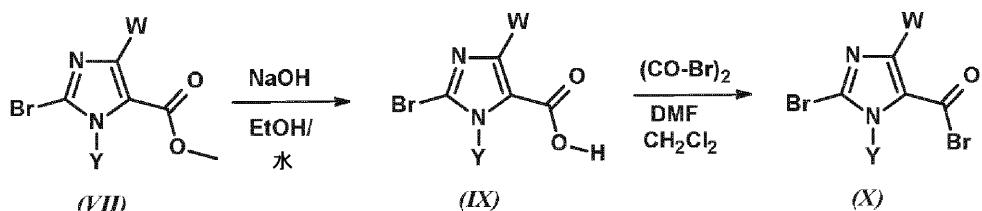


DMF = デメチルホルムアミド ; Et₃N = トリエチルアミン

[0 0 4 3]

調製方法 C - 1

【化 1 1 】

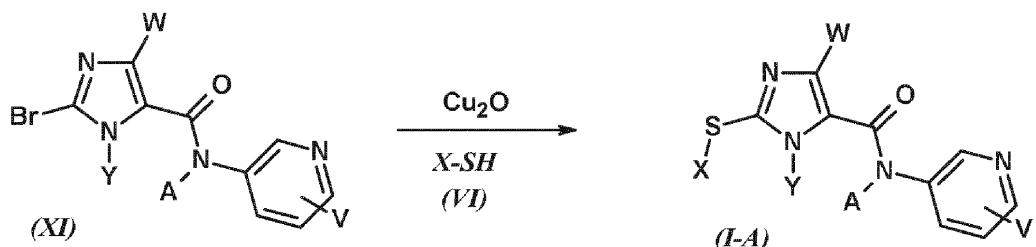


BuLi は n -ブチルリチウム、ヒュニッヒ塩基 = N,N-ジイソブチルエチルアミン

[0 0 4 4]

調製方法 C - 2

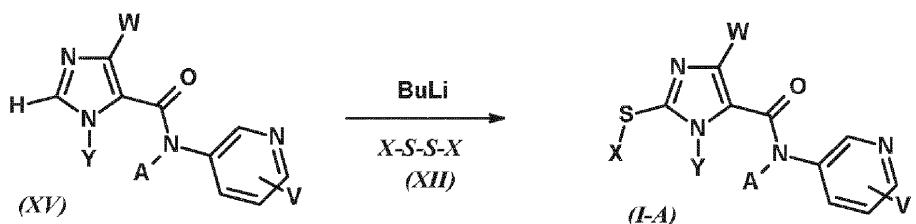
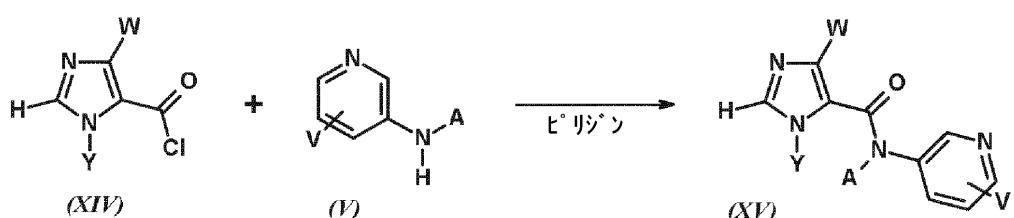
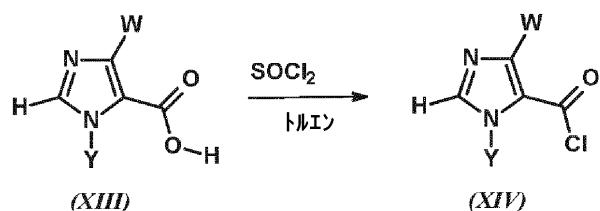
【化12】



【0045】

調製方法D

【化13】



BuLi = n-ブチリリチウム

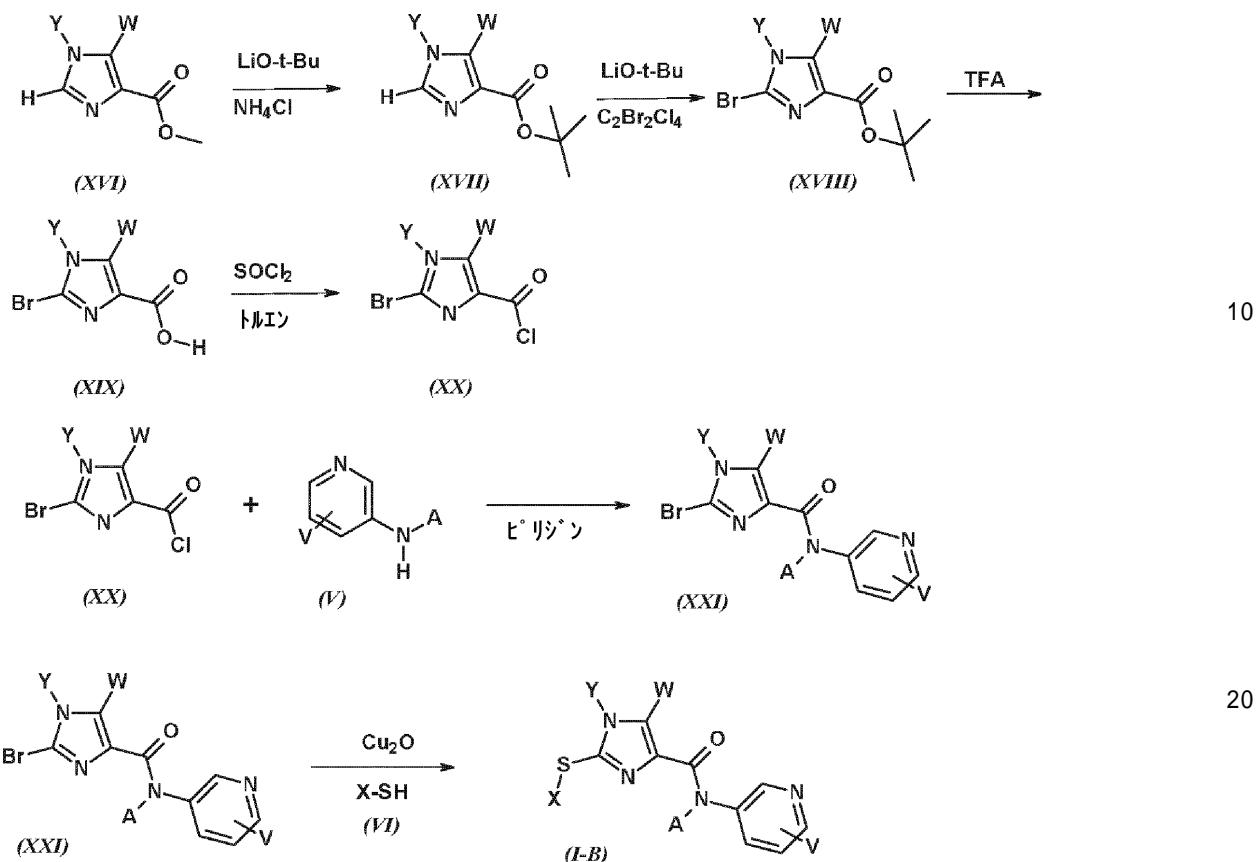
【0046】

式(I-B)で表される化合物は、例えば、下記スキームにおいて示されているように、調製方法Eに準じて、合成することができる。

【0047】

調製方法E

【化14】



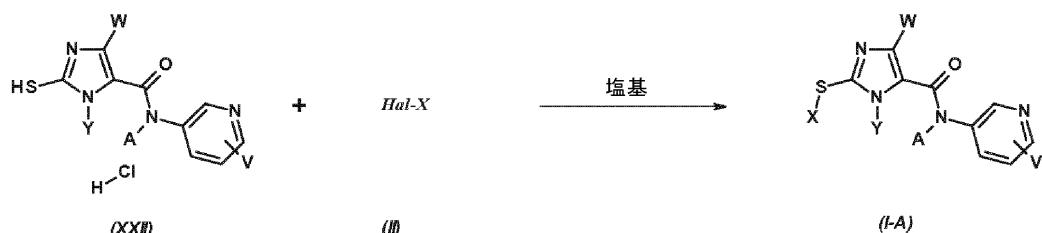
LiO-t-Bu = リチウムtert-ブチルキド、 TFA = トリフルオロ酢酸

【0048】

調製方法F

【化15】

30

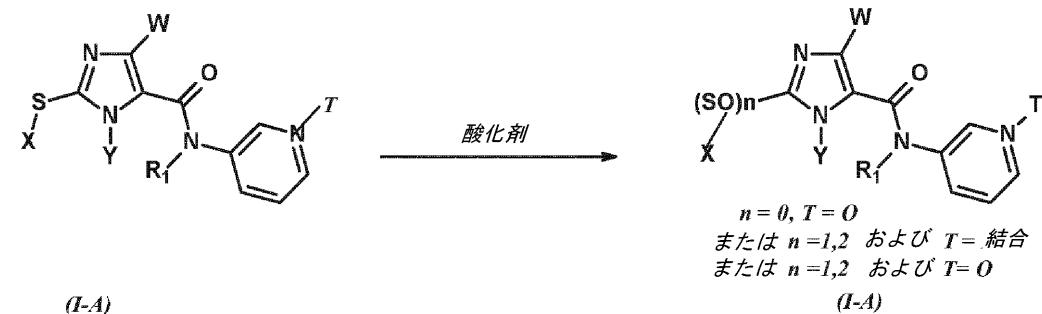


【0049】

調製方法G

【化16】

40



【0050】

50

調製方法 A に必要な式 (II) で表されるハロゲン化物（例えば、ハロゲン化アルキル、ハロゲン化ヘタリールなど）の大部分は、市販されている製品であるか、又は、有機化学において概して知られている調製方法で調製することができる。

【0051】

調製方法 A に必要な式 (III) で表される 2 - メルカプトイミダゾリルカルボン酸エステルは、市販されているか、又は、例えば、文献（例えば、H. Rapoport et al., *Synthesis* 1988, 10, 767 - 771）から知られている調製方法で、調製することができる。

【0052】

調製方法 B に必要な式 (V) で表されるチオール（例えば、アルキルメルカプタン、チオフェノール、メルカプトピリミジン、メルカプトピリジン）の大部分は、市販されているか、又は、有機化学において概して知られている調製方法で調製することができる。 10

【0053】

調製方法 B 及び調製方法 C に必要な式 (VI) で表される 2 - プロモイミダゾリルカルボン酸エステルは、市販されているか、又は、例えば、文献（例えば、H. Rapoport et al., *Synthesis* 1988, 10, 767 - 771）から知られている調製方法で、調製することができる。

【0054】

調製方法 C - 1 及び調製方法 D に必要な式 (XI) で表されるジチオエーテル（例えば、ピリミジルジチオエーテル、ピリジルジチオエーテルなど）の大部分は、市販されているか、又は、有機化学（例えば、Zeynizadeh, Behzad, *Journal of Chemical Research - Part S*, 2002, 564 - 566; Rutgerswerke Aktiengesellschaft patent: US 4256892A1, 1981; Kesavan, Venkitasamy, Bonnet-Delpon, Daniele, Begue, Jean-Pierre *Synthesis* 2000, 2, 223 - 225）において概して知られている調製方法で、調製することができる。 20

【0055】

調製方法 D に必要な式 (XII) で表されるイミダゾリルカルボン酸は、市販されているか、又は、例えば、文献（例えば、H. Rapoport et al., *Synthesis* 1988, 10, 767 - 771; BASF Aktiengesellschaft patent: US 4864030A1, 1989; Takeda Pharmaceutical Company Limited patent: EP 2530078A1, 2012; TAISHO PHARMACEUTICAL AL CO., LTD. patent: US 2012/10414A1, 2012; Subrayan Ramachandran P., Thurber Ernest L., Rasmussen Paul G., *Tetrahedron*, 1994, 50, 2641 - 2656）から知られている調製方法で、調製することができる。 30

【0056】

調製方法 E に必要な式 (XVI) で表されるイミダゾリルカルボン酸エステルは、市販されているか、又は、例えば、文献（例えば、Nunami, Yamada, Fukui, Matsumoto, *Journal of Organic Chemistry*, 1994, vol. 59, 7635 - 7642; H. Rapoport et al., *Synthesis* 1988, 10, 767 - 771）から知られている調製方法で、調製することができる。 40

【0057】

調製方法 A ~ 調製方法 E に必要な式 (V) で表される 3 - アミノピリジンは、市販されているか、又は、例えば、文献（例えば、Liu Zhen-Jiang, Vors Jean-Pierre, Gesing Ernst R. F., Bolm Ca 50

rsten, Advanced Synthesis and Catalysis, 2010, 352, 3158 - 3162; BAYER CROPSCIENCE AG patent: US2010/305124A1, 2010; Shafir Alexander, Buchwald Stephen L., Journal of the American Chemical Society, 2006, 128, 8742 - 8743) から知られている調製方法で、調製することができる。

【0058】

プロセススキームA～プロセススキームEから理解できるように、式(I-A)及び式(I-B)で表される化合物は、原則として、最後の段階におけるカップリングプロセス又はアミド化プロセスを介して得ることができる。 10

【0059】

アミド化プロセス

本発明による調製方法A～調製方法Eにおける式(I-A)で表される化合物並びに式(XI)、式(XV)及び式(XXI)で表される中間体は、文献から知られているアミド化反応を用いて合成することができるか、又は、明示的に記載されている実施例と同様にして合成することができる。

【0060】

当該アミド化段階に関して、多くの反応条件が記載されている、例えば、「G. Benzin Comprehensive Organic Synthesis, 1st Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, pp. 381 - 417」、「P.D. Bailey et al. in Comprehensive Organic Functional Group Transformation, 1st Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, pp. 257 - 308」、及び、「R.C. Larock in Comprehensive Organic Transformations, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pp. 1929 - 1994」。これらの反応の一部は、中間体カルボニルクロリド類を介して進行し、その中間体カルボニルクロリドは、単離された形態で使用することができるか、又は、その場で生成された形態で使用することができる。 30

【0061】

該アミド化反応は、場合により縮合剤の存在下で、場合により酸受容体の存在下で、及び、場合により溶媒の存在下で、実施する。

【0062】

有用な縮合剤は、そのようなアミド化反応に関して典型的に使用可能な全ての縮合剤である。例としては、以下のものを挙げることができる：活性化剤、例えば、ホスゲン、三塩化リン、オキシ塩化リン、塩化オキサリル、臭化オキサリル又は塩化チオニル；カルボジイミド、例えば、N,N'-ジシクロヘキシリカルボジイミド(DCC)及び1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド(EDCI)、又は、別の慣習的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、N,N'-カルボニルジイミダゾール、2-クロロピリジン-1-メトヨージド(2-chloropyridine 1-methiodide)(ムカイヤマ試薬)、2-エトキシ-N-エトキシカルボニル-1,2-ジヒドロキノリン(EDQ)、トリフェニルホスフィン/四塩化炭素、ブロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(BROP)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)トリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(BOP)、N,N,N',N'-ビス(テトラメチレン)クロロウロニウムテトラフルオロボレート、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート(HBTU)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-ビス(テトラメチレン)ウロニウムヘキサフルオロホスフェート、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル) 40

10

20

30

40

50

-N₂N₂N₂'N₂' - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N₂N₂N₂'N₂' - ビス(テトラメチレン)ウロニウムテトラフルオロボレート、O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N₂N₂N₂'N₂' - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HATU)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBT)、及び、4-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-4-メチルモルホリニウム塩 (DMT.MM)、通常、塩化物として入手可能である。これらの試薬は、独立して使用し得るか、又は、組合せて使用することができる。

【0063】

適切な酸受容体は、慣習的な全ての無機塩基又は有機塩基、例えば、有機アミン、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン又はN,N-ジメチルアミノピリジン、アルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム；アルカリ金属重炭酸塩、例えば、重炭酸ナトリウム又は重炭酸カリウムなどである。本発明による調製方法におけるアミド化反応は、場合により、適切な反応助剤（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、又は、N,N-ジメチルアミノピリジン）の存在下で、実施する。適切な溶媒又は希釈剤は、全ての不活性有機溶媒、例えば、以下のものである：脂肪族又は芳香族の炭化水素類（例えば、石油エーテル、トルエン、シクロヘキサン）、ハロゲン化炭化水素類（例えば、クロロトルエン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン）、エーテル類（例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン）、エステル類（例えば、酢酸エチル、又は、酢酸メチル）、ニトロ炭化水素類（例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロベンゼン）、ニトリル類（例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、ベンゾニトリル）、アミド類（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミド）、及び、さらに、ジメチルスルホキシド、又は、水、又は、上記溶媒の混合物。

【0064】

式(III)で表される化合物を調製するために、混合無水物を使用することも可能である(c.f. J. Am. Chem. Soc. 1967, 5012)。この調製方法において、クロロギ酸エステル、例えば、クロロギ酸メチル、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル及びクロロギ酸イソプロピルなどを使用することができる。同様に、この目的のために、ジエチルアセチルクロリド、トリメチルアセチルクロリド及び類似した化合物を使用することができる。

【0065】

カップリングプロセス変形態様A

本発明による調製方法B、調製方法C-2及び調製方法Eにおける式(I-A)及び式(I-B)で表される化合物並びに式(VIII)で表される中間体は、文献から知られているカップリング反応を用いて合成することができるか、又は、明示的に記載されている実施例と同様にして合成することができる。

【0066】

遷移金属が触媒するカップリングプロセス変形態様Aに関して、多くの反応条件が記載されている、例えば、J. P. Dickens et al., Journal of Organic Chemistry, 1981, 46, 1781 ff.; Harr Molly S., Presley Alice L., Thora renzen Atli, Synlett, nb. 10, (1999), p. 1579-158; Babu S. Ganesh, Karvembu, Tetrahedron Letters, 2013, vol. 54, # 13 p. 1677-1680。

【0067】

10

20

30

40

50

該カップリング反応は、場合により遷移金属の存在下で、場合により酸受容体の存在下で、及び、場合により溶媒の存在下で、実施する。

【0068】

溶媒の例としては、以下のものを挙げることができる：N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、トルエン。

【0069】

金属化合物の例としては、以下のものを挙げることができる：酸化Cu(I)、酸化Cu(II)、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)。

【0070】

塩基の例としては、以下のものを挙げることができる：水酸化カリウム、カリウムtert-ブトキシド、トリエチルアミン、さらに、慣習的な全ての無機塩基又は有機塩基、例えば、有機アミン、例えば、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ビリジン又はN,N-ジメチルアミノビリジン、アルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム；アルカリ金属重炭酸塩、例えば、重炭酸ナトリウム又は重炭酸カリウム。

【0071】

カップリングプロセス変形態様B

本発明による調製方法C-1及び調製方法Dにおける式(I-A)で表される化合物は、文献から知られているカップリング反応を用いて合成することができるか、又は、明示的に記載されている実施例と同様にして合成することができる。

【0072】

リチウム化カップリングプロセス変形態様Bに関して、多くの反応条件が記載されている、例えば、Hoechst Aktiengesellschaft, patent : US 4 764 624 A1, 1988; Ohta, Yamamoto, Kawasaki, Yamashita, Katsuma, Nasako, Kobayashi, Ogawa, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, vol. 40, # 10 p. 2681-2685; Hara Kenji, Iwahashi Keiji, Kanamori Yoshikazu, Naito Satoshi, Takakusagi Satoru, Uosaki Kohei, Sawamura Masaya, Chemistry Letters, 2006, vol. 35, # 8 p. 870-871。

【0073】

溶媒の例としては、以下のものを挙げることができる：ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン。

【0074】

リチウム化剤の例としては、以下のものを挙げることができる：n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミン、リチウムtert-ブトキシド。

【0075】

最初のリチウム化段階に関する反応温度は、場合により、-100と-75の間である。

【0076】

方法及び使用

本発明は、さらに、動物有害生物を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式(I)で表される化合物を動物有害生物及び/又はそれらの生息環境に作用させる。動物有害生物の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質(material)の保護において、実施される。好ましくは、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法は、上記方法から除外される。

【0077】

本発明は、さらに、有害生物防除剤としての、特に、作物保護剤としての、式(Ⅰ)で表される化合物の使用にも関する。

【0078】

本出願に関連して、用語「有害生物防除剤(pesticide)」は、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

【0079】

式(Ⅰ)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する動物有害生物、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、有害生物防除剤として使用することができる。それらは、通常の感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、さらに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記有害生物としては、以下のものを挙げることができる：

節足動物門の有害生物、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(*Acarus spp.*)、例えば、アカルス・シロ(*Acarus siro*)、アケリア・クコ(*Aceria kuko*)、アケリア・シェルドニ(*Aceria sheldoni*)、アクロプス属種(*Aculops spp.*)、アクルス属種(*Aculus spp.*)、例えば、アクルス・フォクケウイ(*Aculus fockeui*)、アクルス・シュレクテンダリ(*Aculus schlechtendali*)、アンブリオンマ属種(*Amblyomma spp.*)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(*Amphitetranychus viennensis*)、アルガス属種(*Argas spp.*)、ボオフィルス属種(*Boophilus spp.*)、ブレビパルpus属種(*Brevipalpus spp.*)、例えば、ブレビパルpus・ホエニシス(*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビア・グラミヌム(*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオサ(*Bryobia praetiosa*)、セントルロイデス属種(*Centruroides spp.*)、コリオプテス属種(*Chorioptes spp.*)、デルマニスス・ガリナエ(*Dermayssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・pteronyssinus)、デルマトファゴイデス・ファリナエ(*Dermatophagooides fariniae*)、デルマセントル属種(*Dermacentor spp.*)、エオテトラニクス属種(*Eotetranychus spp.*)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(*Eotetranychus hicorniae*)、エピトリメルス・ピリ(*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種(*Eutetranychus spp.*)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ(*Eutetranychus banksi*)、エリオフィエス属種(*Eriophyes spp.*)、例えば、エリオフィエス・ピリ(*Eriophyes pyri*)、グリシファグス・ドメスチクス(*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル(*Halotydeus destructor*)、ヘミタロソネムス属種(*Hemitarsonemus spp.*)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス(*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス(*Polyphagotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属種(*Hyalomma spp.*)、イキソデス属種(*Ixodes spp.*)、ラトロデクトス属種(*Latrodectus spp.*)、ロキソスケレス属種(*Loxosceles spp.*)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス(*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種(*Nuphera spp.*)、オリゴニクス属種(*Oligonychus spp.*)、例えば、

10

20

30

40

50

オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros spp.*)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus spp.*)、パノニクス属種 (*Panonychus spp.*)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptesoleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes spp.*)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus spp.*)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus spp.*)、サルコプテス属種 (*Sarcopotes spp.*)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus spp.*)、ステネオタルソネムス・スピニキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus spp.*)、例えば、タルソネムス・コンフスス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズス (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus spp.*)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanicus*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis spp.*)、バサテス・リコペルシシ (*Vasates lycopersici*)；
 ムカデ綱 (*Chilopoda*)の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus spp.*)、スクチゲラ属種 (*Scutigera spp.*)；
 トビムシ目 (*Collembola*)又はトビムシ綱の、例えば、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)；スミンツルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*)；
 ヤスデ綱 (*Diplopoda*)の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)；
 昆虫綱 (*Insecta*)の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*)の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlorora spp.*)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta spp.*)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スペラ・ロンギバルバ (*Supella longipalpa*)；

10

20

30

40

50

コウチュウ目(*Coleoptera*)の、例えば、アカリソマ・ビタツム(*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス(*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種(*Adoretus spp.*)、アエチナ・ツミダ(*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ(*Agelastica alni*)、アグリオテス属種(*Agriotes spp.*)、例えば、アグリオテス・リンネアツス(*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス(*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス(*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス(*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・ブンクタツム(*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種(*Anoplophora spp.*)、アントノムス属種(*Anthonomus spp.*)、例えば、アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種(*Anthrenus spp.*)、アピオン属種(*Apion spp.*)、アポゴニア属種(*Apogonia spp.*)、アトマリア属種(*Atomaria spp.*)、例えば、アトマリア・リネアル(*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種(*Attagenus spp.*)、バリス・カエルレセンス(*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクツス(*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種(*Bruchus spp.*)、例えば、ブルクス・ピソルム(*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス(*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種(*Cassida spp.*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種(*Ceutorrhynchus spp.*)、例えば、セウトリンクス・アシミリス(*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス(*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ(*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種(*Chaetocnema spp.*)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス(*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ(*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチバ(*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス(*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種(*Conoderus spp.*)、コスマポリテス属種(*Cosmopolites spp.*)、例えば、コスマポリテス・ソルジズス(*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ(*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種(*Ctenicera spp.*)、クルクリオ属種(*Curculio spp.*)、例えば、クルクリオ・カリエ(*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス(*Curculio caryatipes*)、クルクリオ・オブツスス(*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ(*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス(*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス(*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ(*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ(*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種(*Cylindrocopturus spp.*)、シリンドロコプツルス・アドスペルスス(*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ(*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種(*Dermestes spp.*)、ジアプロチカ属種(*Diabrotica spp.*)、例えば、ジアプロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ジアプロチカ・バルベリ(*Diabrotica barberi*)、ジアプロチカ・ウンデシムブンクタタ・ホワルジ(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアプロチカ・ウンデシムブンクタタ・ウンデシムブンクタタ(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ビルギフ
10
20
30
40
50

エラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeae*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis spp.*)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属種 (*Diloboderus spp.*)、エピカエルス属種 (*Epicauerus spp.*)、エピラクナ属種 (*Epilachna spp.*)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna vari vestis*)、エピトリキス属種 (*Epitrix spp.*)、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリキス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリキス・ヒルチベンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcri nita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus spp.*)、ギビウム・ブシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニキス属種 (*Heteronyx spp.*)、ヒラモルファ・エレガヌス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモスス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus spp.*)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンギイネア (*Lachnostenra consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius spp.*)、レマ属種 (*Lema spp.*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコブテラ属種 (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus spp.*) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes spp.*)、リキスス属種 (*Lixus spp.*)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、ルペロデス属種 (*Luperodes spp.*)、リクトス属種 (*Lyctus spp.*)、メガセリス属種 (*Megascelis spp.*)、メラノツス属種 (*Melanotus spp.*)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種 (*Melolontha spp.*)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus spp.*)、モノカムス属種 (*Monochamus spp.*)、ナウパクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobia spp.*)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella spp.*)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorrhynchus spp.*)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorrhynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorrhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorrhynchus 50*

ovatus)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス(*Otiorrhynchus rugosostriatus*)、オチオリンクス・スルカツス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オウレマ属種(*Oulema spp.*)、オウレマ・オリザエ(*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジュンクンダ(*Oxyconia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種(*Phyllophaga spp.*)、フィロファガ・ヘレリ(*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種(*Phyllotreta spp.*)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ(*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・ブシラ(*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ(*Phyllotreta ramosa*)、10 フィロトレタ・ストリオラタ(*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ(*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種(*Premnotrypes spp.*)、プロステファヌス・トルンカツス(*Prosternus truncatus*)、ブシリオデス属種(*Psylliodes spp.*)、例えば、ブシリオデス・アフィニス(*Psylliodes affinis*)、ブシリオデス・クリソセファラ(*Psylliodes chrysoccephala*)、ブシリオデス・ブンクツラタ(*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属種(*Ptinus spp.*)、リゾビウス・ベントラリス(*Rhizobius ventralis*)、リゾペルタ・ドミニカ(*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属種(*Rhynchophorus spp.*)、リンコホルス・フェルギネウス(*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム(*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス(*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種(*Sitophilus spp.*)、例えば、シトフィルス・グラナリウス(*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス(*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ(*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス(*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種(*Sphenophorus spp.*)、ステゴビウム・パニセウム(*Stegobium paniceum*)、30 ステルネクス属種(*Sternechus spp.*)、例えば、ステルネクス・パルダツス(*Sternechus paludatus*)、シムフイレテス属種(*Symplyctes spp.*)、タニメクス属種(*Tanymecus spp.*)、例えば、タニメクス・ジラチコリス(*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジクス(*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス(*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル(*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス(*Tenebriooides mauretanicus*)、トリボリウム属種(*Tribolium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス(*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム(*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム(*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種(*Trogoderma spp.*)、チキウス属種(*Tychius spp.*)、キシロトレクス属種(*Xylotrichus spp.*)、ザブルス属種(*Zabrus spp.*)、40 例えば、ザブルス・テネブリオイデス(*Zabrus tenebrioides*)；

ハサミムシ目(*Dermoptera*)の、例えば、アニソラビス・マリチメ(*Anisolabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア(*Forficula auricularia*)、ラビズラ・リパリア(*Labidura riparia*)；

ハエ目(*Diptera*)の、50 例えば、アエデス属種(*Aedes spp.*)、例えば、アエデス・アエギプチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス

(*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza spp.*)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia spp.*)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera spp.*)、例えば、バクトロセラ・クカルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratit is capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus spp.*)、クリソミア属種 (*Chrysomya spp.*)、クリソップス属種 (*Chrysops spp.*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya spp.*)、コンタリニア属種 (*Contarinia spp.*)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrívora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia triticici*)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex spp.*)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides spp.*)、クリセタ属種 (*Culiset a spp.*)、クテレブラ属種 (*Cuterebra spp.*)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura spp.*)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia spp.*)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila spp.*)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus spp.*)、エウレイア・ヘラクレイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia spp.*)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus spp.*)、グロッシナ属種 (*Glossina spp.*)、ハエマトボタ属種 (*Haematopota spp.*)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia spp.*)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya spp.*)、ヒッポドスカ属種 (*Hippobosca spp.*)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma spp.*)、リリオミザ属種 (*Liriomyza spp.*)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種 (*Lucilia spp.*)、

例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia spp.*)、マンソニア属種 (*Mansonia spp.*)、ムスカ属種 (*Musca spp.*)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus spp.*)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルスス属種 (*Paratanytarsus spp.*)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミイア属種 (*Pegomya spp.*)、例えば、ペゴミイア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミイア・ヒオシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus spp.*)、ホルビア属種 (*Phorbia spp.*)、ホルミア属種 (*Phormia spp.*)、ピオフィラ・カセイ (*Piophila casei*)、プラチパレア・ポエシロブテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジェクトロシス属種 (*Prodiplosis spp.*)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga spp.*)、シムリウム属種 (*Simulium spp.*)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys spp.*)、タバヌス属種 (*Tabanus spp.*)、テタノポプス属種 (*Tetanops spp.*)、チプラ属種 (*Tipula spp.*)、例えば、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チプラ・シムブレキス (*Tipula simplex*)、トキソトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*)；

カメムシ目 (Hemiptera) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciae baileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatooides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種 (*Acyrthosiphon spp.*)、例えば、アシルトシポン・ピスム (*Acyrthosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia spp.*)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia spp.*)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena spp.*)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus spp.*)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコスス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca spp.*)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca biguttula*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella spp.*)、例えば、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アファノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis spp.*)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (50

Aphis glycines)、アphis・ゴシビイ(*Aphis gossypii*)、アphis・ヘデラエ(*Aphis hederae*)、アphis・イリノイセンシス(*Aphis illinoiensis*)、アphis・ミドレトニ(*Aphis middletoni*)、アphis・ナスツルチイ(*Aphis nasturtii*)、アphis・ネリイ(*Aphis nerii*)、アphis・ポミ(*Aphis pomi*)、アphis・スピラエコラ(*Aphis spiraecola*)、アphis・ビブルニフィラ(*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス(*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種(*Arytainilla spp.*)、アスピジエラ属種(*Aspidiella spp.*)、アスピジオツス属種(*Aspidiotus spp.*)、例えば、アスピジオツス・ネリイ(*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種(*Atanus spp.*)、アウラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ(*Bemisia tabaci*)、ブラストブシラ・オッシデンタリス(*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ(*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種(*Brachycolus spp.*)、ブレビコリネ・ブラシカエ(*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属種(*Cacopsylla spp.*)、例えば、カコブシラ・ピリコラ(*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ(*Callipypona marginata*)、カブリニア属種(*Capulinia spp.*)、カルネオセファラ・フルギダ(*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ(*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ(*Cercopidae*)、セロプラステス属種(*Ceroplastes spp.*)、カエトシホン・フラガエホリイ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス(*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ(*Chlorita onuki*)、コンドラクリス・ロセア(*Condracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ(*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム(*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス(*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ(*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ(*Coccomytilus halli*)、コックス属種(*Coccus spp.*)、例えば、コックス・ヘスペリズム(*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス(*Coccus longulus*)、コックス・ブセウドマグノリアルム(*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス(*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種(*Cryptoneossa spp.*)、クテナリタイナ属種(*Ctenarytaina spp.*)、ダルブルス属種(*Dalbulus spp.*)、ジアレウロデス・キテンデニ(*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ(*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ(*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種(*Diaspis spp.*)、ジウラフィス属種(*Diuraphis spp.*)、ドロシカ属種(*Drosicha spp.*)、ジサフィス属種(*Dysaphis spp.*)、例えば、ジサフィス・アピイホリア(*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ(*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種(*Dysmicoccus spp.*)、エムポアスカ属種(*Empoasca spp.*)、例えば、エムポアスカ・アブルブタ(*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ(*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ(*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ(*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種(*E 10*

20

30

40

50

Eriosoma spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム(*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム(*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ(*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種(*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種(*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種(*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ビロバツス(*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種(*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種(*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ(*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ(*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種(*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ(*Heteropsylla cubana*)
、ヘテロプシラ・スピヌロサ(*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ(*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス(*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・ブルニ(*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種(*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブルカシ(*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種(*Idiocerus* spp.)、イジオスコpus属種(*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス(*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種(*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ(*Lecanium corni*) (=パルテノレカニウム・コルニ(*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種(*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ(*Lepidosaphes ulmi*)、リパphis・エリシミ(*Lipaphis erysimi*)、口ホレウカスピス・ジャボニカ(*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・デリカツラ(*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種(*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ(*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ(*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス(*Macrosteles facifrons*)、マハナルバ属種(*Mahanarva* spp.)、メラナphis・サッカリ(*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種(*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・ブルイノサ(*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム(*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス(*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス(*Monelliopsis pecanis*)、ミズス属種(*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカラニクス(*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ(*Myzus ligustris*)、ミズス・オルナツス(*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ(*Myzus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ(*Nasonovia ribisnigri*)、ネオマスケリア属種(*Neomaskellia* spp.)、ネホテッキス属種(*Nephrotettix* spp.)、例えば、ネホテッキス・シンクチセプス(*Nephrotettix cincticeps*)、ネホテッキス・ニグロピクトス(*Nephrotettix nigropictus*)、ネチゴニセラ・スペクトラ(*Nettigonidilla spectra*)、ニラバルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種(*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ(*Orthozia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス(*Oxya chinensis*)、パキブシラ属種(*Pachyphyllea* spp.)、パラベミシア・ミリカエ(*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種(*Paratriozza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ(*Paratriozza cockerelli*)、パルラトリア属種(*Parlatoria* spp.)、
10
20
30
40
50

ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポブリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス

・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera deusta*)¹⁰ *tatrica*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドブシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストッキ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、²⁰ プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla malii*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、ブテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ブルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyriola* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、³⁰ 例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオスス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、⁴⁰ 例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、⁵⁰ 例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクタ (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌス (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミヌム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus articulatus*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)

、テトラゴノセフェラ属種(*Tetragonocephela* spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ(*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種(*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属種(*Toxoptera* spp.)、例えば、トキソプテラ・アウランチイ(*Toxoptera aurantii*)、トキソプテラ・シトリシズス(*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バポラリオルム(*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種(*Triozza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ(*Triozza diospyri*)、チフロシバ属種(*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属種(*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ(*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種(*Zygina* spp.);
10

カメムシ亜目(Heteroptera)の、例えば、アエリア属種(*Aelia* spp.)、アナサ・トリスチス(*Anasa tristis*)、アンテスキオプシス属種(*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種(*Boisea* spp.)、ブリスス属種(*Blissus* spp.)、カロコリス属種(*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ(*Campylomma livida*)、カベレリウス属種(*Cavelerius* spp.)、シメキス属種(*Cimex* spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクトス(*Cimex adjunctus*)、シメキス・ヘミプテルス(*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクトラリウス(*Cimex lectularius*)、シメキス・ピロセルス(*Cimex pilosellus*)、コラリア属種(*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス(*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス(*Dasyurus piperis*)、ジケロプス・フルカツス(*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェッチ(*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種(*Dysdercus* spp.)、エウスキツツス属種(*Euschistus* spp.)、例えば、エウスキツツス・ヘロス(*Euschistus heros*)、エウスキツツス・セルブス(*Euschistus servus*)、エウスキツツス・トリスチグムス(*Euschistus tristigmus*)、エウスキツツス・バリオラリウス(*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属種(*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種(*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス(*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種(*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス(*Horcius nobilis*)、レプトコリサ属種(*Leptocoris* spp.)、レプトコリサ・バリコルニス(*Leptocoris varicornis*)、レプトグロスス・オッシデンタリス(*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロpus(*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種(*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブルヌス(*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種(*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリスス(*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス(*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス(*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス(*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア(*Megacopta cribraria*)、ミリダエ(Miridae)、モナロニオン・アトラツム(*Monalonion atratum*)、ネザラ属種(*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ(*Nezara viridula*)、ニシウス属種(*Nysius* spp.)、オエバルス属種(*Oebalus* spp.)、ペントミダエ(Pentomidae)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種(*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・グイルジニイ(*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種(*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア(*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種(*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス(*Sahlbergella singularis*)、ス
10
20
30
40
50

カプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora spp.*)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca spp.*)、トリアトマ属種 (*Triatoma spp.*)；

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex spp.*)、アタリア属種 (*Athalia spp.*)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta spp.*)、カムボノツス属種 (*Camponotus spp.*)、ドリコベスプラ属種 (*Dolichovespula spp.*)、ジプリオン属種 (*Diprion spp.*)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムバ属種 (*Hoplocampa spp.*)、例えば、ホプロカムバ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムバ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius spp.*)、リネピテマ・フミレ (*Linepithema humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina spp.*)、パラベスプラ属種 (*Paravespula spp.*)、プラギオレピス属種 (*Plagiolepis spp.*)、シレキス属種 (*Sirex spp.*)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma spp.*)、テクノミルメキス・アルビペス (*Technomyrmex albipes*)、ウロセルス属種 (*Urocerus spp.*)、ベスピ属種 (*Vespa spp.*)、例えば、ベスピ・クラブロ (*Vespa crabro*)、ワスマンニア・アウロ punctata (*Wasmannia auropunctata*)、キセリス属種 (*Xeris spp.*)；

ワラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)；

シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes spp.*)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes spp.*)、インシシテルメス属種 (*Incisitermes spp.*)、カロテルメス属種 (*Kalotermes spp.*)、ミクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes spp.*)、オドントテルメス属種 (*Odontotermes spp.*)、ポロテルメス属種 (*Porotermes spp.*)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes spp.*)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*)；

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes spp.*)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis spp.*)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama spp.*)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Ameloi transitiella*)、アナルシア属種 (*Anarsia spp.*)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia spp.*)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroploce spp.*)、アウトグラファ属種 (50)

Autographa spp.)、バラトラ・ブラシカエ(Barathra brassicae)、ブラストデクナ・アトラ(Blastodacna attra)、ボルボ・シンナラ(Borbo cinnara)、ブックラトリキス・ツルベリエラ(Bucculatrix thurberella)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、ブッセオラ属種(Busseola spp.)、カコエシア属種(Cacoecia spp.)、カロプチリア・ティボラ(Caloptilia theivora)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、カルポカブサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonella)、カルポシナ・ニポンensis(Carposina nipponensis)、ケイマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、キロ属種(Chilo spp.)
 10
 、例え、キロ・プレジャデルス(Chilo plejadelus)、キロ・スプレッサリス(Chilo suppressalis)、コレウチス・パリアナ(Choreutis pariana)、コリストネウラ属種(Choristoneura spp.)、クリソディキス・カルシテス(Chrysodeixis chalcites)、クリシア・アムビグエラ(Clytia ambigua)、クナファロセルス属種(Cnaphalocerus spp.)、クナファロクロシス・メジナリス(Cnaphalocrocis medinalis)、クネファシア属種(Cneophasia spp.)、コノポモルファ属種(Conopomorpha spp.)、コノトラケルス属種(Conotrachelus spp.)、コピタルシア属種(Copitarsia spp.)、シジア属種(Cydia spp.)、例え、シジア・ニグリカナ(Cydia nigricana)、シジア・ポモネラ(Cydia pomonella)、ダラカ・ノクトイデス(Dalaca noctuides)、ジアファニア属種(Diaphania spp.)、ジパロプシス属種(Diparopsis spp.)、ジアトラエア・サッカラリス(Diatraea sacccharalis)、エアリアス属種(Earias spp.)、エクジトロファ・アウランチウム(Ecdytolopha aurantium)、エラスモバルプス・リグノセルス(Elasmopalpus lignosellus)、エルダナ・サッカリナ(Eldana saccharina)、エフェスチア属種(Ephestia spp.)、例え、エフェスチア・エルテラ(Ephestia elutella)、エフェスチア・クエーニエラ(Ephestia kuehniella)、エピノチア属種(Epinotia spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ(Epiphya postvittana)、エランニス属種(Erannis spp.)、エルスコビエラ・ムスクラナ(Erschovia musculana)、エチエラ属種(Etiella spp.)、エウドシマ属種(Eudocima spp.)、エウリア属種(Eulia spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ(Eupoecilia ambigua)、エウプロクチス属種(Euproctis spp.)、例え、エウプロクチス・クリソロエア(Euproctis chrysorrhoea)、エウキソア属種(Euxoa spp.)、フェルチア属種(Feltia spp.)、ガレリア・メロネラ(Galleria mellonella)、グラシリリア属種(Gracillaria spp.)、グラホリタ属種(Grapholita spp.)、例え、グラホリタ・モレスタ(Grapholita molesta)、グラホリタ・ブルニボラ(Grapholita prunivora)、ヘジレプタ属種(Hedylepta spp.)、ヘリコベルバ属種(Helicoverpa spp.)、例え、ヘリコベルバ・アルミゲラ(Helicoverpa armigera)、ヘリコベルバ・ゼア(Helicoverpa zea)、ヘリオチス属種(Heliocthis spp.)、例え、ヘリオチス・ビレセンス(Heliocthis virescens)、ホフマンノフィラ・ブセウドスプレテラ(Hofmannophila pseudosprerella)、ホモエオソマ属種(Homo eosoma spp.)、ホモナ属種(Homona spp.)、ヒポノメウタ・パデラ(Hyponomeuta padella)、カキボリア・フラボファシアタ(K

10

20

30

40

50

akivoria flavofasciata)、ランピデス属種 (Lampides spp.)、ラフィグマ属種 (Laphygma spp.)、ラスペイレシア・モレスタ (Laspeyresia molesta)、レウシノデス・オルボナリス (Leucinodes orbonalis)、レウコプテラ属種 (Leucoptera spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (Leucoptera coffeella)、リトコレチス属種 (Lithocolletis spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (Lithocolletis blancaardella)、リトファネ・アンテナタ (Lithophane antennata)、ロベシア属種 (Lobesia spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (Lobesia botrana)、ロキサグロチス・アルビコスタ (Loxagrotis albicosta)、リマントリア属種 (Lymantria spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (Lymantria dispar)、リオネチア属種 (Lyonetia spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (Lyonetia clerkella)、マラコソマ・ネウストリア (Malacosoma neustria)、マルカ・テスツラリス (Maruca testulalis)、マメストラ・ブラシカエ (Mamestra brassicae)、メラニチス・レダ (Melanitis leda)、モシス属種 (Mocis spp.)、モノピス・オブビエラ (Monopis obviella)、ミチムナ・セパラタ (Mythimna separata)、ネマポゴン・クロアセルス (Nemapogon cloaceellus)、ニムフラ属種 (Nymphula spp.)、オイケチクス属種 (Oiketicus spp.)、オンフィサ属種 (Omphisa spp.)、オペロフテラ属種 (Operophtera spp.)、オリア属種 (Oria spp.)、オルタガ属種 (Orthaga spp.)、オストリニア属種 (Ostrinia spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (Ostrinia nubilalis)、オウレマ・メラノpus (Oulema melanopus)、オウレマ・オリザエ (Oulema oryzae)、パノリス・フランメア (Panolis flammea)、バルナラ属種 (Parnara spp.)、ペクチノホラ属種 (Pectinophora spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (Pectinophora gossypiella)、ペリレウコプテラ属種 (Perileucoptera spp.)、フトリマエア属種 (Phthorimaea spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (Phthorimaea operculella)、フィロクニスチス・シトレラ (Phylloconistis citrella)、フィロノリクトル属種 (Phyllonorycter spp.)、例えば、フィロノリクトル・ブランカルデラ (Phyllonorycter blancaardella)、フィロノリクトル・クラタエゲラ (Phyllonorycter crataegella)、ピエリス属種 (Pieris spp.)、例えば、ピエリス・ラバエ (Pieris rapae)、プラチノタ・スツルタナ (Platynota stultana)、プロジェア・インテルブンクテラ (Plodia interpunctella)、プルシア属種 (Plusia spp.)、プルテラ・キシロステラ (Plutella xylostella) (= プルテラ・マクリペンニス (Plutella maculipennis))、プライス属種 (Prays spp.)、プロデニア属種 (Prodenia spp.)、プロトバルセ属種 (Protoparce spp.)、プセウダレチア属種 (Pseudalatia unipuncta)、例えば、プセウダレチア・ウニ puncta (Pseudalatia unipuncta)、プセウドプルシア・インクルデンス (Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ヌビラリス (Pyrausta nubilalis)、ラキブルシア・ヌ (Rachiplusia nu)、スコエノビウス属種 (Schoenobius spp.)、例えば、スコエノビウス・ビブンクチフェル (Schoenobius bipunctifer)、シルポファガ属種 (Scirpophaga spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ (Scirpophaga innotata)、スコチア・セゲツム (Scotia segetum) 50

、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スバルガノチス属種 (*Sparaganothis* spp.)、スピドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スピドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スピドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スピドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スピドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ステノマ属種 (*Stenoma* spp.)、ストモブテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetella*)、トリコブルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)
)

、例えば、トリコブルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.)；
20

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプラス属種 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプラス属種 (*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプラス・デバスター (*Melanoplus devastator*)、パラトランチクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*)；
30

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia* spp.)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp.)、フィロキセラ・バスター (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス。ブビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.)；

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus* spp.)、リポセリス属種 (*Liposcelis* spp.)；

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノブシラ・ケオビス (*Xenopsylla cheopis*)；
40

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリップス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリップス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリップス・レエウウェニ (*Chaitanaphothrips leeuwenii*)、ドレパンオトリップス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリップス・フラベンス (*En-*
50

neothrips flavens)、フランクリニエラ属種(*Frankliniella la spp.*)、例えば、フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ(*Frankliniella la schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ(*Frankliniella la tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ(*Frankliniella vaccinii*)、フランクリニエラ・ウェリアムシ(*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリップス属種(*Haplothrips spp.*)、ヘリオトリップス属種(*Heliothrips spp.*)、ヘルシノトリップス・フェモラリス(*Hercinothrips femoralis*)、リピホロトリップス・クルエンタツス(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリップス属種(*Scirtothrips spp.*)、タエニノトリップス・カルダモミ(*Taeniothrips cardamomi*)、トリップス属種(*Thrips spp.*)、例えば、トリップス・パルミ(*Thrips palmi*)、トリップス・タバシ(*Thrips tabaci*)；

シミ目(*Zygentoma*(=*Thysanura*))の、例えば、クテノレピスマ属種(*Ctenolepisma spp.*)、レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)、レスピモデス・インクイリヌス(*Lepismodes inquilinus*)、テルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*)；

コムカデ綱(*Sympyla*)の、例えば、スクチゲレラ属種(*Scutigeraella spp.*)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ(*Scutigerella immaculata*)；

軟体動物門(*Mollusca*)の有害生物、特に、ニマイガイ綱(*Bivalvia*)の、例えば、ドレイセナ属種(*Dreissena spp.*)；及び、さらに、

マキガイ綱(*Gastropoda*)の、例えば、アリオン属種(*Arion spp.*)、例えば、アリオン・アテル・ルフス(*Arion ater rufus*)、ビオムファラリア属種(*Biomphalaria spp.*)、ブリヌス属種(*Bulinus spp.*)、デロセラス属種(*Derooceras spp.*)、例えば、デロセラス・ラエベ(*Derooceras laeve*)、ガルバ属種(*Galba spp.*)、リムナエア属種(*Limnaea spp.*)、オンコメラニア属種(*Oncomeania spp.*)、ポマセア属種(*Pomacea spp.*)、スクシニア属種(*Succinea spp.*)；

扁形動物門(*Platyhelminthes*)及び線形動物門(*Nematoda*)の、動物及びヒトの寄生生物、例えば、アエルロストロンギルス属種(*Aelurost strongylus spp.*)、アミドストムム属種(*Amidostomum spp.*)、アンシロストマ属種(*Ancylostoma spp.*)、アンギオストロンギルス属種(*Angiostrongylus spp.*)、アニサキス属種(*Anisakis spp.*)、アノプロセファラ属種(*Anoplocephala spp.*)、アスカリス属種(*Ascaris spp.*)、アスカリジア属種(*Ascaridia spp.*)、バイリサスカリス属種(*Baylisascaris spp.*)、ブルギア属種(*Brugia spp.*)、ブノストムム属種(*Bunostomum spp.*)、カピラリア属種(*Capillaria spp.*)、カベルチア属種(*Chabertia spp.*)、クロノルキス属種(*Clonorchis spp.*)、コオペリア属種(*Cooperia spp.*)、クレノソマ属種(*Crenosoma spp.*)、シアトストマ属種(*Cyathostoma spp.*)、ジクロコエリウム属種(*Dicrocoelium spp.*)、ジクチオカウルス属種(*Dictyocaulus spp.*)、ジフィロボトリウム属種(*Diphyllobothrium spp.*)、ジフィリジウム属種(*Dipylidium spp.*)、ジロフィリア(*Dirofilaria spp.*)、ドラクンクルス属種(*Dracuncul*

10

20

30

40

50

us spp.)、エキノコックス属種(*Echinococcus* spp.)、エキノストマ属種(*Echinostoma* spp.)、エンテロビウス属種(*Enterobius* spp.)、エウコレウス属種(*Eucoleus* spp.)、ファシオラ属種(*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種(*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種(*Fasciolopsis* spp.)、フィラロイデス属種(*Filaroides* spp.)、ゴンギロネマ属種(*Gongylonema* spp.)、ギロダクチルス属種(*Gyrodactylus* spp.)、ハブロネマ属種(*Habronema* spp.)、ハエモンクス属種(*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種(*Heligmosomoides* spp.)、ヘテラキス属種(*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス属種(*Hyemenolepis* spp.)、ヒオストロンギルス属種(*Hyostrongylus* spp.)、リトモソイデス属種(*Litomosoides* spp.)、ロア属種(*Loa* spp.)、メタストロンギルス属種(*Metastrongylus* spp.)、メトルキス属種(*Metorchis* spp.)、メソセストイデス属種(*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種(*Moniezia* spp.)、ムエリエリウス属種(*Muellerius* spp.)、ネカトル属種(*Necator* spp.)、ネマトジルス属種(*Nematodirus* spp.)、ニッポストロンギルス属種(*Nipponstrongylus* spp.)、オエソファゴストムム属種(*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種(*Ollulanus* spp.)、オンコセルカ属種(*Onchocerca* spp.)、オピストルキス属種(*Opisthorchis* spp.)、オスレルス属種(*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種(*Ostertagia* spp.)、オキシウリス属種(*Oxyuris* spp.)、パラカピラリア属種(*Paracapillaria* spp.)、パラゴニムス属種(*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種(*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種(*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種(*Parascaris* spp.)、パッサルルス属種(*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種(*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種(*Schistosoma* spp.)、セタリア属種(*Setaria* spp.)、スピロセルカ属種(*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種(*Stephanofilaria* spp.)、ステファンurus属種(*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種(*Strongyloides* spp.)、ストロンギルス属種(*Strongylus* spp.)、シンガムス属種(*Syngamus* spp.)、タニア属種(*Taenia* spp.)、テラドルサギア属種(*Teladorsagia* spp.)、テラジア属種(*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種(*Toxascaris* spp.)、トキソカラ属種(*Toxocara* spp.)、トリキネラ属種(*Trichinella* spp.)、トリコビルハルジア属種(*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種(*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス属種(*Trichuris* spp.)、ウンシナリア属種(*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種(*Wuchereria* spp.);

線形動物門(Nematoda)の植物有害生物(即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種(*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ(*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種(*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ(*Anguina tritici*)、アフェレンコイデス属種(*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフェレンコイデス・アラキジス(*Aphelenchoides arachidis*)、アフェレンコイデス・フラガリアエ(*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種(*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラ

シリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウザツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus spp.*)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・スキシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus spp.*)、例えば、カコパウルス・ペストיס (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella spp.*)、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)¹⁰、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemooides spp.*)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemooides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemooides onense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemooides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus spp.*)、例えば、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus spp.*)、グロボデラ属種 (*Globodera spp.*)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemooides spp.*)、ヘミシクリオホラ属種 (*Hemicycliophora spp.*)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera spp.*)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus spp.*)、ロンギドルス属種 (*Longidorus spp.*)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloiodogyne spp.*)、例えば、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloiodogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloiodogyne fallax*)、メロイドギネ・ハプラ (*Meloiodogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloiodogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinemama spp.*)、ナコップス属種 (*Nacobbus spp.*)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus spp.*)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus spp.*)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus spp.*)⁴⁰、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus spp.*)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus spp.*)、プシレンクス属種 (*Psilenchus spp.*)、ブンクトデラ属種 (*Punctodera spp.*)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcicus spp.*)、ラドホルス属種 (*Radopholus spp.*)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus spp.*)、ロチレンクス属種 (*R*⁵⁰

otylenchus spp.)、スクテロネマ属種(*Scutellonema spp.*)、スバングイナ属種(*Subanguina spp.*)、トリコドルス属種(*Trichodorus spp.*)、例えば、トリコドルス・オブツス(*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチブス(*Trichodorus primitivus*)、チレンクルス属種(*Tylenchulus spp.*)、チレンコリンクス属種(*Tylenchorhynchus spp.*)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス(*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種(*Tylenchulus spp.*)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス(*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種(*Xiphinema spp.*)、例えば、キシフィネマ・インデキス(*Xiphinema index*)。 10

【0080】

さらにまた、原生動物亜界(*Protozoa*)の、コクシジウム目(*Coccidia*)、例えば、エイメリア属種(*Eimeria spp.*)なども防除することができる。

【0081】

線虫類

本発明に関連して、用語「線虫類」は、線形動物門の全ての種を包含し、ここで、特に植物若しくは菌類に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種(例えば、アフェレンキダ目(*Aphelenchida*)、メロイドギネ目(*Meloidogyne*)、チレンキダ目(*Tylenchida*)などの目の各種)、又は、ヒト及び動物に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種(例えば、トリキネリダ目(*Trichinellida*)、チレンキダ目(*Tylenchida*)、ラブジチダ目(*Rhabditida*)及びスピルリダ目(*Spirurida*)などの目の各種)を包含し、及び、さらに、別の寄生性の蠕虫類も包含する。 20

【0082】

作物保護における殺線虫剤は、本明細書中に記載されている場合、線虫類を防除することが可能である。

【0083】

用語「線虫類を防除する(*controlling nematodes*)」は、線虫類を殺すことを意味するか、又は、線虫類の発育若しくは成長を妨げるか若しくは遅延させることを意味するか、又は、線虫類が植物組織の中に侵入するか若しくは植物組織から吸汁することを妨げるか若しくは遅延させることを意味する。 30

【0084】

ここで、当該化合物の効力は、式(I)で表される化合物で処理された植物若しくは植物の部分又は処理された土壌と処理されていない植物若しくは植物の部分又は処理されていない土壌(100%)の間で、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根1本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類の運動性を比較することによって、確認される。好ましくは、処理されていない植物、植物の部分又は処理されていない土壌と比較して、25~50%の低減が達成され、さらに好ましくは、51~79%の低減が達成され、及び、最も好ましくは、完全に殺すこと、又は、線虫類の発育及び成長の完全な防止(80%~100%低減)が達成される。本明細書中に記載されている「線虫類の防除」は、線虫類の増殖(シスト及び/又は卵の発育)を防除することも包含する。式(I)で表される化合物は、さらによくまた、植物又は動物の健康を維持するために使用することも可能であり、及び、線虫類を治療的に、予防的に又は全身的に防除するために使用することも可能である。 40

【0085】

当業者は、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根1本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類 50

の運動性について確認する方法を知っている。

【0086】

式(I)で表される化合物を使用することで、植物を健康な状態に維持することが可能であり、また、式(I)で表される化合物を使用することは、線虫類に起因する損傷を低減させること及び収穫量を増大させることも包含する。

【0087】

本発明に関連して、用語「線虫類」は、植物に対して損傷を引き起こす全ての線虫を包含する植物線虫類を示している。植物線虫類は、植物寄生性線虫類及び土壤介在性線虫類を包含する。植物寄生性線虫類としては、以下のものを挙げることができる：外部寄生虫、例えば、キシフィネマ属種(*Xiphinema spp.*)、ロンギドルス属種(*Longidorus spp.*)及びトリコドルス属種(*Trichodorus spp.*)；半寄生虫、例えば、チレンクルス属種(*Tylenchulus spp.*)；移動性内部寄生虫(*migratory endoparasite*)、例えば、プラチレンクス属種(*Pratylenchus spp.*)、ラドホルス属種(*Radopholus spp.*)及びスクテロネマ属種(*Scutellonema spp.*)；非移動性寄生虫(*non-migratory parasite*)、例えば、ヘテロデラ属種(*Heterodera spp.*)、グロボデラ属種(*Globodera spp.*)及びメロイドギネ属種(*Meloidogyne spp.*)；及び、さらに、茎及び葉内部寄生虫、例えば、ジチレンクス属種(*Ditylenchus spp.*)、アフェレンコイデス属種(*Aphelenchoides spp.*)及びヒルシュマニエラ属種(*Hirschmanniella spp.*)。特に有害な根寄生性土壤線虫類は、例えば、ヘテロデラ属(*Heterodera*)若しくはグロボデラ属(*Globodera*)のシスト形成性線虫類、及び/又は、メロイドギネ属(*Meloidogyne*)のネコブ線虫類などである。これらの属の有害な種は、例えば、以下のものである：メロイドギネ・インコグニタ(*Meloidogyne incognita*)、ヘテロデラ・グリシネス(*Heterodera glycines*)（ダイズシストセンチュウ）、グロボデラ・パリダ(*Globodera pallida*)及びグロボデラ・ロストキエンシス(*Globodera rostochiensis*)（ジャガイモシストセンチュウ）；これらの種は、本明細書中に記載されている化合物で効果的に防除される。しかしながら、本明細書中に記載されている化合物を使用することは、決してこれらの属又は種に限定されるものではなく、さらに、他の線虫類にも同様に及ぶ。

【0088】

植物線虫類としては、例えば、以下のものを挙げができる：アグレンクス・アグリコラ(*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリチシ(*Anguina tritici*)、アフェレンコイデス・アラキジス(*Aphelenchoides arachidis*)、アフェレンコイデス・フラガリア(*Aphelenchoides fragariae*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、アフェレンコイデス属種(*Aphelenchoides spp.*)、ベロノライムス・グラシリス(*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ(*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス・ココフィルス(*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス(*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス(*Bursaphelenchus xylophilus*)、及び、ブルサフェレンクス属種(*Bursaphelenchus spp.*)、カコパウルス・ペスチス(*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ・クルバタ(*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス(*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ(*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム(*Criconemella russiaum*)、クリコネメラ・キセノプラキス(*Criconemella xenoplax*)（＝メソクリコ

10

20

30

40

50

ネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、及び、クリコネメラ属種 (*Criconemella spp.*)、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemooides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemooides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemooides ornatum*)、及び、クリコネモイデス属種 (*Criconemooides spp.*)、ジチレンクス・デストルクトル (*Ditylenchus destructor*)、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ジチレンクス・ミセリオファグス (*Ditylenchus myceliophagus*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus spp.*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*) (=ヘテロデラ・パリダ (*Heterodera pallida*))、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*) (ジャガイモシストセンチュウ)、グロボデラ・ソラナセアルム (*Globodera solanacearum*)、グロボデラ・タバクム (*Globodera tabacum*)、グロボデラ・ビルギニア (*Globodera virginia*)、並びに、非移動性シスト形成性寄生虫、グロボデラ属種 (*Globodera spp.*)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、ヘリコチレンクス・エリトリネ (*Helicotylenchus erythrine*)、ヘリコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*)、ヘリコチレンクス・ナンヌス (*Helicotylenchus nannus*)、ヘリコチレンクス・プセウドロブスツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、及び、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、ヘミクリコネモイデス (*Hemicriconoides*)、ヘミシクリオホラ・アレナリア (*Hemicycliophora arenaria*)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ (*Hemicycliophora nudata*)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・クルシフェラエ (*Heterodera cruciferae*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heterodera glycines*) (ダイズシストセンチュウ)、ヘテロデラ・オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・スカハクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*)、並びに、非移動性シスト形成性線虫、ヘテロデラ属種 (*Heterodera spp.*)、ヒルシュマニエラ・グラシリス (*Hirschmanniella gracilis*)、ヒルシュマニエラ・オリザエ (*Hirschmanniella oryzae*)、ヒルシュマニエラ・スピニカウダタ (*Hirschmanniella spinicaudata*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ヒルシュマニエラ属種、ホプロライムス・アエギプチイ (*Hoplolaimus aegypti*)、ホプロライムス・カリホルニクス (*Hoplolaimus californicus*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス (*Hoplolaimus indicus*)、ホプロライムス・マグニスチルス (*Hoplolaimus magnistylus*)、ホプロライムス・パラロブスツス (*Hoplolaimus pararobustus*)、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、ロンギドルス・ブレビアンヌラツス (*Longidorus breviannulatus*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*)、ロンギドルス・ラエビカピタツス (*Longidorus laevicapitatus*)、ロンギドルス・ビネアコラ (*Longidorus vineacola*)、及び、外部寄生虫、ロンギドルス属種 (*Lon*

gidorus spp.)、メロイドギネ・アクロネア (*Meloiodogyne acronea*)、メロイドギネ・アフリカナ (*Meloiodogyne africana*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・アレナリア・タメシ (*Meloiodogyne arenaria thamesi*)、メロイドギネ・アルチエラ (*Meloiodogyne artiella*)、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloiodogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・コフェイコラ (*Meloiodogyne coffeicola*)、メロイドギネ・エチオピカ (*Meloiodogyne ethiopica*)、メロイドギネ・エキシグア (*Meloiodogyne exigua*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloiodogyne fallax*)、メロイドギネ・グラミニコラ (*Meloiodogyne graminicola*)、メロイドギネ・グラミニス (*Meloiodogyne graminis*)、メロイドギネ・ハプラ (*Meloiodogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloiodogyne incognita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloiodogyne javanica*)、メロイドギネ・キクイエンシス (*Meloiodogyne kikuyensis*)、メロイドギネ・ミノル (*Meloiodogyne minor*)、メロイドギネ・ナアシ (*Meloiodogyne naasi*)、メロイドギネ・パラナエンシス (*Meloiodogyne paranaensis*)、メロイドギネ・タメシ (*Meloiodogyne thamesi*)、及び、非移動性寄生虫、メロイドギネ属種 (*Meloiodogyne spp.*)、メロイネマ属種 (*Meloinem spp.*)、ナコブス・アベルランス (*Nacobbus aberrans*)、ネオチレンクス・ビギシ (*Neotylenchus vigissi*)、パラフェレンクス・プセウドパリエチヌス (*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、パラトリコドルス・アリウス (*Paratrichodorus allius*)、パラトリコドルス・ロバツス (*Paratrichodorus lobatus*)、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドルス・ナヌス (*Paratrichodorus nanus*)、パラトリコドルス・ポロスス (*Paratrichodorus porosus*)、パラトリコドルス・テレス (*Paratrichodorus teres*)、及び、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus spp.*)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylenchus hamatus*)、パラチレンクス・ミヌツス (*Paratylenchus minutus*)、パラチレンクス・プロジェクトス (*Paratylenchus projectus*)、及び、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus spp.*)、プラチレンクス・アギリス (*Pratylenchus agilis*)、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アンジヌス (*Pratylenchus andinus*)、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・セレアリス (*Pratylenchus cerealis*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・デラトレイ (*Pratylenchus delattrei*)、プラチレンクス・ギイビカウダツス (*Pratylenchus giibbicauatus*)、プラチレンクス・ゴオディイ (*Pratylenchus goodeyi*)、プラチレンクス・ハマツス (*Pratylenchus hamatus*)、プラチレンクス・ヘキシンシスス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ロオシ (*Pratylenchus loosi*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・スクリブネリ 50

ンクス・テレス (*Pratylenchus teres*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、及び、移動性内部寄生虫、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、プセウドハレンクス・ミヌツス (*Pseudohalenchus minutus*)、プシレンクス・マグニデンス (*Psilenchus magnidens*)、プシレンクス・ツミズス (*Psilenchus tumidus*)、ブンクトデラ・カルコエンシス (*Punctodera chalcoensis*)、キニスルシウス・アクツス (*Quinisulcius acutus*)、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、移動性内部寄生虫、ラドホルス属種 (*Radopholus spp.*)、ロチレンクルス・ボレアリス (*Rotylenchulus borealis*)、ロチレンクルス・パルブス (*Rotylenchulus parvus*)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)、及び、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus spp.*)、ロチレンクス・ラウレンチヌス (*Rotylenchus laurentinus*)、ロチレンクス・マクロドラツス (*Rotylenchus macrodoratus*)、ロチレンクス・ロブスツス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・ウニホルミス (*Rotylenchus uniformis*)、及び、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、スクテロネマ・ブラジス (*Scutellonema bradyi*)、スクテロネマ・クラトリカウダツム (*Scutellonema clathricaudatum*)、及び、移動性内部寄生虫、スクテロネマ属種 (*Scutellonema spp.*)、スパンゲイナ・ラジシオラ (*Subanguina radicola*)、テチレンクス・ニコチアナエ (*Tetylenchus nicotianae*)、トリコドルス・シリンドリクス (*Trichodorus cylindricus*)、トリコドルス・ミノル (*Trichodorus minor*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、トリコドルス・プロキシムス (*Trichodorus proximus*)、トリコドルス・シミリス (*Trichodorus similis*)、トリコドルス・スペルスス (*Trichodorus sparsus*)、及び、外部寄生虫、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・ブラシカエ (*Tylenchorhynchus brassicae*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ジギタツス (*Tylenchorhynchus digitatus*)、チレンコリンクス・エブリエンシス (*Tylenchorhynchus ebriensis*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズス (*Tylenchorhynchus nudus*)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、及び、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、及び、半寄生虫、チレンクルス属種 (*Tylenchulus app.*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・ブレビコレ (*Xiphinema brevicolle*)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツム (*Xiphinema dimorphicaudatum*)、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)、及び、外部寄生虫、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)。

10

20

30

40

50

【0089】

防除するために式(I)で表される化合物を使用することが可能な線虫類としては、以下のものを挙げることができる：メロイドギネ属の線虫、例えば、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloiodogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ(*Meloiodogyne javanica*)、キタネコブセンチュウ(*Meloiodogyne hapla*)、及び、アレナリアネコブセンチュウ(*Meloiodogyne arenaria*)；ジチレンクス属の線虫、例えば、イモグサレセンチュウ(*Ditylenchus destructor*)、及び、ナミクキセンチュウ(*Ditylenchus dipsaci*)；プラチレンクス属の線虫、例えば、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、キクネグサレセンチュウ(*Pratylenchus fallax*)、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、チャネグサレセンチュウ(*Pratylenchus loossi*)、及び、クルミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus vulnus*)；グロボデラ属の線虫、例えば、ジャガイモシストセンチュウ(*yellow potato cyst nematode*)(*Globodera rostochiensis*)、及び、ジャガイモシストセンチュウ(*white potato cyst nematode*)(*Globodera pallida*)；ヘテロデラ属の線虫、例えば、ダイズシストセンチュウ(*Heterodera glycines*)、及び、テンサイシストセンチュウ(*beet cyst eelworm*)(*Heterodera schachtii*)；アフェレンコイデス属の線虫、例えば、イネシングガレセンチュウ(*Aphelenchoides besseyi*)、ハガレセンチュウ(*chrysanthemum nematode*)(*Aphelenchoides ritzemabosi*)、及び、イチゴセンチュウ(*Aphelenchoides fragariae*)；アフェレンクス属の線虫、例えば、ニセネグサレセンチュウ(*fungivorous nematode*)(*Aphelelchus avenae*)；ラドホルス属の線虫、例えば、ネモグリセンチュウ(*burrowing nematode*)(*Radopholus similis*)；チレンクルス属の線虫、例えば、ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)；ロチレンクルス属の線虫、例えば、ニセフクロセンチュウ(*Rotylenchulus reniformis*)；樹木に生息する線虫、例えば、マツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)、及び、赤輪病センチュウ(*red ring nematode*)(*Bursaphelenchus cocoophilus*)；など。

【0090】

保護するために式(I)で表される化合物を使用することが可能な植物としては、例えば、以下のものを挙げができる：禾穀類(例えば、イネ、オオムギ、コムギ、ライムギ、エンバク、トウモロコシなど)、マメ類(ダイズ、アズキ、ソラマメ、エンドウマメ、ピーナッツなど)、果樹／果実(リンゴ、柑橘類、ナシ、ブドウの木、モモ、ウメ、サクラ、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴなど)、野菜種(キャベツ、トマト、ホウレンソウ、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、コショウなど)、根菜類(ニンジン、ジャガイモ、サツマイモ、ラディッシュ、レンコン、カブなど)、工業原料用の植物(ワタ、アサ、カジノキ、ミツマタ、アブラナ、ビート、ホップ、サトウキビ、テンサイ、オリーブ、ゴム、ヤシ、コーヒー、タバコ、チャなど)、ウリ科植物(カボチャ、キュウリ、スイカ、メロンなど)、牧草類(カモガヤ、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファなど)、芝草類(コウシュンシバ(*mascarene grass*)、ベントグラスなど)、香料植物など(ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、コショウ、ショウガなど)、及び、花卉類(キク、バラ、ランなど)。

【0091】

式(I)で表される化合物は、コーヒーの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している：プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus br*

achyurus)、プラチレンクス・コフェアエ(*Pratylenchus coffeeae*)、メロイドギネ・エキシグア(*Meloiodogyne exigua*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・コフェイコラ(*Meloiodogyne coffeicola*)、ヘリコチレンクス属種(*Helicotylenchus spp.*)、及び、さらに、メロイドギネ・パラナエンシス(*Meloiodogyne paranaensis*)、ロチレンクス属種(*Rotylenchus spp.*)、キシフィネマ属種(*Xiphinema spp.*)、チレンコリンクス属種(*Tylenchorhynchus spp.*)、及び、スクテロネマ属種(*Scutellonema spp.*)。

【0092】

10

式(I)で表される化合物は、ジャガイモの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス(*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・スクリブネリ(*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ペネトランス(*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・コフェアエ(*Pratylenchus coffeeae*)、ジチレンクス・ジブサシ(*Ditylenchus dipsaci*)、及び、さらに、プラチレンクス・アレニ(*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アンジヌス(*Pratylenchus andinus*)、プラチレンクス・セレアリス(*Pratylenchus cerealis*)、プラチレンクス・クレナツス(*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・ヘキシンシスス(*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ロオシ(*Pratylenchus loosi*)、プラチレンクス・ネグレクトス(*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・テレス(*Pratylenchus teres*)、プラチレンクス・トルネイ(*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス(*Pratylenchus vulnus*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)、トリコドルス・シリンドリクス(*Trichodorus cylindricus*)、トリコドルス・プリミチブス(*Trichodorus primitivus*)、トリコドルス・プロキシムス(*Trichodorus proximus*)、トリコドルス・シミリス(*Trichodorus similis*)、トリコドルス・スバルスス(*Trichodorus sparsus*)、パラトリコドルス・ミノル(*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドルス・アリウス(*Paratrichodorus allius*)、パラトリコドルス・ナヌス(*Paratrichodorus nanus*)、パラトリコドルス・テレス(*Paratrichodorus teres*)、メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・ファラキス(*Meloiodogyne fallax*)、メロイドギネ・ハプラ(*Meloiodogyne hapla*)、メロイドギネ・タメシ(*Meloiodogyne thamesi*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・キトウォオジ(*Meloiodogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、ナコブス・アベルランス(*Nacobbus aberrans*)、グロボデラ・ロストキエンシス(*Globodera rostochiensis*)、グロボデラ・パリダ(*Globodera pallida*)、ジチレンクス・デストルクトル(*Ditylenchus destructor*)、ラドホルス・シミリス(*Radopholus similis*)、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)、ネオチレンクス・ビギシ(*Neotylenchus vigissi*)、パラフェレンクス・プセウドパリエチヌス(*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、アフェレンコイデス・フラガリアエ(*Aphelenchoides fragariae*)、及び、メロイネマ

20

30

40

50

属種 (*Meloinema* spp.)。

【0093】

式(I)で表される化合物は、トマトの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している：メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハプラ(*Meloiodogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、プラチレンクス・ペネトランス(*Pratylenchus penetrans*)、及び、さらに、プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ(*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・スクリブネリ(*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ブルヌス(*Pratylenchus vulnus*)、パラトリコドルス・ミノル(*Paratrichodorus minor*)、メロイドギネ・エキシグア(*Meloiodogyne exigua*)、ナコブス・アベルランス(*Nacobbus aberrans*)、グロボデラ・ソラナセアルム(*Globodera solanacearum*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス(*Dolichodorus heterocephalus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)。 10

【0094】

式(I)で表される化合物は、ウリ科植物の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している：メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハプラ(*Meloiodogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)、及び、プラチレンクス・トルネイ(*Pratylenchus thorpei*)。 20

【0095】

式(I)で表される化合物は、ワタの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している：ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、ホプロライムス・コルムブス(*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス(*Hoplolaimus galeatus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)。 30

【0096】

式(I)で表される化合物は、トウモロコシの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している：ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)、パラトリコドルス・ミノル(*Paratrichodorus minor*)、及び、さらに、プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・デラトレイ(*Pratylenchus delatrei*)、プラチレンクス・ヘキシンシスス(*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ペネトランス(*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ゼアエ(*Pratylenchus zeae*)、(ベロノライムス・グラシリス(*Belonolaimus gracilis*))、ベロノライムス・ノルトニ(*Belonolaimus nortonii*)、ロンギドルス・ブレビアンヌラツス(*Longidorus brevianulus*)、メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・アレナリア・タメシ(*Meloiodogyne arenaria thamesi*)、メロイドギネ・グラミニス(*Meloiodogyne graminis*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*) 40 50

、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloiodogyne incognita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloiodogyne javanica*)、メロイドギネ・ナアシ (*Meloiodogyne naasi*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*)、 punctodera chalcoensis)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ホプロライムス・アエギブチイ (*Hoplolaimus aegyptii*)、ホプロライムス・マグニスチルス (*Hoplolaimus magnistylus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス (*Hoplolaimus indicus*)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、ヘリコチレンクス・プセウドロブスツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス・ボレアリス (*Rotylenchulus borealis*)、ロチレンクルス・パルブス (*Rotylenchulus parvus*)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズス (*Tylenchorhynchus nudus*)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、キニスルシウス・アクツス (*Quinisulcius acutus*)、パラチレンクス・ミニツス (*Paratylenchus minutus*)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフェレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、スパングイナ・ラジシオラ (*Subanguina radicicola*)。

【0097】

式(I)で表される化合物は、ダイズの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・プラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heterodera glycines*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、及び、さらに、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・ヘキシンシスス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アギリス (*Pratylenchus agilis*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus*

10

20

30

40

50

hus vulnus)、(ベロノライムス・グラシリス(*Belonolaimus gracilis*))、メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、メロイドギネ・ハプラ(*Meloiodogyne hapla*)、ホプロライムス・コルムブス(*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス(*Hoplolaimus galeatus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)。

【0098】

式(I)で表される化合物は、タバコの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに
特に適している：メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、及び、さらに、プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス(*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ヘキシンシスス(*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ペネトランス(*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ネグレクツス(*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス(*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・トルネイ(*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス(*Pratylenchus vulnus*)、プラチレンクス・ゼアエ(*Pratylenchus zeae*)、ロンギドルス・エロンガツ(*Longidorus elongatus*)、パラトリコドルス・ロバツス(*Paratrichodorus lobatus*)、トリコドルス属種(*Trichodorus spp.*)、メロイドギネ・アレナリア(*Meloiodogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハプラ(*Meloiodogyne hapla*)、グロボデラ・タバクム(*Globodera tabacum*)、グロボデラ・ソラナセアルム(*Globodera solanacearum*)、グロボデラ・ビルギニアエ(*Globodera virginiae*)、ジチレンクス・ジブサシ(*Ditylenchus dipsaci*)、ロチレンクス属種(*Rotylenchus spp.*)、ヘリコチレンクス属種(*Helicotylenchus spp.*)、キシフィネマ・アメリカヌム(*Xiphinema americanum*)、クリコネメラ属種(*Criconemella spp.*)、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)、チレンコリンクス・クライトニ(*Tylenchorhynchus claytoni*)、パラチレンクス属種(*Paratylenchus spp.*)、及び、テチレンクス・ニコチアナエ(*Tetylenchus nicotianae*)。

【0099】

式(I)で表される化合物は、柑橘類の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに
特に適している：プラチレンクス・コフェアエ(*Pratylenchus coffeeae*)、及び、さらに、プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・ブルヌス(*Pratylenchus vulnus*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)、パラトリコドルス・ミノル(*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドルス・ポロスス(*Paratrichodorus porosus*)、トリコドルス(*Trichodorus*)、メロイドギネ・インコグニタ(*Meloiodogyne incognita*)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ(*Meloiodogyne incognita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloiodogyne javanica*)、ロチレンクス・マクロドラツス(*Rotylenchus macrodoratus*)、キシフィネマ・アメリカヌム(*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・ブレビコレ(*Xiphinema brevirostre*)。

hinema brevicolle)、キシフィネマ・インデキス(*Xiphinema index*)、クリコネメラ属種(*Criconemella spp.*)、ヘミクリコネモイデス(*Hemicriconemooides*)、ラドホルス・シミリス(*Radopholus similis*)、及び、ラドホルス・シトロフィルス(*Radopholus citrophilus*)、ヘミシクリオホラ・アレナリア(*Hemicyclophora arenaria*)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ(*Hemicyclophora nudata*)、及び、チレンクルス・セミペネトランス(*Tylenchulus semipenetrans*)。

【0100】

式(I)で表される化合物は、バナナの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに
特に適している： プラチレンクス・コフェアエ(*Pratylenchus coffeeae*)、ラドホルス・シミリス(*Radopholus similis*)、及び、さらには、プラチレンクス・ギイビカウダツス(*Pratylenchus giibbicaudatus*)、プラチレンクス・ロオシ(*Pratylenchus loosii*)、メロイドギネ属種(*Meloidogyne spp.*)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ(*Helicotylenchus diystera*)、及び、ロチレンクルス属種(*Rotylenchulus spp.*)。

【0101】

式(I)で表される化合物は、パイナップルの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ゼアエ(*Pratylenchus zea*)、プラチレンクス・プラテンシス(*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・プラキウルス(*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・ゴオデイイ(*Pratylenchus goodeyi*)、メロイドギネ属種(*Meloidogyne spp.*)、ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)、及び、さらに、ロンギドルス・エロンガツス(*Longidorus elongatus*)、ロンギドルス・ラエビカピタツス(*Longidorus laevicapitatus*)、トリコドルス・ブリミチブス(*Trichodorus primitivus*)、トリコドルス・ミノル(*Trichodorus minor*)、ヘテロデラ属種(*Heterodera spp.*)、ジチレンクス・ミセリオファグス(*Ditylenchus myceliophagus*)、ホプロライムス・カリホルニクス(*Hoplolaimus californicus*)、ホプロライムス・パラロブスツス(*Hoplolaimus pararobustus*)、ホプロライムス・インジクス(*Hoplolaimus indicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ(*Helicotylenchus diystera*)、ヘリコチレンクス・ナンヌス(*Helicotylenchus nannus*)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)、ヘリコチレンクス・エリトリネ(*Helicotylenchus erythrine*)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツム(*Xiphinema dimorphicaudatum*)、ラドホルス・シミリス(*Radopholus similis*)、チレンコリンクス・ジギタツス(*Tylenchorhynchus digitatus*)、チレンコリンクス・エブリエンシス(*Tylenchorhynchus ebriensis*)、パラチレンクス・ミヌツス(*Paratylenchus minutus*)、スクテロネマ・クラトリカウダツム(*Scutellonema clathricaudatum*)、スクテロネマ・ブラジス(*Scutellonema bradyss*)、ブシレンクス・ツミズス(*Psiolenchus tumidus*)、ブシレンクス・マグニデンス(*Psiolenchus magnidens*)、プセウドハレンクス・ミヌツス(*Pseudohalenchus minutus*)、クリコネモイデス・フェルニアエ(*Criconemooides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ(*Criconemooides onoens*

10

20

30

40

50

e)、及び、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)。

【0102】

式(I)で表される化合物は、ブドウの木の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)、及び、さらに、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、及び、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)。 10

【0103】

式(I)で表される化合物は、樹木作物 - 仁果類の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、及び、メロイドギネ・ハプラ (*Meloidogyne hapla*)。 20

【0104】

式(I)で表される化合物は、樹木作物 - 核果類の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハプラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylenchus hamatus*)、パラチレンクス・プロジェクトス (*Paratylenchus projectus*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)。 40

【0105】

式(I)で表される化合物は、樹木作物、サトウキビ及びイネの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella spp.*)、及び、さらに、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、パラトリコドルス属 50

種 (*Paratrichodorus* spp.)、メロイドギネ属種 (*Meloiodogyne* spp.)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、アフエレンコイデス (*Aphelenchoides* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、及び、カコパウルス・ペストス (*Cacopaurus pestis*)。

【0106】

本発明に関連して、用語「線虫類」は、ヒト又は動物に対して損傷を引き起こす線虫類も示している。

【0107】

ヒト又は動物に対して有害な特定の線虫種は、以下のものである：

ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば：トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucolaeus* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)；
クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Microrema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)；

カンセンチュウ目 (*Rhabditida*) の、例えば：ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyalocephalus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclococercus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファンurus属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globobocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ムエリウス属種 (*Muellerius* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neostrongylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、 pneumostrongylus属種 (*Pneumostrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphostrongylus* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Paraelaphostrongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostrongylus* spp.)、アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostrongylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marsilacharya* spp.)

Marshallagia spp.)、クーペリア属種(*Cooperia spp.*)、ニッポストロンギルス属種(*Nipponstrongylus spp.*)、ヘリグモソモイデス属種(*Heligmosomoides spp.*)、ネマトジルス属種(*Nematodirus spp.*)、ヒオストロンギルス属種(*Hyostrongylus spp.*)、オベリスコイデス属種(*Obeliscoides spp.*)、アミドストムム属種(*Amidostomum spp.*)、オルラヌス属種(*Ollulanus spp.*)；

センビセンチュウ目(*Spirurida*)の、例えば：オキシウリス属種(*Oxyuris spp.*)、エンテロビウス属種(*Enterobius spp.*)、パサルルス属種(*Passalurus spp.*)、シファシア属種(*Syphacia spp.*)、アスピカルリス属種(*Aspiculuris spp.*)、ヘテラキス属種(*Heterakis spp.*)、アスカリス属種(*Ascaris spp.*)、トキサスカリス属種(*Toxascaris spp.*)、トキソカラ属種(*Toxocara spp.*)、バイリサスカリス属種(*Baylisascaris spp.*)、バラスカリス属種(*Parascaris spp.*)、アニサキス属種(*Anisakis spp.*)アスカリジア属種、(*Ascaridia spp.*)、グナトストマ属種(*Gnathostoma spp.*)、フィサロプテラ属種(*Physaloptera spp.*)、テラジア属種(*Thelazia spp.*)、ゴンギロネマ属種(*Gongylonema spp.*)、ハブロネマ属種(*Habronema spp.*)、パラブロネマ属種(*Parabronema spp.*)、ドラスキア属種(*Dra-schia spp.*)、ドラクンクルス属種(*Dracunculus spp.*)、ステファノフィラリア属種(*Stephanofilaria spp.*)、パラフィラリア属種(*Parafilaria spp.*)、セタリア属種(*Setaria spp.*)、ロア属種(*Loa spp.*)、ジロフィラリア属種(*Dirofilaria spp.*)、リトモソイデス属種(*Litomosoides spp.*)、ブルギア属種(*Brugia spp.*)、ウケレリア属種(*Wuchereria spp.*)、オンコセルカ属種(*Onchocerca spp.*)、スピロセルカ属種(*Spirocerca spp.*)。

【0108】

多くの種類の既知殺線虫剤は、別の寄生性蠕虫類に対しても活性を示し、従って、ヒト及び動物における寄生虫である蠕虫類(これらは、必ずしも線虫の群に属する必要はない)を防除するために使用される。本発明は、式(I)で表される化合物の駆虫薬としての使用にも関する。病原性を有する内部寄生性蠕虫類としては、扁形動物門(*Platyhelminthes*)〔例えば、単生類(*Monogenea*)、条虫類(*Cestodes*)及び吸虫類(*Trematodes*)〕、鉤頭動物門(*Acanthocephala*)及び舌形動物門(*Pentastoma*)などがある。以下の蠕虫類を好ましいものとして挙げることができる：

単生類(*Monogenea*)：例えば：ギロダクチルス属種(*Gyrodactylus spp.*)、ダクチロギルス属種(*Dactylogyrus spp.*)、ポリストマ属種(*Polystoma spp.*)；

条虫類(*Cestodes*)：ギヨウジョウチュウ目(*Pseudophyllidea*)の、例えば：ジフィロボトリウム属種(*Diphyllobothrium spp.*)、スピロメトラ属種(*Spirometra spp.*)、シストセファルス属種(*Schistocephalus spp.*)、リグラ属種(*Ligula spp.*)、ボトリジウム属種(*Bothridium spp.*)、ジプロゴノボルス属種(*Diplogonoporus spp.*)；

エンヨウジョウチュウ目(*Cyclopphyllida*)の、例えば：メソセストイデス属種(*Mesocestoides spp.*)、アノプロセファラ属種(*Anoplocephala spp.*)、パラノプロセファラ属種(*Paranoplocephala spp.*)、モニエジア属種(*Moniezia spp.*)、チサノソマ属種(

Thysanosoma spp.)、チサニエジア属種(*Thysaniezia spp.*)、アビテリナ属種(*Avitellina spp.*)、スチレシア属種(*Stilesia spp.*)、シトタエニア属種(*Cittotaenia spp.*)、アンジラ属種(*Andyra spp.*)、ベルチエラ属種(*Bertiella spp.*)、タエニア属種(*Taenia spp.*)、エキノコックス属種(*Echinococcus spp.*)、ヒダチゲラ属種(*Hydatigera spp.*)、ダバイネア属種(*Davainea spp.*)、ライリエチナ属種(*Railletina spp.*)、ヒメノレピス属種(*Hymenolepis spp.*)、エキノレビス属種(*Echinolepis spp.*)、エキノコチレ属種(*Echinocotyle spp.*)、ジオルキス属種(*Diorchis spp.*)、ジピリジウム属種(*Dipylidium spp.*)、ジョイエウキシエラ属種(*Joyeuxielia spp.*)、ジプロピリジウム属種(*Diplopylidium spp.*)；吸虫類(*Trematodes*)：二生亜綱(*Digenaea*)の、例えば：ジプロストムム属種(*Diplostomum spp.*)、ポストジプロストムム属種(*Posthodiplostomum spp.*)、シストソマ属種(*Schistosoma spp.*)、トリコビルハルジア属種(*Trichobilharzia spp.*)、オルニトビルハルジア属種(*Ornithobilharzia spp.*)、アウストロビルハルジア属種(*Austrobilharzia spp.*)、ギガントビルハルジア属種(*Gigantobilharzia spp.*)、レウコクロリジウム属種(*Leucocloridium spp.*)、ブラキライマ属種(*Brachylaima spp.*)、エキノストマ属種(*Echinostoma spp.*)、エキノバリフィウム属種(*Echinoparyphium spp.*)、エキノカスマス属種(*Echinochasmus spp.*)、ヒポデラエウム属種(*Hypoderaeum spp.*)、ファシオラ属種(*Fasciola spp.*)、ファシオロイデス属種(*Fascioloides spp.*)、ファシオロブシス属種(*Fascioliopsis spp.*)、シクロコエルム属種(*Cyclocoelium spp.*)、チフロコエルム属種(*Typhlocoelium spp.*)、パラムフィストムム属種(*Paramphistomum spp.*)、カリコホロン属種(*Calicophoron spp.*)、コチロホロン属種(*Cotylophoron spp.*)、ギガントコチレ属種(*Gigantocotyle spp.*)、フィスコエデリウス属種(*Fischederius spp.*)、ガストロチラクス属種(*Gastrothylacus spp.*)、ノトコチルス属種(*Notocotylus spp.*)、カタトロピス属種(*Catatropis spp.*)、プラギオルキス属種(*Plagiorchis spp.*)、プロストゴニムス属種(*Prosthognimus spp.*)、ジクロコエリウム属種(*Dicrocoelium spp.*)、エウリトレマ属種(*Eurytrema spp.*)、トログロトレマ属種(*Troglotrema spp.*)、パラゴニムス属種(*Paragonimus spp.*)、コリリクルム属種(*Collyriclum spp.*)、ナノフィエツス属種(*Nanophyetus spp.*)、オピストルキス属種(*Opisthorchis spp.*)、クロノルキス属種(*Clonorchis spp.*)、メトルキス属種(*Metorchis spp.*)、ヘテロフィエス属種(*Heterophyes spp.*)、メタゴニムス属種(*Metagonimus spp.*)；
 鉤頭動物門(*Acanthocephala*)：ダイコウトウチュウ目(*Oligacanthorhynchida*)の、例えば：マクラカントリンクス属種(*Macracanthorhynchus spp.*)、プロステノルキス属種(*Prosthenorhynchis spp.*)；ポリモルフス目(*Polymorphida*)の、例えば：フィリコリス属種(*Filicollis spp.*)；サジョウコウトウチュウ目(*Moniliiformida*)の、例えば：モニリホルミス属種(*Moniliformis spp.*)；
 コウトウチュウ目(*Echinorhynchida*)の、例えば：アカントセファルス

50

属種 (*Acanthocephalus spp.*)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus spp.*)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides spp.*)；

舌形動物門 (*Pentastoma*)：シタムシ目 (*Porocephalida*) の、例えば：リングアツラ属種 (*Linguaatula spp.*)。

【0109】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式 (I) で表される化合物の投与は、既知方法で、直接行うか、又は、適切な使用形態で、経腸的に、非経口的に、経皮的に若しくは経鼻的に行う。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0110】

式 (I) で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (*microbicide*) 若しくは除雄剤 (*gametocide*) として、例えば、殺菌剤 (*fungicide*)、抗真菌剤 (*antimycotic*)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤（これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する）としても使用し得るか、又は、MLO（マイコプラズマ様生物）及びRLO（リケッチャ様生物）に対する作用薬としても使用し得る。適切な場合には、それらは、別の活性化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【0111】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物を含んでいる、有害生物防除剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる有害生物防除剤、及び／又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油（例えば、ナタネ油、ヒマワリ油）、鉱油（例えば、パラフィン油）、植物性脂肪酸アルキルエステル（例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル）、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び／又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び／又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩（例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム）、及び／又は、保持促進剤 (*retention promoter*)（例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアーポリマー）、及び／又は、湿潤剤（例えば、グリセロール）、及び／又は、肥料（例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料）を含有する。

【0112】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルション剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、及び、カプセル製剤 (capsule concentrates) (CS)； これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173 (作製元: the FAO / WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式 (I) で表される 1 種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性化合物を含有する。

【0113】

好みいのは、補助剤〔例えば、增量剤、溶媒、自発性促進剤 (spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (frost protection agent)、殺生物剤、増粘剤及び／又は他の補助剤（例えば、アジュバ

10

20

30

40

50

ント)などを含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体が生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡展(spread ing)、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

【0114】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式(I)で表される化合物を補助剤(例えば、増量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤)と混合させることにより調製する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0115】

使用する補助剤は、式(I)で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態(例えば、即時使用可能なready-to-use)有害生物防除剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品)に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び/又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

【0116】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである：芳香族及び非芳香族の炭化水素類(例えば、パラフイン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類)、アルコール類及びポリオール類(これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい)、ケトン類(例えば、アセトン、シクロヘキサン)、エステル類(これは、脂肪類及び油類を包含する)及び(ポリ)エーテル類、置換されていないアミン類及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類(例えば、N-アルキルピロリドン類)、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類(例えば、ジメチルスルホキシド)。

【0117】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に以下のものである：芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、鉛油留分、鉛油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、及び、水。

【0118】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、鉛油留分、鉛油及び植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、及び、さらに、水である。

【0119】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる：例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレー、タルク、チヨーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠍、及び/又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げができる：例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解

10

20

30

40

50

石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナツ殻、トウモロコシ及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

【0120】

液化ガスの增量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適しているのは、標準温度及び大気圧下では気体である增量剤又は担体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、及び、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0121】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである：ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び／又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

10

【0122】

該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤は、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びブルシャンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

30

【0123】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【0124】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油及び植物油であり得る。

40

【0125】

適切な場合には、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、搖変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0126】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質（例えば、スルホコハク酸ジオクチル）又は粘弾性を増大させる全ての物質（例えば、ヒドロキシプロピルグアード）

50

ポリマー)が包含される。

【0127】

本発明に関連して適切な浸透剤は、植物体内への農薬活性化合物の浸透を向上させるために一般的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、(一般には、水性の)施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性化合物のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート(coconut fatty ethoxylate)(10)若しくはイソトリデシルエトキシレート(12)、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート(15)、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

【0128】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%~98重量%の式(I)で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%~95重量%の式(I)で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%~90重量%の式(I)で表される化合物を含んでいる。

【0129】

該製剤(特に、有害生物防除剤)から調製された使用形態の中の式(I)で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまあり得る。該使用形態中の式(I)で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%~95重量%の式(I)で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%~1重量%の式(I)で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

【0130】

混合物

式(I)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤(microbiological agent)、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytotonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因(例えば、高温又は低温)に対する耐性、渴水に対する耐性又は水中若しくは土壤中の塩分の含有量の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及び根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫高を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質及び/若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、並びに/又は、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

【0131】

さらに、式(I)で表される化合物は、別の活性化合物又は情報化学物質(例えば、誘引剤、及び/又は、鳥忌避剤、及び/又は、植物活性化剤、及び/又は、成長調節剤、及び/又は、肥料)との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式(I)で表される化合物は、植物の特性(例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質)を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

【0132】

本発明による特定の実施形態では、式(I)で表される化合物は、製剤の中に、又は、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物(好ましくは、以下に記載されている化合物)と混合された状態で存在している。

【0133】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。

【0134】

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤

10

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual」, 16th ed., British Crop Protection Council 2012に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」)。

【0135】

(1) アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネット、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロポクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XM-C、及び、キシリルカルブ;又は、

20

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロベタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン。

30

【0136】

(2) GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

シクロジエン-有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン;又は、フェニルピラゾール系(フィプロール系)、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル。

40

【0137】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター/電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d-시스-トランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ビフェントリン、ビオアレスリン、ビオアレスリン s-シクロペンテニル異性体、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベータ-シペルメトリン、シータ-シペルメトリ

50

ン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン [(1 R) - トランス異性体] 、デルタメトリン、エムペントリン [(E Z) - (1 R) 異性体] 、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリシン、カデトリシン、モンフルオロトリシン、ペルメトリン、フェノトリン [(1 R) - トランス異性体] 、プラレトリシン、ピレトリシン類 (除虫菊 (p y r e t h r u m)) 、レスメトリシン、シラフルオフエン、テフルトリシン、テトラメトリシン、テトラメトリシン [(1 R) 異性体] 、トラロメトリシン、及び、トランスフルトリシン ; 又は、

DDT ; 又は、メトキシクロル。

【 0138 】

10

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) 作動薬、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミブリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロブリド、ニテンピラム、チアクロブリド、及び、チアメトキサム ; 又は、ニコチン ; 又は、
スルホキサフロル、又は、フルピラジフロン。

【 0139 】

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) のアロステリック活性化薬、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド。

【 0140 】

20

(6) 塩化物チャンネル活性化薬、例えば、
アベルメクチン系 / ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン。

【 0141 】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン、キノブレン、及び、メトブレン ; 又は、
フェノキシカルブ ; 又は、ピリプロキシフェン。

【 0142 】

(8) 作用機序が知られていないか又は特定されていない活性化合物、例えば、

30

ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル ; 又は、
クロロピクリン ; 又は、フッ化スルフリル ; 又は、ホウ砂 ; 又は、吐酒石。

【 0143 】

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、

ピメトロジン ; 又は、フロニカミド。

【 0144 】

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン ; 又は、
エトキサゾール。

【 0145 】

40

(11) 昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシリス・ツリンギエンシス・亜種・イスラエレンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p e c i e s i s r a e l e n s i s) 、バシリス・スファエリクス (B a c i l l u s s p h a e r i c u s) 、バシリス・ツリンギエンシス・亜種・アイザワイ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p e c i e s a i z a w a i) 、バシリス・ツリンギエンシス・亜種・クルスタキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p e c i e s k u r s t a k i) 、バシリス・ツリンギエンシス・亜種・テネブリオニス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p e c i e s t e n e b r i o n i s s) 、及び、B T 植物タンパク質 : C r y 1 A b 、 C r y 1 A c 、 C r y 1 F a 、 C r y 2 A b 、 m C r y 3 A

50

、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

【0146】

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン；又は、

有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、

プロパルギット；又は、テトラジホン。

【0147】

(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化デカップラー、例えば、クロルフェナビル、DNOC、及び、スルフルラミド。 10

【0148】

(14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ-ナトリウム。

【0149】

(15) キチン生合成阻害薬(タイプ0)、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン。 20

【0150】

(16) キチン生合成阻害薬(タイプ1)、例えば、ブロフェジン。

【0151】

(17) 脱皮阻害薬(特に、双翅目(即ち、双翅類)に関する)、例えば、シロマジン。

【0152】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド。

【0153】

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ。 30

【0154】

(20) 複合体III電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；又は、アセキノシリ；又は、フルアクリピリム。

【0155】

(21) 複合体I電子伝達阻害薬、例えば、METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン(Derris)。 40

【0156】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン。

【0157】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト。

【0158】

(24) 複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、

シアノ化物。

【0159】

(25) 複合体II電子伝達阻害薬、例えば、シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン。

【0160】

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド。

【0161】

作用機序が知られていないか又は不明瞭であるさらなる活性化合物、例えば、アフィド
ピロペン、アフォキソレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、
ビフェナゼート、ブロフランニリド(broflanilide)、プロモプロピレート、
キノメチオナート、氷晶石(cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサブリ
ド(cycloxaclid)、シハロジアミド(cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、ジコホル、ジフロビダジン、フロ
メトキン、フルアザインドリジン(fluazaindolizine)、フルエンスル
ホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン
(fluohexafon)、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノ
ジド(fufenozide)、グアジピル(guadipyr)、ヘプタフルトリン、
イミダクロチズ、イプロジオン、ロチラネル(lotilaner)、メペルフルトリン
、パイコングディング(paichongding)、ピフルブミド、ピリダリル、ピリ
フルキナゾン、ピリミノストロビン、サロラネル(sarolaner)、テトラメチル
フルトリン、テトラニリプロール(tetraniliprole)、テトラクロラント
ラニリプロール(tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフ
エン、トリフルメゾピリム、及び、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルム
ス(Bacillus firmus)に基づく調製物(I-1582, BiOne
m, Votivo)、及び、以下の活性化合物：1-[2-(フルオロ-4-メチル-
5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニル]-3-(トリフル
オロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン(WO2006/0436
35から既知)、{1'-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エン-
1-イル]-5-フルオロスピロ[インドール-3,4'-ピペリジン]-1(2H)-
イル}-(2-クロロピリジン-4-イル)メタノン(WO2003/106457から既
知)、2-クロロ-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-
2-エン-1-イル]ピペリジン-4-イル}-4-(トリフルオロメチル)フェニル]
イソニコチニアミド(WO2006/003494から既知)、3-(2,5-ジメチル
フェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3
-エン-2-オン(WO2009/049851から既知)、3-(2,5-ジメチルフ
エニル)-8-メトキシ-2-オキソ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3-エン
-4-イルエチルカルボネート(WO2009/049851から既知)、4-(ブタ-
2-イン-1-イルオキシ)-6-(3,5-ジメチルピペリジン-1-イル)-5-フ
ルオロピリミジン(WO2004/099160から既知)、4-(ブタ-2-イン-1
-イルオキシ)-6-(3-クロロフェニル)ピリミジン(WO2003/076415
から既知)、PF1364(CAS Reg. No. 1204776-60-2)、2-
[2-(3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-
5-イル]カルボニル}アミノ)-5-クロロ-3-メチルベンゾイル]-2-メチルヒ
ドラジンカルボン酸メチル(WO2005/085216から既知)、2-[2-(
3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カ
ルボニル}アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカル
ボン酸メチル(WO2005/085216から既知)、2-[2-(3-プロモ-
1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}ア
ミド(WO2005/085216から既知)。

ミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005 / 085216 から既知)、2 - [3, 5 - ジプロモ - 2 - ({[3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005 / 085216 から既知)、N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 102057925 から既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル)ベンズアミド (WO 2009 / 080250 から既知)、N - [(2E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル]ピリジン - 2 (1H) - イリデン] - 2, 2, 2 - トリフルオロアセトアミド (WO 2012 / 029672 から既知)、1 - [(2 - クロロ - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル)メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009 / 099929 から既知)、1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009 / 099929 から既知)、4 - (3 - {2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル)オキシ]フェノキシ}プロポキシ) - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル)ピリミジン (CN 101337940 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2008 / 134969 から既知)、[2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 3 - オキソ - 4 - オキサスピロ [4.5] デカ - 1 - エン - 1 - イル]炭酸ブチル (CN 102060818 から既知)、(3E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル)メチル] - 2 - ピリジニリデン] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO 2013 / 144213 から既知)、N - (メチルスルホニル) - 6 - [2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル]ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2012 / 000896 から既知)、N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010 / 051926 から既知)。

【0162】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、又は、インターネット上に記載されている（例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」）。

【0163】

クラス(1)～(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、適切な官能基が存在している場合には、対応する塩基又は酸と塩を形成し得る。さらに、クラス(1)～(15)に記載されている殺菌剤混合成分は、互変異性が可能である場合には、互変異性体形態も包含する。

【0164】

(1) エルゴステロール生合成阻害薬、例えば、(1.01)アルジモルフ、(1.02)アザコナゾール、(1.03)ビテルタノール、(1.04)プロムコナゾール、(1.05)シプロコナゾール、(1.06)ジクロブトラゾール、(1.07)ジフェノコナゾール、(1.08)ジニコナゾール、(1.09)ジニコナゾール-M、(1.10)ドデモルフ、(1.11)酢酸ドデモルフ、(1.12)エポキシコナゾール、(1.13)エタコナゾール、(1.14)フェナリモール、(1.15)フェンブコナゾール、(1.16)フェンヘキサミド、(1.17)フェンプロピジン、(1.18)フ

10

20

30

40

50

) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、
 (1 . 78) 2 - [(2 R , 4 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1
 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 79) 2 - [(2 S , 4 R , 5 R) - 1 -
 (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4
 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 8
 0) 2 - [(2 S , 4 S , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ
 - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4
 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 81) 2 - [(2 R , 4 S , 5 R) - 1 - (2 , 4
 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル]
 - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 82) 2 -
 [(2 R , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6
 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリア
 ゾール - 3 - チオン、(1 . 83) 2 - [(2 S , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロ
 ロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4
 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 84) 2 - [4 - (4
 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2
 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1 . 85) 2 - [4 - (4 -
 クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4
 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 86) 2 - [4 - (4 - クロ
 ロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - ト
 リアゾール - 1 - イル) ペンタン - 2 - オール、(1 . 87) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4
 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル)
 ブタン - 2 - オール、(1 . 88) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジクロロフェノキ
 シ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オ
 ール、(1 . 89) (2 R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 R) - 2
 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル)
 ブタン - 2 - オール、(1 . 90) (2 R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 -
 [(1 S) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾ
 ル - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 91) (2 S) - 2 - (1 - クロロシクロプロ
 ピル) - 4 - [(1 S) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 ,
 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 92) (2 S) - 2 - (1 -
 クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 R) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 -
 (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 93) (1 S
 , 2 R , 5 R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1
 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1 . 9
 4) (1 R , 2 S , 5 S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 -
 メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール
 、(1 . 95) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 -
 (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール。
 【 0165 】

(2) 複合体 I 又は複合体 II における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2 . 01) ビキ
 サフェン、(2 . 02) ボスカリド、(2 . 03) カルボキシン、(2 . 04) ジフルメ
 トリム、(2 . 05) フエンフラム、(2 . 06) フルオピラム、(2 . 07) フルトラ
 ニル、(2 . 08) フルキサピロキサド、(2 . 09) フラメトピル、(2 . 10) フル
 メシクロックス、(2 . 11) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S ,
 4 S R , 9 R S) とアンチ - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S , 4 S R , 9 S R) の混合
 物) 、(2 . 12) イソピラザム (アンチ - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R ,
 9 S R) 、(2 . 13) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S 50

, 9 S)、(2 . 1 4) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R)、(2 . 1 5) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 R S)、(2 . 1 6) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R)、(2 . 1 7) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S)、(2 . 1 8) メプロニル、(2 . 1 9) オキシカルボキシン、(2 . 2 0) ペンフルフェン、(2 . 2 1) ペンチオピラド、(2 . 2 2) セダキサン、(2 . 2 3) チフルザミド、(2 . 2 4) 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 2 5) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 2 6) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 2 7) N - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 2 8) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(2 . 2 9) ベンゾビンジフルピル、(2 . 3 0) N - [(1 S , 4 R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 1) N - [(1 R , 4 S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 2) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 3) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 4) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 5) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 6) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 7) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 3 9) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 0) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 1) ベノダニル、(2 . 4 2) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、(2 . 4 3) イソフェタミド、(2 . 4 4) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [2 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 5) N - (4 ' - クロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 6) N - (2 ' , 4 ' - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 8) N - (2

' , 5' - ジフルオロピフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 4 9) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 0) 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 1) 2 - クロロ - N - [4' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチニアミド、(2 . 5 2) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 3) N - [4' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 4) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4' - エチニルピフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 5) N - (4' - エチニルピフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 5 6) 2 - クロロ - N - (4' - エチニルピフェニル - 2 - イル) ニコチニアミド、(2 . 5 7) 2 - クロロ - N - [4' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチニアミド、(2 . 5 8) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4' - (トリフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド、(2 . 5 9) 5 - フルオロ - N - [4' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 0) 2 - クロロ - N - [4' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチニアミド、(2 . 6 1) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 2) 5 - フルオロ - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 3) 2 - クロロ - N - [4' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチニアミド、(2 . 6 4) 1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 5) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 6) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 7) 3 - (ジフルオロメチル) - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) プロパン - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 8) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 6 9) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 7 0) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド。

【0166】

(3) 複合体 I II における呼吸鎮の阻害薬、例えば、(3 . 0 1) アメトクトラジン、(3 . 0 2) アミスルプロム、(3 . 0 3) アゾキシストロビン、(3 . 0 4) シアゾファミド、(3 . 0 5) クメトキシストロビン (coumetoxy strobin) 、(3 . 0 6) クモキシストロビン、(3 . 0 7) ジモキシストロビン、(3 . 0 8) エノキサストロビン、(3 . 0 9) ファモキサドン、(3 . 1 0) フェンアミドン、(3 . 1 1) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin) 、(3 . 1 2

) フルオキサストロビン、(3.13) クレソキシム - メチル、(3.14) メトミノストロビン、(3.15) オリサストロビン、(3.16) ピコキシストロビン、(3.17) ピラクロストロビン、(3.18) ピラメトストロビン、(3.19) ピラオキシストロビン、(3.20) ピリベンカルブ、(3.21) トリクロピリカルブ、(3.22) トリフロキシストロビン、(3.23) (2E)-2-[2-[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ]フェニル)-2-[メトキシイミノ]-N-メチルアセトアミド、(3.24)(2E)-2-[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[2-[{(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ]メチル]フェニル)アセトアミド、(3.25)(2E)-2-[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[2-[{(E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ]メチル]フェニル)アセトアミド、(3.26)(2E)-2-[2-[{(1E)-1-[3-[{(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル]オキシ]フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ]メチル]フェニル}-2-[メトキシイミノ]-N-メチルアセトアミド、(3.27) フェナミノストロビン(fenaminostrobin)、(3.28) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-[{(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ]メチル]フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.29)(2E)-2-[2-[{(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル]スルファニル]メチル]フェニル]-3-メトキシアクリル酸メチル、(3.30) N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.31) 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、(3.32) 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、(3.33)(2E,3Z)-5-[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ]-2-[メトキシイミノ]-N,3-ジメチルペント-3-エンアミド。

【0167】

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.01) ベノミル、(4.02) カルベンダジム、(4.03) クロルフェナゾール、(4.04) ジエトフェンカルブ、(4.05) エタボキサム、(4.06) フルオピコリド、(4.07) フベリダゾール、(4.08) ペンシクロン、(4.09) チアベンダゾール、(4.10) チオファネート-メチル、(4.11) チオファネート、(4.12) ゾキサミド、(4.13) 5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、(4.14) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン。

【0168】

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.01) ボルドー液、(5.02) カプタホール、(5.03) キャプタン、(5.04) クロロタロニル、(5.05) 水酸化銅、(5.06) ナフテン酸銅、(5.07) 酸化銅、(5.08) 塩基性塩化銅、(5.09) 硫酸銅(2+)、(5.10) ジクロフルアニド、(5.11) ジチアノン、(5.12) ドジン、(5.13) ドジン遊離塩基、(5.14) ファーバム、(5.15) フルオロホルペット、(5.16) ホルペット、(5.17) グアザチン、(5.18) 酢酸グアザチン、(5.19) イミノクタジン、(5.20) イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21) イミノクタジン三酢酸塩、(5.22) マンカッパー、(5.23) マンゼブ、(5.24) マンネブ、(5.25) メチラム、(5.26) メチラム亜鉛(metiram zinc)、(5.27) オキシン銅、(5.28) プロパミジン(propamidine)、(5.29) プロピネブ、(5.30) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.31) チウラム、(5.32) トリルフルアニド、(5.33) ジネブ、(5.34) ジラム、(5.35) アニラジン。

【0169】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.01)アシベンゾラル-S-メチル、(6.02)イソチアニル、(6.03)プロベナゾール、(6.04)チアジニル、(6.05)ラミナリン(laminarin)。

【0170】

(7) アミノ酸及び/又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.01)アンドプリム(andoprime)、(7.02)プラストサイジン-S、(7.03)シブロジニル、(7.04)カスガマイシン、(7.05)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.06)メパニピリム、(7.07)ピリメタニル、(7.08)3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(7.09)オキシテトラサイクリン、(7.10)ストレプトマイシン。 10

【0171】

(8) ATP産生の阻害薬、例えば、(8.01)酢酸トリフェニルスズ、(8.02)塩化トリフェニルスズ、(8.03)水酸化トリフェニルスズ、(8.04)シリチオファム。

【0172】

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.01)ベンチアバリカルブ、(9.02)ジメトモルフ、(9.03)フルモルフ、(9.04)イプロバリカルブ、(9.05)マンジプロパミド、(9.06)ポリオキシン、(9.07)ポリオキソリム、(9.08)バリダマイシン、(9.09)バリフェナレート、(9.10)ポリオキシンB、(9.11)(2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.12)(2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン。 20

【0173】

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.01)ビフェニル、(10.02)クロロネブ、(10.03)ジクロラン、(10.04)エジフェンホス、(10.05)エトリジアゾール、(10.06)ヨードカルブ(iodoocarb)、(10.07)イプロベンホス、(10.08)イソプロチオラン、(10.09)プロパモカルブ、(10.10)プロパモカルブ塩酸塩、(10.11)プロチオカルブ、(10.12)ピラゾホス、(10.13)キントゼン、(10.14)テクナゼン、(10.15)トルクロホス-メチル。 30

【0174】

(11) メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.01)カルプロパミド、(11.02)ジクロシメット、(11.03)フェノキサニル、(11.04)フタリド、(11.05)ピロキロン、(11.06)トリシクラゾール、(11.07){3-メチル-1-[4-メチルベンゾイル]アミノ}ブタン-2-イルカルバミン酸2,2,2-トリフルオロエチル。

【0175】

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.01)ベナラキシル、(12.02)ベナラキシル-M(キララキシル(kirala xyl))、(12.03)ブピリメト、(12.04)クロジラコン、(12.05)ジメチリモール、(12.06)エチリモール、(12.07)フララキシル、(12.08)ヒメキサゾール、(12.09)メタラキシル、(12.10)メタラキシル-M(メフェノキサム)、(12.11)オフラセ、(12.12)オキサジキシル、(12.13)オキソリン酸、(12.14)オクチリノン。 40

【0176】

(13) シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.01)クロゾリネット、(13.02)フェンピクロニル、(13.03)フルジオキソニル、(13.04)イプロジオノン、(13.05)プロシミドン、(13.06)キノキシフェン、(13.07)ビン 50

クロゾリン、(13.08)プロキナジド。

【0177】

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.01)ビナパクリル、(14.02)ジノカップ、(14.03)フェリムゾン、(14.04)フルアジナム、(14.05)メチルジノカップ。

【0178】

(15) さらなる化合物、例えば、(15.001)ベンチアゾール、(15.002)ベトキサシン、(15.003)カプシマイシン(capsimycin)、(15.004)カルボン、(15.005)キノメチオネート、(15.006)ピリオフェノン(クラザフェノン(chlazafenone))、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド、(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)ダゾメット、(15.012)デバカルブ、(15.013)ジクロロフェン、(15.014)ジクロメジン、(15.015)ジフェンゾート、(15.016)ジフェンゾートメチル硫酸塩、(15.017)ジフェニルアミン、(15.018)エコメイト、(15.019)フェンピラザミン、(15.020)フルメトベル、(15.021)フルオルイミド、(15.022)フルスルファミド、(15.023)フルチアニル、(15.024)ホセチル-アルミニウム、(15.025)ホセチル-カルシウム、(15.026)ホセチル-ナトリウム、(15.027)ヘキサクロロベンゼン、(15.028)イルママイシン、(15.029)メタスルホカルブ、(15.030)イソチオシアノ酸メチル、(15.031)メトラフェノン、(15.032)ミルディオマイシン、(15.033)ナタマイシン、(15.034)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.035)ニトロタル-イソプロピル、(15.036)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.037)オキシフェンチイン(oxyfenthiin)、(15.038)ペンタクロロフェノール及び塩、(15.039)フェノトリリン、(15.040)亜リン酸及びその塩、(15.041)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-fosetyl late)、(15.042)プロパンシン-ナトリウム(propanosin-sodium)、(15.043)ピリモルフ、(15.044)ピロールニトリル、(15.045)テブフロキン、(15.046)テクロフタラム、(15.047)トルニファニド、(15.048)トリアゾキシド、(15.049)トリクラミド、(15.050)ザリラミド、(15.051)(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[({3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル-2-メチルプロパノエート、(15.052)1-(4-{4-[({5R)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.053)1-(4-{4-[({5S)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.054)オキサチアピプロリン、(15.055)1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15.056)2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.057)2,3-ジブチル-6-クロロチエノ[2,3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15.058)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)-テトロン、(15.059)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[({5R)-5-フェニル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(15.060)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-

10

20

30

40

50

1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - フェニル - 4 , 5 -
ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリ
ジン - 1 - イル) エタノン、(15 . 061) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメ
チル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - { 4 - [4 - (5 - フェニル - 4 , 5 - ジ
ヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジ
ン - 1 - イル } エタノン、(15 . 062) 2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル -
4 H - クロメン - 4 - オン、(15 . 063) 2 - クロロ - 5 - [2 - クロロ - 1 - (2
, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 5 - イ
ル] ピリジン、(15 . 064) 2 - フェニルフェノール及び塩、(15 . 065) 3 -
(4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 -
イル) キノリン、(15 . 066) 3 , 4 , 5 - トリクロロピリジン - 2 , 6 - ジカルボ
ニトリル、(15 . 067) 3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2 , 6 -
ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(15 . 068) 4 - (4 - クロロフェ
ニル) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 , 6 - ジメチルピリダジン、(15 .
069) 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、(15 . 070) 5 -
クロロ - N ' - フェニル - N ' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) チオフェン - 2 - ス
ルホノヒドラジド、(15 . 071) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オ
キシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15 . 072) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベ
ンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15 . 073) 5 - メチル - 6 - オクチル
[1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、(15 . 074) (10
2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、(15 . 075) N
' - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル]
オキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、
(15 . 076) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2
- イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15 . 077) N - [(4 - ク
ロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1
- イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15 . 078) N - [(5 - プロモ - 3 -
クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、(15 . 07
9) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジク
ロロニコチンアミド、(15 . 080) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン -
2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードニコチンアミド、(15 . 081) N -
{ (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 ,
3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、(15 . 082) N -
{ (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 ,
3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、(15 . 083) N '
- { 4 - [(3 - t e r t - ブチル - 4 - シアノ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イル) オキ
シ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド
、(15 . 084) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル
) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - (1 , 2 ,
3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミ
ド、(15 . 085) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル
) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 R
) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 -
カルボキサミド、(15 . 086) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリ
フルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) -
N - [(1 S) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チア
ゾール - 4 - カルボキサミド、(15 . 087) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - 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] ピリジン - 2
- イル } カルバミン酸ペンチル、(15 . 088) フェナジン - 1 - カルボン酸、(15
. 089) キノリン - 8 - オール、(15 . 090) キノリン - 8 - オールスルフェート 50

(2 : 1)、(15.091){6-[({[(1-メチル-1H-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]ピリジン-2-イル}カルバミン酸tert-ブチル、(15.092)(5-プロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン、(15.093)N-[2-(4-{[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メトキシフェニル)エチル]-N2-(メチルスルホニル)バリンアミド、(15.094)4-オキソ-4-[[(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.095){6-[({[(Z)-(1-メチル-1H-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]ピリジン-2-イル}カルバミン酸ブタ-3-イン-1-イル、(15.096)4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性体形態:4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15.097)3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15.098)[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.099)(S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.100)(R)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.101)2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(15.102)2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15.103)2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15.104)3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.105)アブシジン酸、(15.106)N'-[5-プロモ-6-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.107)N'-{5-プロモ-6-[1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.108)N'-{5-プロモ-6-[1R)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.110)N'-{5-プロモ-6-[シス-4-イソプロピルシクロヘキシル]オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.111)N'-{5-プロモ-6-[トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル]オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.112)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.113)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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.114)N-(2-tert-ブチルベンジル)-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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.115)N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.116)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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.117)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-フルオロベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.118)

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.119) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.120) N - (2 - シクロベンチル - 5 - フルオロベンジル) - 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.121) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.122) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.123) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.124) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.125) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.126) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.127) 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 - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.128) N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.129) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.130) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.131) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、(15.132) N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.133) N' - {4 - [(4 , 5 - ジクロロ - 1 , 3 - 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 - メチルイミドホルミアミド、(15.134) N - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.135) 9 - フルオロ - 2 , 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサアゼピン、(15.136) 2 - {2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] フェニル} プロパン - 2 - オール、(15.137) 2 - {2 - [(7 , 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル} プロパン - 2 - オール、(15.138) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.139) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.140) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.141) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.142) N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(15.143) 4 - 10
20
30
40
50

(2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 144) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 145) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 146) N - (2 - プロモフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 147) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 148) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 149) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15 . 150) N ' - (4 - { 3 - [(ジフルオロメチル) スルファニル] フェノキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 151) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 152) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 153) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロピル) スルファニル] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 154) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(ペンタフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 155) N ' - (4 - { [3 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] スルファニル } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 156) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 157) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 158) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロポキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 159) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (ペンタフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15 . 160) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15 . 161) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 - (フルオロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15 . 162) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15 . 163) 2 - { 3 - [2 - (1 - { [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニル メタンスルホネート、(15 . 164) 2 - { 3 - [2 - (1 - { [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニル メタンスルホネート、(15 . 165) 2 - [3 , 5 - ビ 10
20
30
40
50

ス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.166)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.167)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.168)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.169)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.170)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.171)2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニル メタンスルホネート、(15.172)2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニル メタンスルホネート、(15.173)2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニル メタンスルホネート、(15.174)2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニル メタンスルホネート。
【0179】
混合成分としての生物学的有害生物防除剤
式(I)で表される化合物は、生物学的有害生物防除剤と組み合わせることができる。

【0180】
生物学的有害生物防除剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質又は二次代謝産物)などがある。

【0181】
生物学的有害生物防除剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。
【0182】
生物学的有害生物防除剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである:

バシリス・アミロリクエファシエンス(Bacillus amylolyquefaciens)株FZB42(DSM 231179)、又は、バシリス・セレウス(Bac

illus cereus)、特に、バシリス・セレウス(*B. cereus*)株CN
CM I-1562、又は、バシリス・フィルムス(*Bacillus firmus*)
株I-1582(受託番号 CNCM I-1582)、又は、バシリス・プミルス(*B
acillus pumilus*)、特に、株GB34(受託番号 ATCC 7008
14)及び株QST2808(受託番号 NRRL B-30087)、又は、バシリス
・スブチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号
ATCC SD-1397)、又は、バシリス・スブチリス(*Bacillus sub
tilis*)株QST713(受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシリス
・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株OST 30002(受託番号
NRRL B-50421)、バシリス・ツリンギエンシス(*Bacillus th
uringiensis*)、特に、バシリス・ツリンギエンシス 亜種 イスラエレンシ
ス(*B. thuringiensis subspecies israelensis*)(抗原型 H-14)株AM65-52(受託番号 ATCC 1276)、又は、
バシリス・ツリンギエンシス 亜種 アイザワイ(*B. thuringiensis
subsp. aizawai*)、特に、株ABTS-1857(SD-1372)、又
は、バシリス・ツリンギエンシス 亜種 クルスタキ(*B. thuringiensis
subsp. kurstakii*)株HD-1、又は、バシリス・ツリンギエンシス
亜種 テネブリオニス(*B. thuringiensis subsp. tene
brionis*)株NB 176(SD-5428)、パステウリア・ペネトランス(*P
asteuria penetrans*)、パステウリア属種(*Pasteuria s
pp.*)(ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus renifo
rmis*)線虫)-PR3(受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス
・ミクロフラブス(*Streptomyces microflavus*)株AQ612
1(= QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガル
ブス(*Streptomyces galbus*)株AQ 6047(受託番号 NRR
L 30232)。

【0183】

生物学的有害生物防除剤として使用されているか又は使用することが可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ(*Beauveria bassiana*)、特に、株ATCC
74040、コニオチリウム・ミニタンス(*Coniothyrium minita
ns*)、特に、株CON/M/91-8(受託番号 DSM-9660)、レカニシリウ
ム属種(*Lecanicillium spp.*)、特に、株HRO LEC 12、レ
カニシリウム・レカニイ(*Lecanicillium lecanii*)(以前は、ベ
ルチシリウム・レカニイ(*Verticillium lecanii*))として知られ
ていた)、特に、株KV01、メタリジウム・アニソプリアエ(*Metarhizium
anisopliae*)、特に、株F52(DSM3884/ ATCC 90448)
)、メトスクニコヴィア・フルクチコラ(*Metschnikowia fructic
ola*)、特に、株NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス(*P
aeciliomyces fumosoroseus*)(新：イサリア・フモソロセア(*I
saria fumosorosea*))、特に、株IFPC 200613又は株Ap
opka 97(受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス(*P
aeciliomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス(*P.
lilacinus*)株251(AGAL 89/030550)、タラロミセス
・フラブス(*Talaromyces flavus*)、特に、株V117b、トリコデ
ルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)、特に、株SC
1(受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム(*Trichod
erma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ(*T.
harzianum rifai*)T39(受託番号 CNCM I-952)。

【0184】

生物学的有害生物防除剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV) 、コドリンガ (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV) 、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV) 、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV 、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV 、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV 。

【0185】

10

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定の特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に包含される。挙げができる例は、以下のものである：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium spp.*) 、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*) 、アゾスピリルム属種 (*Azospirillum spp.*) 、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter spp.*) 、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium spp.*) 、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia spp.*) 、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた) 、ギガスpora属種 (*Gigaspora spp.*) 又はギガスpora・モノスポラム (*Gigaspora monosporum*) 、グロムス属種 (*Glomus spp.*) 、ラッカリア属種 (*Laccaria spp.*) 、ラクトバシルス・ブクネリ (*Lactobacillus buchneri*) 、パラグロムス属種 (*Paraglomus spp.*) 、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*) 、プセウドモナス属種 (*Pseudomonas spp.*) 、リゾビウム属種 (*Rhizobium spp.*) 、特に、リゾビウム・トリホリイ (*Rhizobium trifolii*) 、リゾポゴン属種 (*Rhizophogon spp.*) 、スクレロデルマ属種 (*Scleroderma spp.*) 、スイルス属種 (*Suillus spp.*) 、ストレプトミセス (*Streptomyces spp.*) 。

【0186】

20

生物学的有害生物防除剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質及び二次代謝産物を含む) の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*) 、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*) 、アザジラクチン (*azadirachtin*) 、Biokeeper WP 、カッシア・ニグリカンス (*Cassia nigricans*) 、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*) 、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*) 、キチン、Armour-Zen 、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*) 、スギナ (*Equisetum arvense*) 、Fortune Aza 、Fungastop 、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サポニン抽出物) 、除虫菊 (*Pyrethrum/Pyrethrins*) 、スリナムニガキ (*Quassia amara*) 、コナラ属 (*Quercus*) 、キラヤ属 (*Quiilla jaja*) 、Regalia 、(「Requiem™ Insecticide」) 、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*) 、ヨモギギク (*Tanacetum vulgare*) 、チモール、Triact 70 、TriCon 、キンレンカ (*Tropaeolum majus*) 、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*) 、Veratrin 、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*) 、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉

40

50

末。

【0187】

混合成分としての薬害軽減剤

式(I)で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット(-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール(-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン(-エチル)、メフェンピル(-ジエチル)、ナフトル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-(4-[メチルカルバモイル]アミノ)フェニルスルホニル)ベンズアミド(CAS 129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(CAS 71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(CAS 52836-31-4)。
10

【0188】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物(天然に発生している作物植物を包含する)のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの)などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的方法と遺伝子工学的方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫物、並びに、栄養繁殖器官(vegetative propagation material)及び生殖繁殖器官(generative propagation material)
30)、例えば、挿穗(cutting)、塊茎、根茎、かき苗(slip)及び種子なども、植物の部分に包含される。

【0189】

式(I)で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧(fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官(propagation material)の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。
40

【0190】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種(遺伝子組換え生物)及びそれらの部分を処理する。用語「部分(parts)」又は「植物の部分(parts of plants)」又は「植物の部分(plant parts)」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種又は使用されている慣習的な植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって
50

栽培された、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

【0191】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合イベント (integration events)

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渴水又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び／又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、動物有害生物及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシリス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質〔例えば、遺伝子 *CryIA(a)*、*CryIA(b)*、*CryIA(c)*、*CryIIC*、*CryIIIA*、*CryIICB2*、*Cry9c*、*Cry2Ab*、*Cry3Bb* 及び *CryIF* 並びにそれらの組合せ〕によって植物体内で產生された毒素による、害虫及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性（SAR）、システム（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性化合物（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート類又はホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0192】

作物保護 - 処理の種類

植物及び植物の部分は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（spreading-on）、注入、灌水（灌注（drenching））、点滴灌漑などによって、式（I）で表される化合物で直接的に処理するか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官（propagation material）の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理によっても処理し、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによつても処理する。さらに、式（I）で表される化合物を微量散布法（ultra-low volume method）によって施用することも可能であり、又は、該施用形態若しくは式（I）で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

【0193】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式（I）で表される化合物を

10

20

30

40

50

茎葉部に施用し、その際、処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

【0194】

浸透移行性活性化合物の場合、式(I)で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式(I)で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注(drenching)によって、又は、土壤若しくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所(例えば、土壤、又は、水耕系)に式(I)で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壤施用〔即ち、式(I)で表される化合物を固体形態で(例えば、顆粒形態で)植物の成育場所に導入する〕ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式(I)で表される化合物(例えば、粒剤として)を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

10

【0195】

種子の処理

植物の種子を処理することによる動物有害生物の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。しかしながら、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に有害生物防除剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化合物によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、動物有害生物による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性化合物の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の有害生物防除剤を使用して種子及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、有害生物抵抗性トランスジェニック植物又は有害生物耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

20

【0196】

従って、本発明は、特に、有害生物による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式(I)で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を有害生物による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式(I)で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式(I)で表される化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

30

【0197】

本発明は、さらに、種子及びその種子から生じた植物を動物有害生物に対して保護するために種子を処理するための、式(I)で表される化合物の使用にも関する。

【0198】

本発明は、さらに、動物有害生物に対して保護されるように、式(I)で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式(I)で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式(I)で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式(I)で表される化合物と混合成分が被膜の一部分として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

40

【0199】

本発明は、さらに、式(I)で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0200】

50

式(Ⅰ)で表される浸透移行的に作用する化合物における有利な点の1つは、種子を処理することによって、動物有害生物に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなく作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0201】

別の有利な点は、式(Ⅰ)で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということである。

【0202】

式(Ⅰ)で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

10

【0203】

さらに、式(Ⅰ)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、共生生物(例えば、根粒菌、菌根菌及び/又は内部寄生性の細菌若しくは菌類)によるコロニー形成が良好になり、及び/又は、窒素固定が最適化される。

【0204】

式(Ⅰ)で表される化合物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク)、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート(例えば、テンサイ及び飼料用ビート)、ラッカセイ、野菜(例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギ及びレタス)、果実植物、芝生及び観賞植物の種子を包含する。穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

20

【0205】

既に上記で記載したように、式(Ⅰ)で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド(特に、殺虫特性及び/又は殺線虫特性を有するポリペプチド)の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、この場合、バシリス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、プセウドモナス(*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Gloomus*)種又はグリオクラジウム(*Gliocladium*)種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシリス属種(*Bacillus* sp.)に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシリス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

30

【0206】

本発明に関連して、式(Ⅰ)で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように充分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子(例えば、プライミング)を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階(鳩胸段階)に達するまで水中で予め吸水させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が改善され、及び、出芽がより均一になる。

40

【0207】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、種子から生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式(Ⅰ)で表される化合物の量及び/又はさ

50

らなる添加剤の量を選択することに、概して注意しなければならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合に、確実に実施しなければならない。

【0208】

一般に、式(I)で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及びプロセスは、当業者には知られている。

【0209】

式(I)で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルション剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

10

【0210】

これらの製剤は、既知方法で、式(I)で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な增量剤、及び、さらに、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、調製する。

【0211】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中あまり溶解しない顔料又は水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C.I.Pigment Red 112」及び「C.I.Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げることができる。

20

【0212】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができると有用な湿潤剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【0213】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができると適切な分散剤及び/又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用する。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリールスルホネート-ホルムアルデヒド縮合物である。

30

【0214】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができると消泡剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

40

【0215】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができると防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

【0216】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができると第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレー及び微粉化シリカなどを挙げることができる。

【0217】

50

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

【0218】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3 (=ジベレリン酸)、ジベレリンA4及びジベレリンA7である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている (cf. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

【0219】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤 (concentrate) 又は水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することができる、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することができる。本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することができる。

【0220】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤又はその種子粉衣製剤から調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機（これは、バッチ式又は連続的に作動される）の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのままで添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【0221】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の式(I)で表される化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式(I)で表される化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

【0222】

動物衛生

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式(I)で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類及び原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類及びダニ類である。

【0223】

獣医学の分野において、恒温動物に対する毒性が好ましい程度である式(I)で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物 (domestic animal) において発生する寄生生物を防除するのに適している。

【0224】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、

10

20

30

40

50

ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに、特に、ウシ及びブタ；家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；魚類及び甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類及び甲殻類の動物；及び、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0225】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テンジクネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、及び、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、又は、水槽の魚。

【0226】

好ましい実施形態では、式(I)で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。 10

【0227】

好ましい別の実施形態では、式(I)で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、及び、特に、家禽類に対して、投与される。

【0228】

動物寄生生物を防除するために式(I)で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性(performance)(肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合)の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済で且つより容易な畜産業が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0229】

20

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する(control)」又は「防除する(controlling)」は、式(I)で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式(I)で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すことが可能であること、その成長を阻害することが可能であること、又は、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0230】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

アノプルリダ目(*Anoplurida*)の、例えば、ハエマトピヌス属種(*Haematoptinus* spp.)、リノグナツス属種(*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種(*Pediculus* spp.)、プチルス属種(*Phthirus* spp.)、ソレノポテス属種(*Solenopotes* spp.)；マロファギダ目(*Mallophagida*)並びにアムブリセリナ亜目(*Amblycerina*)及びイスクノセリナ亜目(*Ischnocerina*)の、例えば、トリメノポン属種(*Trimenopon* spp.)、メノポン属種(*Menopon* spp.)、トリノトン属種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属種(*Bovicola* spp.)、ウェルネキエラ属種(*Werneckiella* spp.)、レビケントロン属種(*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属種(*Damalina* spp.)、トリコデクテス属種(*Trichodectes* spp.)、フェリコラ属種(*Felicola* spp.)；双翅目(*Diptera*)並びにネマトセリナ亜目(*Nematocerina*)及びブラキセリナ亜目(*Brachycerina*)の、例えば、アedes属種(*Aedes* spp.)、アノフェレス属種(*Anopheles* spp.)、クレキス属種(*Culex* spp.)、シムリウム属種(*Simulium* spp.)、エウシムリウム属種(*Eusimulium* spp.)、フレボトムス属種(*Phlebotomus* spp.)、ルトゾミイヤ属種(*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス属種(*Culicoides* spp.)、クリソップス属種(*Chrysops* spp.)、オダグミア属種(*Odagmia* spp.)、ウイルヘルミア属種(*Wilhelmiia* spp.)、ヒボミトラ属種(*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種(*Atylotus* spp.)、タバヌス属種(*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種(*Haematopota* spp.)、

30

アノプルリダ目(*Anoplurida*)の、例えば、ハエマトピヌス属種(*Haematoptinus* spp.)、リノグナツス属種(*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種(*Pediculus* spp.)、プチルス属種(*Phthirus* spp.)、ソレノポテス属種(*Solenopotes* spp.)；マロファギダ目(*Mallophagida*)並びにアムブリセリナ亜目(*Amblycerina*)及びイスクノセリナ亜目(*Ischnocerina*)の、例えば、トリメノポン属種(*Trimenopon* spp.)、メノポン属種(*Menopon* spp.)、トリノトン属種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属種(*Bovicola* spp.)、ウェルネキエラ属種(*Werneckiella* spp.)、レビケントロン属種(*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属種(*Damalina* spp.)、トリコデクテス属種(*Trichodectes* spp.)、フェリコラ属種(*Felicola* spp.)；双翅目(*Diptera*)並びにネマトセリナ亜目(*Nematocerina*)及びブラキセリナ亜目(*Brachycerina*)の、例えば、アedes属種(*Aedes* spp.)、アノフェレス属種(*Anopheles* spp.)、クレキス属種(*Culex* spp.)、シムリウム属種(*Simulium* spp.)、エウシムリウム属種(*Eusimulium* spp.)、フレボトムス属種(*Phlebotomus* spp.)、ルトゾミイヤ属種(*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス属種(*Culicoides* spp.)、クリソップス属種(*Chrysops* spp.)、オダグミア属種(*Odagmia* spp.)、ウイルヘルミア属種(*Wilhelmiia* spp.)、ヒボミトラ属種(*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種(*Atylotus* spp.)、タバヌス属種(*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種(*Haematopota* spp.)、

40

アノプルリダ目(*Anoplurida*)の、例えば、ハエマトピヌス属種(*Haematoptinus* spp.)、リノグナツス属種(*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種(*Pediculus* spp.)、プチルス属種(*Phthirus* spp.)、ソレノポテス属種(*Solenopotes* spp.)；マロファギダ目(*Mallophagida*)並びにアムブリセリナ亜目(*Amblycerina*)及びイスクノセリナ亜目(*Ischnocerina*)の、例えば、トリメノポン属種(*Trimenopon* spp.)、メノポン属種(*Menopon* spp.)、トリノトン属種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属種(*Bovicola* spp.)、ウェルネキエラ属種(*Werneckiella* spp.)、レビケントロン属種(*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属種(*Damalina* spp.)、トリコデクテス属種(*Trichodectes* spp.)、フェリコラ属種(*Felicola* spp.)；双翅目(*Diptera*)並びにネマトセリナ亜目(*Nematocerina*)及びブラキセリナ亜目(*Brachycerina*)の、例えば、アedes属種(*Aedes* spp.)、アノフェレス属種(*Anopheles* spp.)、クレキス属種(*Culex* spp.)、シムリウム属種(*Simulium* spp.)、エウシムリウム属種(*Eusimulium* spp.)、フレボトムス属種(*Phlebotomus* spp.)、ルトゾミイヤ属種(*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス属種(*Culicoides* spp.)、クリソップス属種(*Chrysops* spp.)、オダグミア属種(*Odagmia* spp.)、ウイルヘルミア属種(*Wilhelmiia* spp.)、ヒボミトラ属種(*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種(*Atylotus* spp.)、タバヌス属種(*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種(*Haematopota* spp.)、

50

フィリポミイア属種 (*Philopomyia* spp.)、ブラウラ属種 (*Braula* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア属種 (*Haematobia* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、グロシナ属種 (*Glossina* spp.)、カリホラ属種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、クリソミイア属種 (*Chrysomyia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.); ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、ブレキス属種 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga* spp.)、キセノブシラ属種 (*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属種 (*Ceratophylus* spp.);

ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス属種 (*Panstrongylus* spp.); 並びに、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生有害生物。

【0231】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げることができる:

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarina*)) 及びメタスチグマタ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒヤロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属); メソスチグマタ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニスス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、ブネウモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Railletiella* spp.)、ブネウモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、バロア属種 (*Varroa* spp.)、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.); アクチネジダ目 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属種 (*Ornithochyletiella* spp.)、ミオビア属種 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psorergates* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.)、ネオトロムビクラ属種 (*Neotrombicula* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.); 及び、アカリジダ目 (*Acaridiida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属種 (*Calog* 50

lyphus spp.)、ヒポデクテス属種(*Hypodectes spp.*)、ブテロリクス属種(*Pterolichus spp.*)、プソロプテス属種(*Psoroptes spp.*)、コリオプテス属種(*Chorioptes spp.*)、オトデクトエス属種(*Otodectes spp.*)、サルコプテス属種(*Sarcoptes spp.*)、ノトエドレス属種(*Notoedres spp.*)、クネミドコプテス属種(*Knemidocoptes spp.*)、シトジテス属種(*Cytodites spp.*)、ラミノシオプテス属種(*Laminoсиoptes spp.*)。

【0232】

寄生性原生動物としては、以下のものを挙げることができる：

鞭毛虫亜門(*Mastigophora*)（鞭毛虫類(*Flagellata*)）10、例えば、トリパノソーマ科(*Trypanosomatidae*)、例えば、トリパノソーマ**. b .**・ブルセイ(*Trypanosoma b. brucei*)、トリパノソーマ**. b .**・ガムビエンセ(*T. b. gambiense*)、トリパノソーマ**. b .**・ロデシエンセ(*T. b. rhodesiense*)、トリパノソーマ・コンゴレンセ(*T. congolense*)、トリパノソーマ・クルジ(*T. cruzi*)、トリパノソーマ・エバンシ(*T. evansi*)、トリパノソーマ・エクイヌム(*T. equinum*)、トリパノソーマ・レウイシ(*T. lewisi*)、トリパノソーマ・ペルカエ(*T. percae*)、トリパノソーマ・シミアエ(*T. simiae*)、トリパノソーマ・ビバキス(*T. vivax*)、レイスマニア・ブラシリエンシス(*Leishmania brasiliensis*)、レイスマニア・ドノバニ(*L. donovani*)、レイスマニア・トロピカ(*L. tropica*)；例えば、トリコモナス科(*Trichomonadidae*)、例えば、ギアルジア・ラムブリア(*Giardia lamblia*)、ギアルジア・カニス(*G. canis*)；

有毛根足虫亜門(*Sarcostigophora*)（根足虫類(*Rhizopoda*)）20；例えば、エントアメーバ科(*Entamoebidae*)、例えば、エンタモエバ・ヒストリチカ(*Entamoeba histolytica*)；ハルトマネリダエ科(*Hartmanellidae*)、例えば、アカンタモエバ属種(*Acanthamoeba sp.*)、ハルマレラ属種(*Harmanella sp.*)；

アピコンプレックス門(*Apicomplexa*)（胞子虫類(*Sporozoa*)）30、例えば、エイメリア科(*Eimeriidae*)、例えば、エイメリア・アセルブリナ(*Eimeria acervulina*)、エイメリア・アデノイデス(*E. adenoides*)、エイメリア・アラバメンシス(*E. alabamensis*)、エイメリア・アナチス(*E. anatis*)、エイメリア・アンセリナ(*E. anserina*)、エイメリア・アルロインギ(*E. arloingi*)、エイメリア・アシャタ(*E. ashata*)、エイメリア・アウブルネンシス(*E. auburnensis*)、エイメリア・ボビス(*E. bovis*)、エイメリア・ブルネット(*E. brunetti*)、エイメリア・カニス(*E. canis*)、エイメリア・キンキラエ(*E. chinchillae*)、エイメリア・クルペアルム(*E. clupearium*)、エイメリア・コルムバエ(*E. columbae*)、エイメリア・コントルタ(*E. contorta*)、エイメリア・クランダリス(*E. crandalis*)、エイメリア・デブリエクキ(*E. debbieckii*)、エイメリア・ジスペルサ(*E. dispersa*)、エイメリア・エリプソイダレス(*E. ellipsoidea*)、エイメリア・ファルシホルミス(*E. falciformis*)、エイメリア・ファウレイ(*E. faurei*)、エイメリア・フラベセンス(*E. flavezensis*)、エイメリア・ガロパボニス(*E. gallopavonis*)、エイメリア・ハガニ(*E. hagani*)、エイメリア・インテスキナリス(*E. intestinalis*)、エイメリア・イロクオイナ(*E. iroquoiana*)、エイメリア・イレシズア(*E. irresidua*)、エイメリア・ラベアナ(*E. labbeana*)、エイメリア・レウカルチ(*E. leucarti*)、エイメリア・マグナ(*E. magna*)、エイメリア・マキシマ(*E. maxima*)、エイメリア・40

マグナ(*E. magna*)、エイメリア・マキシマ(*E. maxima*)、エイメリア・50

メジア (*E. media*)、エイメリア・メレアグリジス (*E. meleagridis*)、エイメリア・メレアグリミチス (*E. meleagris mitis*)、エイメリア・ミチス (*E. mitis*)、エイメリア・ネカトリキス (*E. necatrix*)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ (*E. ninakohlyakimovae*)、エイメリア・オビス (*E. ovis*)、エイメリア・パルバ (*E. parva*)、エイメリア・パボニス (*E. pavonis*)、エイメリア・ペルホランス (*E. perforans*)、エイメリア・ファサニ (*E. phasani*)、エイメリア・ピリホルミス (*E. piriformis*)、エイメリア・プラエコキス (*E. praecox*)、エイメリア・レシズア (*E. residua*)、エイメリア・スカブラ (*E. scabra*)、エイメリア属種 (*E. spec.*)、エイメリア・スチエダイ (*E. stiedai*)、エイメリア・スイス (*E. suis*)、エイメリア・テネラ (*E. tenella*)、エイメリア・ツルンカタ (*E. truncata*)、エイメリア・ツルッタエ (*E. truttae*)、エイメリア・ズエルニイ (*E. zuernii*)、グロビジウム属種 (*Globidium spec.*)、イソスピラ・ベリ (*Isospora bellii*)、イソスピラ・カニス (*I. canis*)、イソスピラ・フェリス (*I. felis*)、イソスピラ・オヒオエンシス (*I. ohioensis*)、イソスピラ・リボルタ (*I. rivolta*)、イソスピラ属種 (*I. spec.*)、イソスピラ・スイス (*I. suis*)、シスチソスピラ属種 (*Cystoisospora spec.*)、クリプトスピリジウム属種 (*Cryptosporidium spec.*)、特に、クリプトスピリジウム・パルブム (*C. parvum*)；例えば、トキソプラズマ科 (*Toxoplasmaeidae*)、例えば、トキソプラズマ・ゴンジイ (*Toxoplasma gondii*)、ハモンジア・ヘイドルニイ (*Hammondia heydornii*)、ネオスピラ・カニヌム (*Neospora caninum*)、ベスノイチア・ベスノイチイ (*Besnoitia besnoiti*)；例えば、肉胞子虫科 (*Sarcocystidae*)、例えば、サルコシスチス・ボビカニス (*Sarcocystis bovinis*)、サルコシスチス・ボビホルミス (*S. bovinis*)、サルコシスチス・オビカニス (*S. ovicanis*)、サルコシスチス・オビフェリス (*S. ovifelis*)、サルコシスチス・ネウロナ (*S. neurona*)、サルコシスチス属種 (*S. spec.*)、サルコシスチス・スイホミニス (*S. suihominis*)；例えば、レウコゾイダ科 (*Leucozoidae*)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (*Leucocytozoon simondi*)；例えば、プラスモディウム科 (*Plasmodiidae*)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium berghei*)、プラスモジウム・ファルシバルム (*P. falciparum*)、プラスモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラスモジウム・オバレ (*P. ovale*)、プラスモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラスモジウム属種 (*P. spec.*)；例えば、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasmidea*)、例えば、バベシア・アルゲンチナ (*Babesia argentina*)、バベシア・ボビス (*B. bovis*)、バベシア・カニス (*B. canis*)、バベシア属種 (*B. spec.*)、ティレリア・パルバ (*Theileria parva*)、ティレリア属種 (*Theileria spec.*)；例えば、アデレア亜目 (*Adelina*)、例えば、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種 (*H. spec.*)。

【0233】

病原性内部寄生生物（これは、蠕虫類である）としては、扁形動物門 (*Platyhelminthes*) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)]、線形動物 (*nematodes*)、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げることができる：

単生綱 (*Monogenea*)：例えば：ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus*

10

20

30

40

50

us spp.)、ダクチロギルス属種(*Dactylogyrus spp.*)、ポリストマ属種(*Polyystoma spp.*)；

条虫類(*Cestodes*)：ギヨウジヨウチュウ目(*Pseudophyllidae*)の、例えば：ジフィロボトリウム属種(*Diphyllobothrium spp.*)、スピロメトラ属種(*Spirometra spp.*)、シストセファルス属種(*Schistocephalus spp.*)、リグラ属種(*Ligula spp.*)、ボトリジウム属種(*Bothridium spp.*)、ジフロゴノボルス属種(*Diphlogonoporus spp.*)；

エンヨウジヨウチュウ目(*Cyclophyllidae*)の、例えば：メソセストイデス属種(*Mesocestoides spp.*)、アノプロセファラ属種(*Anoplocephala spp.*)、パラノプロセファラ属種(*Paranoplocephala spp.*)、モニエジア属種(*Moniezia spp.*)、チサノソマ属種(*Thysanosoma spp.*)、チサニエジア属種(*Thysaniezia spp.*)、アビテリナ属種(*Avitellina spp.*)、スチレシア属種(*Stilesia spp.*)、シタエニア属種(*Cittotaenia spp.*)、アンジラ属種(*Andyra spp.*)、ベルチエラ属種(*Bertieella spp.*)、タエニア属種(*Taenia spp.*)、エキノコックス属種(*Echinococcus spp.*)、ヒダチゲラ属種(*Hydatigera spp.*)、ダバイニア属種(*Davainea spp.*)、ライリエチナ属種(*Raillietina spp.*)、ヒメノレピス属種(*Hymenolepis spp.*)、エキノレピス属種(*Echinolepis spp.*)、エキノコチレ属種(*Echinocotyle spp.*)、ジオルキス属種(*Diochlis spp.*)、ジピリジウム属種(*Dipylidium spp.*)、ジョイエウキシエラ属種(*Joyeuxielia spp.*)、ジプロピリジウム属種(*Diplopylidium spp.*)；

吸虫類(*Trematodes*)：二生亜綱(*Digenaea*)の、例えば：ジプロストムム属種(*Diplostomum spp.*)、ポストジプロストムム属種(*Posthodiplostomum spp.*)、シストソマ属種(*Schistosoma spp.*)、トリコビルハルジア属種(*Trichobilharzia spp.*)、オルニトビルハルジア属種(*Ornithobilharzia spp.*)、アウストロビルハルジア属種(*Austrobilharzia spp.*)、ギガントビルハルジア属種(*Gigantobilharzia spp.*)、レウコクロリジウム属種(*Leucocloridium spp.*)、ブラキライマ属種(*Brachylaima spp.*)、エキノストマ属種(*Echinostoma spp.*)、エキノカリスマス属種(*Echinochasmus spp.*)、ヒポラエウム属種(*Hyporaeum spp.*)、ファシオラ属種(*Fasciola spp.*)、ファシオリデス属種(*Fasciolides spp.*)、ファシオロプシス属種(*Fasciolopsis spp.*)、シクロコエルム属種(*Cyclocoelum spp.*)、チフロコエルム属種(*Typhlocoelum spp.*)、パラムフィストムム属種(*Paramphistomum spp.*)、カリコホロン属種(*Calicophoron spp.*)、コチロホロン属種(*Cotylophoron spp.*)、ギガントコチレ属種(*Gigantocotyle spp.*)、フィスコエデリウス属種(*Fischederius spp.*)、ガストロチラクス属種(*Gastrothylacus spp.*)、ノトコチルス属種(*Notocotylus spp.*)、カタトロビス属種(*Catatropis spp.*)、プラギオルキス属種(*Plagiorchis spp.*)、プロストゴニムス属種(*Prosthogonimus spp.*)、ジクロコエリウム属種(*Dicrocoelium spp.*)、エウリトレマ属種(*Eurytrema spp.*)、トログロトレマ属種(*Troglotrema spp.*)、パラゴニムス属種(*Paragonimus spp.*)、コリリクルム属種(*C*

10

20

30

40

50

olylriclum spp.)、ナノフィエツス属種(*Nanophyetus spp.*)、オピストルキス属種(*Opisthorchis spp.*)、クロノルキス属種(*Clonorchis spp.*)、メトルキス属種(*Metorchis spp.*)、ヘテロフィエス属種(*Heterophyes spp.*)、メタゴニムス属種(*Metagonimus spp.*)；

線虫類：ベンチュウ目(*Trichinellida*)の、例えば：トリクリス属種(*Trichuris spp.*)、カピラリア属種(*Capillaria spp.*)、パラカピラリア属種(*Paracapillaria spp.*)、エウコレウス属種(*Eucoleus spp.*)、トリコモソイデス属種(*Trichomosoides spp.*)、トリキネラ属種(*Trichinella spp.*)；
10

クセンチュウ目(*Tylenchida*)の、例えば：ミクロネマ属種(*Micronema spp.*)、ストロンギロイデス属種(*Strongyloides spp.*)；

カンセンチュウ目(*Rhabditida*)の、例えば：ストロンギルス属種(*Strongylus spp.*)、トリオドントホルス属種(*Triodontophorus spp.*)、オエソファゴドンツス属種(*Oesophagodontus spp.*)、トリコネマ属種(*Trichonema spp.*)、ギアロセファルス属種(*Gyalocephalus spp.*)、シリンドロファリンキス属種(*Cylindropharynx spp.*)、ポテリオストムム属種(*Poteriostomum spp.*)、シクロコセルクス属種(*Cyclococercus spp.*)、シリコステファヌス属種(*Cylicostephanus spp.*)、オエソファゴストムム属種(*Oesophagostomum spp.*)、カベルチア属種(*Chabertia spp.*)、ステファンス属種(*Stephanurus spp.*)、アンシロストマ属種(*Ancylostoma spp.*)、ウンシナリア属種(*Uncinaria spp.*)、ネカトル属種(*Necator spp.*)、ブノストムム属種(*Bunostomum spp.*)、グロボセファルス属種(*Globocephalus spp.*)、シンガムス属種(*Syngamus spp.*)、シアトストマ属種(*Cyathostoma spp.*)、メタストロンギルス属種(*Metastrongylus spp.*)、ジクチオカウルス属種(*Dictyocaulus spp.*)、ムエリエリウス属種(*Muellierius spp.*)、プロトストロンギルス属種(*Protostrongylus spp.*)、ネオストロンギルス属種(*Neostrongylus spp.*)、シストカウルス属種(*Cystocaulus spp.*)、プネウモストロンギルス属種(*Pneumostrongylus spp.*)、スピコカウルス属種(*Spicocaulus spp.*)、エラホストロンギルス属種(*Elaphostrongylus spp.*)、パレラホストロンギルス属種(*Paralaphostrongylus spp.*)、クレノソマ属種(*Creynosoma spp.*)、バラクレノソマ属種(*Paracrenosoma spp.*)、オスレルス属種(*Oslerus spp.*)、アンギオストロンギルス属種(*Angiostrongylus spp.*)、アエルロストロンギルス属種(*Aeluroststrongylus spp.*)、フィラロイデス属種(*Filaroides spp.*)、パラフィラロイデス属種(*Parafilaroides spp.*)、トリコストロンギルス属種(*Trichostrongylus spp.*)、ハエモンクス属種(*Haemonchus spp.*)、オステルタギア属種(*Ostertagia spp.*)、テラドルサギア属種(*Teladorsagia spp.*)、マルシャラギア属種(*Marshallagia spp.*)、クーペリア属種(*Cooperia spp.*)、ニッポストロンギルス属種(*Nipponostrongylus spp.*)、ヘリグモソモイデス属種(*Heligmosomoides spp.*)、ネマトジルス属種(*Nematodirus spp.*)、ヒオストロンギルス属種(*Hyostrongylus spp.*)、オベリスコイデス属種(*Obeliscoides spp.*)、アミドストムム属種(*Amidostomum spp.*)、オルラヌス属種(*Oll*
50

ulanus spp.);

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris spp.*)、エンテロビウス属種 (*Enterobius spp.*)、パサルルス属種 (*Passalurus spp.*)、シファシア属種 (*Syphacia spp.*)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris spp.*)、ヘテラキス属種 (*Heterakis spp.*)、アスカリス属種 (*Ascaris spp.*)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris spp.*)、トキソカラ属種 (*Toxocara spp.*)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris spp.*)、パラスカリス属種 (*Parascaris spp.*)、アニサキス属種 (*Anisakis spp.*)、アスカリジア属種 (*Ascaridia spp.*)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma spp.*)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera spp.*)、テラジア属種 (*Thelazia spp.*)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema spp.*)、ハブロネマ属種 (*Habronema spp.*)、パラブロネマ属種 (*Parabronema spp.*)、ドラスキア属種 (*Draschia spp.*)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus spp.*)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria spp.*)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria spp.*)、セタリア属種 (*Setaria spp.*)、ロア属種 (*Loa spp.*)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria spp.*)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides spp.*)、ブルギア属種 (*Brugia spp.*)、ウケレリア属種 (*Wuchereria spp.*)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca spp.*)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca spp.*);

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) : ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorrhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorrhynchus spp.*)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorhynchis spp.*) ; ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis spp.*) ; サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis spp.*) ;

コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば：アカントセファルス属種 (*Acanthocephalus spp.*)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus spp.*)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides spp.*);

舌形動物門 (*Pentastoma*) : ポロケファルス目 (*Poroccephalida*) の、例えば：リングアツラ属種 (*Linguatula spp.*)。

【0234】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式(I)で表される化合物は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口的経路、経皮的経路又は経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0235】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式(I)で表される化合物の使用である。

【0236】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (*helminthicidal agent*) 又は抗原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) としての、式(I)で表される化合物の使用である。式(I)で表される化合物は、例えば、動物育種において、畜産業において、動物小屋の中で、及び、衛生学の分野において、抗内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤又は抗原生動物剤として使用するのに、適している。

10

20

50

30

40

50

【0237】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式(I)で表される化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、動物小屋の中で、又は、衛生学の分野における、抗外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式(I)で表される化合物の使用に関する。

【0238】

駆虫性混合成分

以下の駆虫性混合成分を例として挙げることができる：

殺吸虫活性化合物 (trematocidal ly active compound 10) 及び殺条虫活性化合物 (cestocidal ly active compound) を包含する駆虫活性化合物：

大環状ラクトン系の、例えば、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、ネマデクチン、セラメクチン；

ベンゾイミダゾール系及びプロベンゾイミダゾール系の、例えば、アルベンダゾール、アルベンダゾール - スルホキシド、カムベンダゾール、シクロベンダゾール、フェバンテル、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、ネトビミニ (netobimin)、オキシフェンダゾール (oxfendazole)、オキシベンダゾール (oxibendazole)、パルベンダゾール (parbendazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネート (thiophanate)、トリクラベンダゾール (triclabendazole)；

シクロオクタデプチド系 (cyclooctadepsides) の、例えば、エモデプシド (emodepside)、PF1022；

アミノアセトニトリル誘導体系の、例えば、モネパンテル (monepantel)；

テトラヒドロピリミジン系の、例えば、モランテル、ピランテル、オキサンテル；

イミダゾチアゾール系の、例えば、ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

サリチルアニリド系の、例えば、プロモキサニド、プロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド、トリブロムサラン；

パラヘルクアミド系の、例えば、デルクアンテル、パラヘルクアミド；

アミノフェニルアミジン系の、例えば、アミダンテル、デアシリ化アミダンテル (dAMD)、トリベンジミジン；

有機リン酸エステル系の、例えば、クマホス、クルホメート、ジクロルボス、ハロキソン、ナフタロホス (naphthalofos)、トリクロルホン；

置換フェノール系の、例えば、ビチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン (menicolopholan)、ニトロキシニル；

ピペラジノン系の、例えば、プラジクアンテル (praziquantel)、エブシプランテル；

さまざまな別の系の、例えば、アモスカネート (amoscanate)、ベフェニウム、ブナミジン、クロナゼパム、クロルスロン、ジアンフェネチド、ジクロロフェン、ジエチルカルバマジン、エメチン、ヘトリン (hetolin)、ヒカントン、ルカントン、ミラシル (Miracil)、ミラサン (mirasan)、ニクロサミド、ニリダゾール、ニトロキシニル (nitroxynil)、ニトロスカネート、オルチプラス、オムファロチン、オキサムニキン、パロモマイシン、ピペラジン、レスランテル。

【0239】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物 (vector) の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (worms)、単細胞生物及び細菌類) を病原体保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) から宿主まで運ぶことが可能な節足動物 (特に、昆虫又はクモ形類動物) である。該病原体は

10

20

20

30

30

40

40

50

、宿主に機械的に運ばれ得る（例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ）、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る（例えば、蚊によるマラリア原虫）。

【0240】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

(1) 蚊類

- ・ ハマダラカ (*Anopheles*) : マラリア、フィラリア症；

- ・ アカイエカ (*Culex*) : 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、蠕虫類の運搬；

- ・ ヤブカ (*Aedes*) : 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患；

- ・ ブユ (*Simuliidae*) : 蠕虫類（特に、回旋糸状虫 (*Oncoceracavolvulus*)）の運搬；

(2) シラミ類：皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類：伝染病、発疹熱；

(4) ハエ類：睡眠病（トリパノソーマ病）；コレラ、別の細菌性疾患；

(5) ダニ類：ダニ症 (*acariosis*)、流行性発疹チフス、リケッチャ痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (*boreliosis*)；

(6) マダニ類：ボレリア症 (*borelioses*)、例えば、ダットン回帰熱ボレリア (*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (*Coxiella burnetii*)、バベシア症 (*Babesia canis canis*)。 20

【0241】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0242】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び／又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類〔特に、ヤブカ属 (*Aedes*) の蚊、ハマダラカ属 (*Anopheles*) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (*A. gambiae*)、アノフェレス・アラビエンシス (*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネスツス (*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス (*A. dirus*)（マラリア）、及び、アカイエカ属 (*Culex*) の蚊〕、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。 30

【0243】

式 (I) で表される化合物が抵抗性を打破する (resistance-breaking) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0244】

式 (I) で表される化合物は、疾患の予防及び／又は媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、林業において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式 (I) で表される化合物の使用である。 40

【0245】

工業材料の保護

式 (I) で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目 (*Coleoptera*)、ハチ目 (*Hymenoptera*)、シロアリ目 (*Isoptera*)、チョウ目 (*Lepidoptera*)、チャタテムシ目 (*Psocoptera*) 及びシミ目 (*Zygentoma*) の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0246】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及び塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0247】

さらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び/又は少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0248】

さらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、即時使用可能な(ready-to-use)有害生物防除剤として存在している。即ち、それは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能である。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。10

【0249】

驚くべきことに、式(I)で表される化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式(I)で表される化合物は、単独で、又は、別の活性化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0250】

衛生分野における動物有害生物の防除

式(I)で表される化合物は、衛生分野において動物有害生物を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、及び貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間(例えば、住居、工場の通路、オフィス及び車両の客室)において遭遇する昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除する為に、使用することができる。動物有害生物を防除するために、式(I)で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性化合物及び/又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式(I)で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。20

【0251】

これらの有害生物としては、例えば、クモ綱(Arachnida)のサソリ目(Scorpiones)、クモ目(Araneae)及びザトウムシ目(Opiliones)の有害生物、ムカデ綱(Chilopoda)及びヤスデ綱(Diplopoda)の有害生物、昆虫綱(Insecta)のゴキブリ目(Blattodea)、コウチュウ目(Coleoptera)、ハサミムシ目(Dermaptera)、ハエ目(Diptera)、カメムシ亜目(Heteroptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、シラミ目(Phthiraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(Saltatoria 又は Orthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びシミ目(Zygentoma)の有害生物、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の有害生物などをあげることができる。30

【0252】

施用は、例えば、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)及び防虫ゲル(moth gels)において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。

【0253】

1020304050

調製方法及び中間体の説明

以下の調製実施例及び使用実施例によって本発明について例証するが、それらの実施例は、本発明を限定するものではない。生成物は、¹H NMR分光法及び／又はLC-MS（液体クロマトグラフィー・質量分析法）によって特徴付けを行った。

【0254】

$\log P$ 値は、「OECD Guideline 117 (EC Directive 92/69/EEC)」に従い、下記方法によって、逆相(RP)カラム(C18)を用いるHPLC（高性能液体クロマトグラフィー）によって求めた：

[a] 酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、移動相として0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル(0.1%ギ酸含有)を使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 2.7で実施した。
10

【0255】

[b] 中性範囲内におけるLC-MSの測定は、移動相として0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液及びアセトニトリルを使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 7.8で実施した。

【0256】

較正は、 $\log P$ 値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン(3個～16個の炭素原子を有している)を用いて実施した($\log P$ 値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて測定する)。

【0257】

NMRスペクトルは、フロープローブヘッドを備えた「Bruker II Avance 400」(体積60 μ L)を用いて測定した。個々の場合において、NMRスペクトルは、「Bruker Avance II 600」を用いて測定した。
20

【0258】

選択された実施例に関するNMRデータは、古典的な形態(δ 値、多重項分裂、水素原子の数)で記載されている。シグナルの分離は、以下のように記載した：s(一重線)、d(二重線)、t(三重線)、q(四重線)、quint(五重線)、m(多重線)、br(広幅のシグナルの場合)。使用した溶媒は、CD₃CN、CDCl₃又はD₆-DMSOであり、テトラメチルシラン(0.00 ppm)を対照標準とし使用した。

【0259】

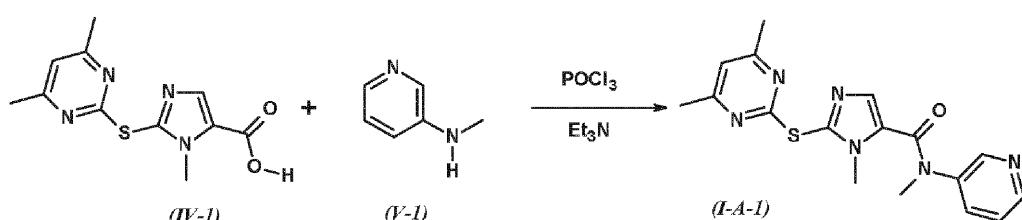
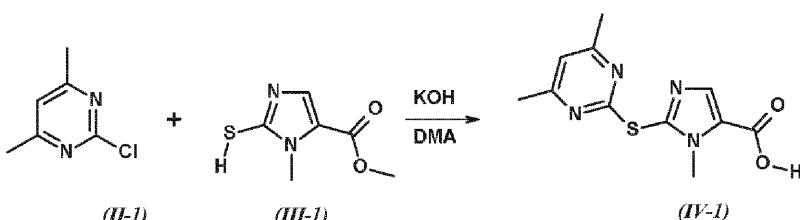
[実施例]

調製実施例

調製方法A及び調製方法B

実施例(I-A-1)

【化17】



【0260】

化合物(I-V-1)の調製

20

30

40

50

1.46 g (10 mmol) の 2 - クロロ - 4 , 6 - ジメチルピリミジン、0.62 g (11 mmol) の粉末状水酸化カリウム及び 1.72 g (10 mmol) の 1 - メチル - 2 - スルファニルイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルを 30 mL のジメチルアセトアミド (DMA) の中に合し、120 °C の温度で一晩攪拌した。溶媒をロータリーエバポレーターで減圧下で除去し、その残渣を取って水と塩化メチレンの中に入れ、抽出した。その水相を 2 N 塩酸で酸性化し、その沈澱物を吸引濾過し、そして、乾燥させた。収量：443 mg (理論値の 15.8 %)。

【0261】

log P [a] : 0.81;

¹H-NMR (¹³C-DMSO, 400 MHz); δ = 2.30 (s, 6H), 3.34 (s, 3H), 7.07 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 13.19 (s, br, 1H) ppm.

【0262】

調製実施例 (I-A-1)

15 mL の無水テトラヒドロフラン (THF) の中に、室温で、0.339 g (1.18 mmol) の化合物 (IV-1) を最初に装入し、0.17 mL (1.18 mmol) のトリエチルアミンを添加した。その混合物を 5 分間攪拌し、次いで、0.14 g (1.3 mmol) の 3 - メチルアミノピリジンを添加し、その混合物をさらに 15 分間攪拌した。次いで、0.46 mL (3.31 mmol) のトリエチルアミンを添加し、その後、直ぐに、0.11 g (0.71 mmol) のオキシ塩化リンを滴下して加え、次いで、その混合物を環流しながら 30 分間沸騰させた。その混合物を減圧下で濃縮し、その残渣を水 / アセトニトリルの移動相勾配を使用する RP 中圧カラムクロマトグラフィーで精製した。収量：77 mg (理論値の 17.7 %)。

【0263】

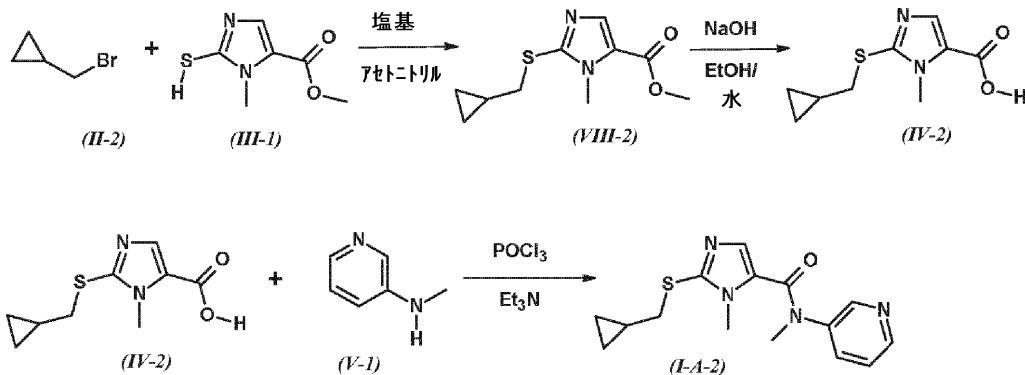
log P [a] : 1.31; log P [n] : 1.41;

¹H-NMR (¹³C-CD₃CN, 400 MHz); δ = 2.32 (s, 6H), 3.43 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 6.43 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 7.36 - 7.39 (m, 1H), 7.70 - 7.73 (m, 1H), 8.41 - 8.42 (d, 1H), 8.45 - 8.47 (m, 1H) ppm.

【0264】

実施例 (I-A-2)

【化18】



【0265】

化合物 (VIII-2) の調製

0.81 g (6 mmol) のシクロプロピルメチルブロミド、0.83 g (6 mmol) の粉末状炭酸カリウム及び 0.861 g (5 mmol) の 1 - メチル - 2 - スルファニルイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルを 20 mL のアセトニトリルの中で合し、その混合物を攪拌しながら 5 時間加熱環流した。酸性 MeOH 中で溶解させることによって白色の粉末が沈澱し、その白色の粉末を吸引濾過し、次いで、移動相としてシクロヘキサン / 酢

10

20

30

40

50

酸エチル(1:1)を使用するシリカゲルMPLCで精製した。収量: 210mg(理論値の18.6%)。

【0266】

$\log P[a] : 2.06$; $\log P[n] : 2.26$;

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.26 - 0.30$ (m, 2H), 0.56 - 0.61(m, 2H), 1.10(cm, 1H), 3.37 - 3.47(m, 2H), 3.88(s, 3H), 3.96(s, 3H), 7.97(s, 1H) ppm.

【0267】

化合物(IV-2)の調製

5mLのエタノールの中の0.210g(0.928mmol)の化合物(VIII-2)と0.186g(0.928mmol)の20%強度水酸化ナトリウム水溶液を40で1時間攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させ、その残渣を1mLの水に溶解させ、1N HClを用いてpH2に調節した。その溶液を減圧下で濃縮し、その残渣を水/アセトニトリルの勾配を使用するRPC-MPLCで精製した。収量: 155mg(理論値の78.7%)。

【0268】

$\log P[a] : 0.62$; $\log P[n] : -0.18$;

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.23 - 0.26$ (m, 2H), 0.52 - 0.56(m, 2H), 1.12(cm, 1H), 3.08 - 3.10(d, 2H), 3.77(s, 3H), 7.66(s, 1H) ppm.

【0269】

実施例(I-A-2)の調製

10mLの無水テトラヒドロフラン(THF)の中に、室温で、0.14g(0.66mmol)の化合物(IV-2)を最初に装入し、0.1mL(0.66mmol)のトリエチルアミンを添加した。その混合物を5分間攪拌し、次いで、0.078g(0.73mmol)の3-メチルアミノピリジンを添加し、その混合物をさらに15分間攪拌した。次いで、0.26mL(1.85mmol)のトリエチルアミンを添加し、その後、直ぐに、0.061g(0.4mmol)のオキシ塩化リンを滴下して加え、次いで、その混合物を環流しながら30分間沸騰させた。その混合物を減圧下で濃縮し、その残渣を移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル(1:1)を使用するシリカゲルMPLCで精製した。収量: 35mg(理論値の14%)。

【0270】

$\log P[a] : 1.28$; $\log P[n] : 1.81$;

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz); $\delta = 0.12 - 0.16$ (m, 2H), 0.47 - 0.51(m, 2H), 1.03(cm, 1H), 2.94 - 2.96(d, 2H), 3.38(s, 3H), 3.74(s, 3H), 6.25(s, 1H), 7.34 - 7.38(m, 1H), 7.66 - 7.69(m, 1H), 8.410 - 8.415(d, 1H), 8.45 - 8.46(m, 1H) ppm.

【0271】

調製方法Bに関する中間体の調製

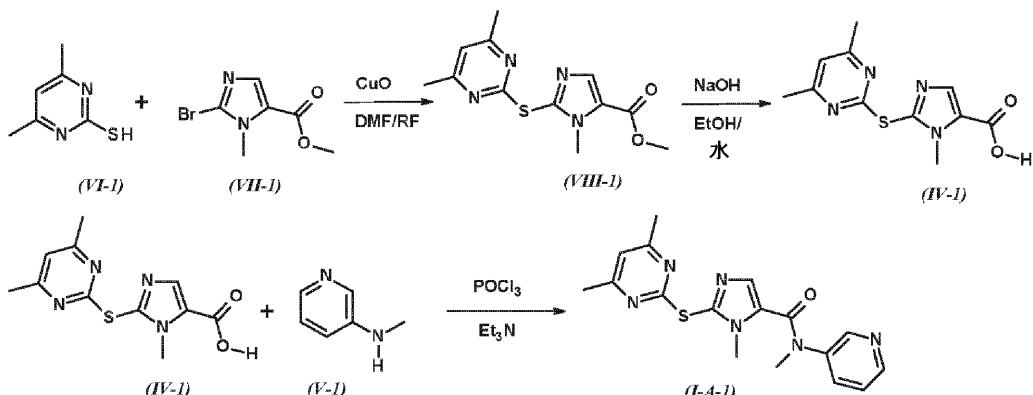
10

20

30

40

【化19】



【0272】

化合物(VIII-1)の調製

アルゴン下、60mLの乾燥ジメチルホルムアミド(DMF)の中で、0.7g(5mmol)の2-メルカプト-4,6-ジメチルピリミジンと0.75g(5.25mmol)の酸化銅(I)と1.1g(5mmol)の1-メチル-2-プロモイミダゾール-5-カルボン酸メチルを合し、その混合物を環流しながら一晩加熱した。室温まで冷却した後、その反応混合物をセライトを通して吸引濾過し、酢酸エチル及び高温メタノールで洗浄した。その濾液をEDTA溶液で抽出し、その有機相を分離し、溶媒を減圧下で蒸発させ、その残渣を移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル(1:1)を使用するシリカゲルMPLCで精製した。収量：247mg(理論値の17.3%)。

20

【0273】

$\log P[a] : 1.78$; $\log P[n] : 1.80$;
 $^1\text{H-NMR}(\text{CD}_3\text{CN}, 400\text{MHz})$; $\delta = 2.23(\text{s}, 6\text{H}), 3.85(\text{s}, 3\text{H}), 3.87(\text{s}, 3\text{H}), 6.92(\text{s}, 1\text{H}), 7.77(\text{s}, 1\text{H})\text{ppm}$ 。

【0274】

化合物(IV-1)の調製

10mLのエタノールの中の0.396g(1.42mmol)の化合物(VIII-1)と0.28g(1.42mmol)の20%強度水酸化ナトリウム水溶液を40℃で1時間攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させ、その残渣を2mLの水に溶解させ、1N HClを用いてpH2に調節した。その沈澱物を吸引濾過し、そして、乾燥させた。収量：339mg(理論値の83%)。

30

【0275】

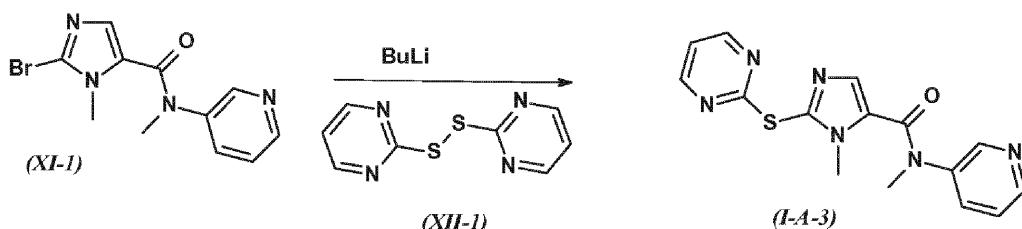
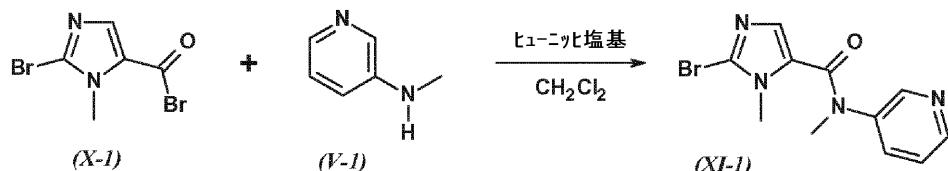
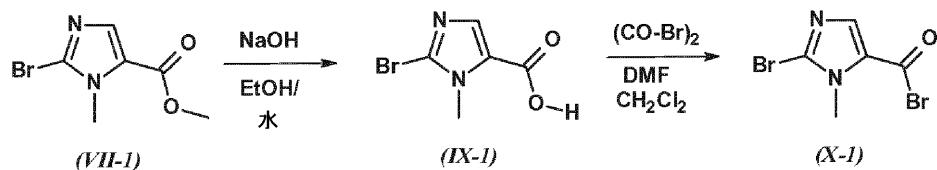
$\log P[a] : 0.81$;
 $^1\text{H-NMR}(\text{CD}_3\text{CN}, 400\text{MHz})$; $\delta = 2.23(\text{s}, 6\text{H}), 3.86(\text{s}, 3\text{H}), 6.92(\text{s}, 1\text{H}), 7.77(\text{s}, 1\text{H})\text{ppm}$ 。

【0276】

調製方法C-1実施例(I-A-3)

40

【化20】



【0277】

化合物(I X - 1)の調製

1 g (4.565 mmol) の 1 - メチル - 2 - ブロモイミダゾール - 5 - カルボン酸メチル (VII-I) を 10 mL の エタノール に 溶解させ、5.48 mL の 1 N NaOH (a q.) を 添加し、その混合物を 室温で 60 分間 搅拌した。5.5 mL の 1 N HCl (a q.) を 添加した (pH を 約 3 に 調節) 後、白色の沈澱物が 形成された。その混合物を 濃縮乾燥させ、そして、超音波浴の中で、6 mL の 水 に 懸濁させた。その白色の結晶を 濾過し、2 mL の 水 で 洗浄した。その母液を 殆ど 乾燥するまで 濃縮した。その結晶を 吸引濾過し、少量の水で 洗浄した。それらの結晶を 合して オイルポンプによる 減圧下で 乾燥させた。収量：890 mg (理論値の 95%)。

【0278】

10 g P [a] : 0.31;

¹H-NMR (d₆-DMSO, 400 MHz); δ = 3.82 (s, 3H), 7.60 (s, 1H), 13.15 (s, 1H) ppm.

【0279】

化合物(X-1)の調製

890 mg (4.341 mmol) の 1 - メチル - 2 - ブロモイミダゾール - 5 - カルボン酸 (IX-1) を 15 mL の ジクロロメタン に 懸濁させた 懸濁液 に、シリジカニューレを 用いて、約 60 mg の DMF を 添加した。室温で、940 mg (4.341 mmol) の 臭化オキサリルを 添加し、それによって、ガスが 激しく 発生した。その翌日、追加の 10 mL の ジクロロメタン 及び 140 mg の 臭化オキサリルを 添加した。室温で 1 時間 搅拌した 後、追加の 110 mg の 臭化オキサリル 及び 30 mg の DMF を 添加し、その混合物を 室温でさらに 1 時間 搅拌した。LC/MS によって、96% 変換したことが 示された。その懸濁液は、それ以上後処理に付すことなく、化合物 (XI-1) を 合成するため 使用した。

【0280】

化合物(XI-1)の調製

14.02 g (40.19 mmol) の 1 - メチル - 2 - ブロモイミダゾール - 5 - カルボニルプロミド (X-1) を 80 mL の ジクロロメタン に 懸濁させ、その懸濁液を 0

10

20

30

40

50

まで冷却した。4.35 g (40.19 mmol) の 3-メチルアミノピリジン (V-1) と 41 mL (241.2 mmol) のヒューニッヒ塩基を 40 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液を 0 度で添加した。その混合物を室温で 1 時間攪拌し、次いで、環流しながら 4 時間沸騰させ、そして、室温で一晩放置した。その混合物を減圧下で濃縮した。その残渣を取って 500 mL のジクロロメタンの中に入れ、合計で 400 mL の水を用いて 3 回洗浄した（約 200 mL で 2 回、及び、約 100 mL で 1 回）。その水相を合して約 50 mL のジクロロメタンで抽出し、その有機相を合した。その合した有機相を NaHCO₃ 水溶液 (3.5 g の NaHCO₃ を 150 mL の水に溶解させた溶液) で 2 回洗浄した。その水相を合して約 50 mL のジクロロメタンで抽出し、そして、その有機相を合し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。収量：10.45 g (理論値の 81.9%) の褐色の粘性油状物 (LC/MS による純度 93%)。 10

【0281】

log P [a] : 0.65; log P [n] : 0.93;

¹H-NMR (d₆-DMSO, 400 MHz); δ = 3.37 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.25 (s, 1H), 7.43 - 7.47 (m, 1H), 7.84 - 7.87 (m, 1H), 8.48 - 8.49 (m, 1H), 8.52 (m, 1H) ppm.

【0282】

化合物 (I-A-3)

0.54 g (1.83 mmol) の化合物 (XI-1) を 5 mL の THF に溶解させ、その溶液を -70 度未満まで冷却した。その温度で、ヘキサン中の n-BuLi の 2.5 モル溶液 0.75 mL (1.83 mmol) を 10 分間かけて滴下して加え、その混合物をさらに 15 分間攪拌した。次いで、5 mL の THF に溶解させた 0.407 g の化合物 (XI-1) を滴下して加えた。その混合物を -70 度未満でさらに 45 分間攪拌した。-70 度で、その混合物を塩化アンモニウム溶液でクエンチし、生成物をジクロロメタンで抽出し、その溶液を乾燥させ、減圧下で濃縮した。その残渣を、移動相として塩化メチレン / エタノールの勾配を使用するシリカゲル MPLC で単離した。収量：113 mg (理論値の 17%)。 20

【0283】

log P [a] : 0.69; log P [n] : 0.98;

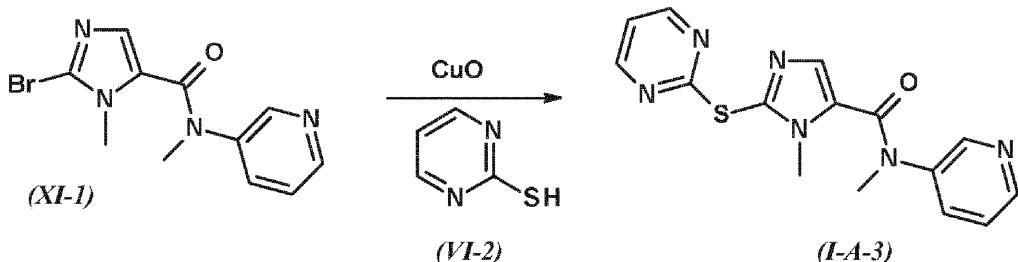
¹H-NMR (d₆-DMSO, 400 MHz); δ = 3.41 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.49 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 7.32 - 7.34 (t, 1H), 7.45 - 7.48 (m, 1H), 7.84 - 7.86 (m, 1H), 8.48 - 8.50 (m, 1H), 8.51 - 8.53 (m, 1H), 8.63 - 8.64 (d, 2H) ppm.

【0284】

調製方法 C-2

化合物 (I-A-3)

【化21】



【0285】

12 mL の乾燥ジメチルホルムアミド (DMF) の中に 0.456 g (4.066 mmol) の 2-メルカプトピリミジンと 0.64 g (4.473 mmol) の酸化銅 (I) と 1.2 g (4.066 mmol) の化合物 (XI-1) を含し、環流しながら 3 時間加 40

熱した。室温まで冷却した後、その反応混合物をセライトで濾過し、溶媒を減圧下で蒸発させ、その残渣を移動相としてジクロロメタン／メタノールの勾配を使用するシリカゲル M P L C で精製した。収量：408 mg（理論値の30%）。

[0 2 8 6]

l o g P [n] : 0 . 9 8 ;

¹ H - N M R (d₆ - D M S O , 4 0 0 M H z) ; δ = 3 . 4 1 (s , 3 H) , 3 . 7 5 (s , 3 H) , 6 . 4 9 (s , 1 H) , 6 . 9 0 (s , 1 H) , 7 . 3 2 - 7 . 3 4 (t , 1 H) , 7 . 4 5 - 7 . 4 8 (m , 1 H) , 7 . 8 4 - 7 . 8 6 (m , 1 H) , 8 . 4 8 - 8 . 5 0 (m , 1 H) , 8 . 5 1 - 8 . 5 3 (m , 1 H) , 8 . 6 3 - 8 . 6 4 (d , 2 H) p p m .

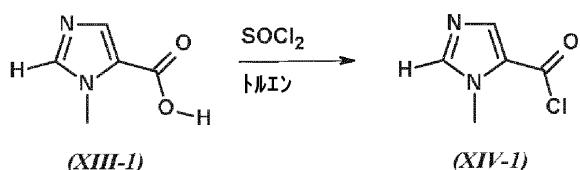
10

[0 2 8 7]

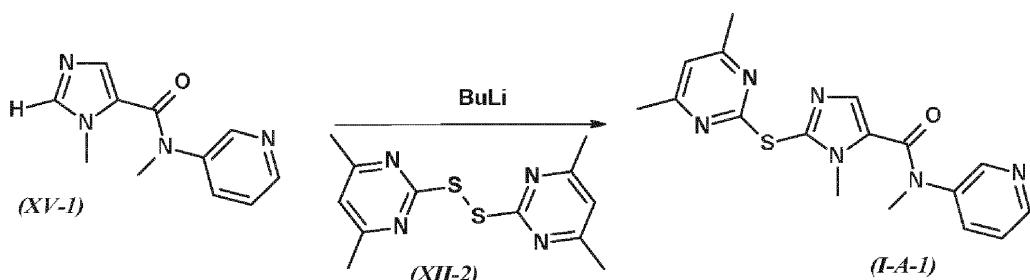
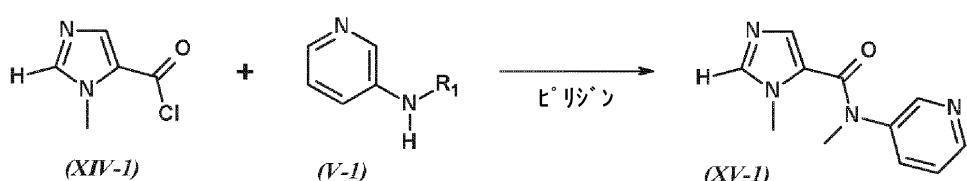
調製方法 D

化合物(I-A-1)

【化 2 2】



30



30

[0 2 8 8]

化合物(XV-1)の調製

12 g (95.2 mmol) の 1 - メチルイミダゾール - 5 - カルボン酸 (XIII-1) を 72 mL のトルエンに懸濁させた懸濁液に 12.71 g (104.7 mmol) の塩化チオニルを添加し、その混合物を 130 °C で一晩攪拌した。その反応混合物を減圧下で濃縮した。その残渣に、10.3 g (95.2 mmol) の 3 - メチルアミノピリジン (V-1) を 72 mL のピリジンに溶解させた溶液を添加し、得られた反応混合物を 115 °C で 4 時間加熱した。次いで、その混合物を減圧下で再度濃縮し、その残渣を移動相としてアセトニトリル / メタノール (3 : 1) を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。これによって、8.1 g (理論値の 39.3%) の標題化合物 (XV-1) 及び 9.5 g (理論値の 37.1%) の標題化合物の HCl 塩が得られた。

40

【 0 2 8 9 】

l o g P [n] : 0 . 4 2 ;

¹ H - N M R (C D ₃ C N , 4 0 0 M H z) ; δ = 3 . 3 9 (s , 3 H) , 3 . 8 1 (s , 3 H) , 6 . 1 7 (s , 1 H) , 7 . 3 6 - 7 . 4 0 (m , 2 H) , 7 . 6 7 - 7 . 7

50

0 (m, 1 H), 8.41 (m, 1 H) 8.47 (m, 1 H) ppm.

【0290】

実施例(I-A-1)

0.500 g (2.31 mmol) の化合物(XV-1)を10 mLのTHFに溶解させ、その混合物を-85まで冷却した。反応中は、その温度を-82と-90の間に維持した。その温度で、n-ヘキサン中のn-BuLiの2.5モル溶液0.91 mL (2.4 mmol) を5分間かけて滴下して加え、その混合物をさらに10分間攪拌した。次いで、5 mLのTHFに懸濁させた0.407 gの化合物(XII-2)を3分間かけて滴下して加えた。その混合物を-85未満でさらに30分間攪拌した。1.5時間かけて、その混合物を0まで昇温させ、次いで、室温で一晩放置した。固体を吸引濾過し、ジクロロメタンで洗浄した。その濾液を減圧下で濃縮し、その残渣を移動相として酢酸エチル/メタノール(95:5)を使用するシリカゲルMPLCで精製した。これによって、200 mgの生成物(純度70%)が得られ、その生成物をRP-HPLC(アセトニトリル/水+0.1%辛酸)によってさらに精製した。精製することによって、105 mg(理論値の12.8%)が得られた。

【0291】

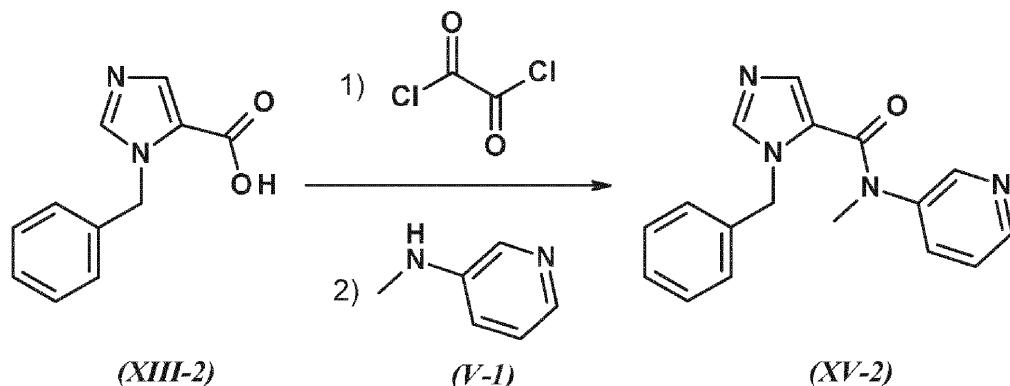
$\log P[a] : 1.26$; $\log P[n] : 1.46$;

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400 MHz); $\delta = 2.31$ (s, 6 H), 3.41 (s, 3 H), 3.74 (s, 3 H), 6.46 (s, 1 H), 7.06 (s, 1 H), 7.43 - 7.46 (m, 1 H), 7.85 - 7.87 (m, 1 H), 8.46 - 8.49 (m, 2 H) ppm.

【0292】

1-ベンジル-N-メチル-N-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボキサミド(化合物XV-2)の調製

【化23】



【0293】

[1-ベンジル-1H-イミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩(XIII-2)は、「*Tetrahedron* 2004, 60, 6079-6083」の手順に従って調製した] 1.00 g (4.94 mmol) の1-ベンジル-1H-イミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩(XIII-2)を1滴のジメチルホルムアミドを含んでいる10 mLのジクロロメタンに溶解させた。0.475 mL (5.44 mmol) の塩化オキサリルを滴下して加えた。その混合物を室温で3時間攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させた。その残渣に、0.535 g (4.94 mmol) のN-メチルピリジン-3-アミン(V-1)を7.2 mLのピリジンに溶解させた溶液を滴下して加え、その混合物を100で一晩攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させた。その残渣を8.3 mLのジクロロメタンに溶解させ、1.57 g (14.8 mmol) の炭酸ナトリウムを添加した。その混合物を室温で3時間攪拌し、次いで、濾過し、濃縮した。その残渣を、移動相として酢酸エチル/メタノールを使用するMPLCによって、シリカゲルで精製した。精製することによって、0.326 g(理論値の21.9%)が得られた。

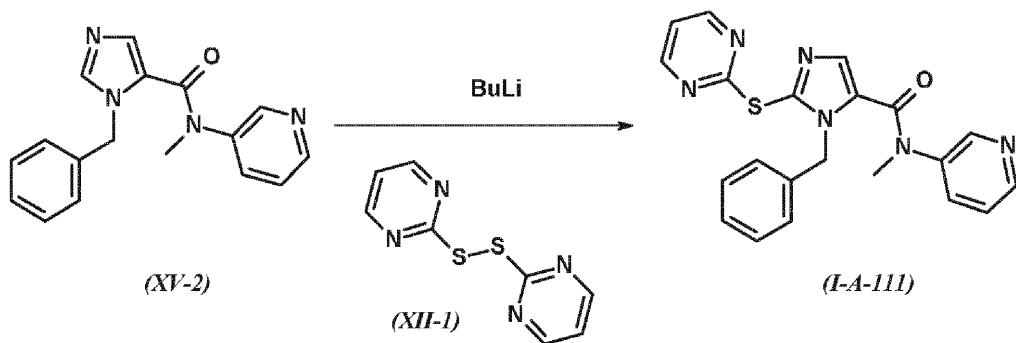
[0 2 9 4]

¹H - NMR (⁶DMSO, 400 MHz); δ = 3.26 (s, 3 H), 5.45 (s, 2 H), 6.27 (s, 1 H), 7.19 - 7.21 (m, 2 H), 7.30 - 7.42 (m, 5 H), 7.858 - 7.863 (m, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 8.40 - 8.41 (m, 1 H) ppm.

〔 0 2 9 5 〕

実施例 (I - A - 1 1 1) : 1 - ベンジル - N - メチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 2 - (ピリミジン - 2 - イルスルファニル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミド

【化 2 4 】



【 0 2 9 6 】

0.272 g (0.930 mmol) の 1-ベンジル-N-メチル-N-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボキサミド (XV-2) を 11 mL の THF に溶解させ、-90 ℃まで冷却した。反応中は、その温度を -85 ℃と -90 ℃の間に維持した。n-ヘキサン中の n-BuLi の 2.5 モル溶液 0.39 mL (0.977 mmol) を -90 ℃で 5 分間かけて滴下して加え、その混合物をさらに 5 分間攪拌した。次いで、1 mL の THF に溶解させた 0.620 g の 2,2'-ジスルファンジイルジピリミジン (2.79 mmol) (XI-1) を、5 分間かけて、滴下して加えた。その混合物を -80 ℃でさらに 30 分間攪拌し、次いで、30 分間かけて、室温まで昇温させた。その混合物を半濃重炭酸ナトリウム溶液 / ジクロロメタンで抽出した。その水相をジクロロメタンでさらに 3 回抽出した。その有機相を合し、少量の水で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、濃縮した。その残渣を移動相として酢酸エチル / メタノールを使用する HPLC によってシリカゲルで精製した。その所望のフラクションを移動相としてアセトニトリル / 水を使用する HPLC によって RP18 で精製した。精製することによって、140 mg (理論値の 35.1 %) が得られた。

【 0 2 9 7 】

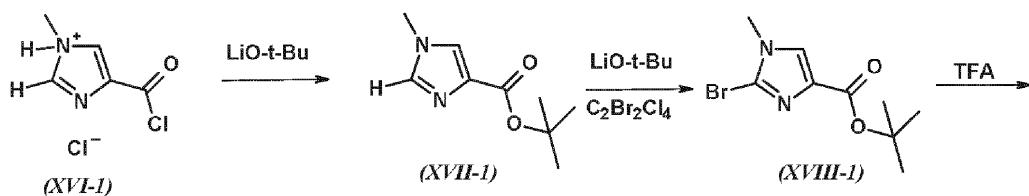
分析に関しては、表2を参照されたい。

【 0 2 9 8 】

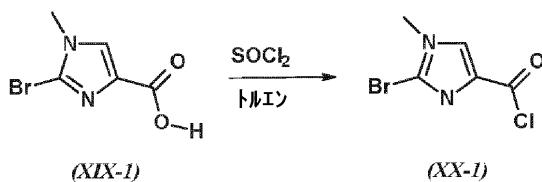
調製方法 E

実施例（I - B - 1）

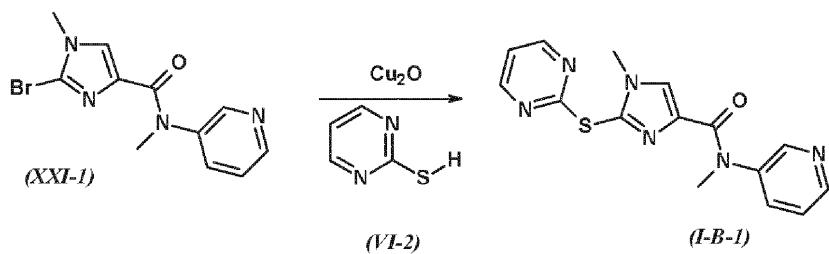
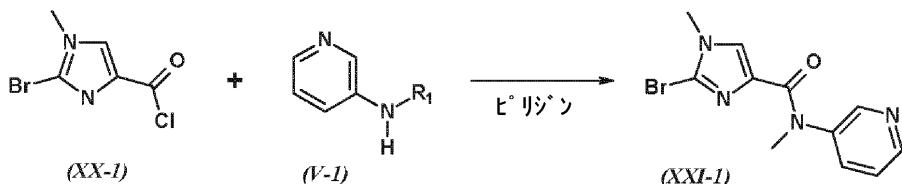
【化25】



Berliner et al., Org. Process Res. Dev., 2011 vol. 15, # 5
p. 1052 - 1062



10



20

【0299】

化合物(XVII-1)の調製

36.5 g (0.201 mol) の 1 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - カルボニルクロリド塩酸塩を 400 mL の テトラヒドロフランに 懸濁させた懸濁液に、アルゴン下、-40°で、攪拌しながら、33.9 g (0.493 mol) の リチウム *tert*-ブトキシドを 添加した。それ以上冷却することなく、次いで、その混合物を 12 時間攪拌した。170 g の 重炭酸ナトリウムを 添加した後、その混合物を 少量のシリカゲルで 濾過し、酢酸エチルで洗浄した。その有機相を合して蒸発させ、得られた残渣をジクロロメタンで抽出した。そのジクロロメタン相の蒸発残渣を 飽和重炭酸ナトリウム溶液と酢酸エチルの間で分配させ、その有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、蒸発させて、22.7 g の 1 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 *tert*-ブチル (収率 理論値の 73%) が得られた。

【0300】

log P [a] : 0.74 ;

¹H-NMR (CD₃CN, 400 MHz); δ = 1.52 (s, 9H), 3.66 (s, 3H), 7.43 (s, 1H), 7.54 (s, 1H) ppm.

【0301】

化合物(XVII-1)の調製

10 mL の テトラヒドロフラン (THF) の中に 0.5 g (2.744 mmol) の 1 - メチルイミダゾール - 4 - カルボン酸 *tert*-ブチル (XVII-1) を 最初に 装入し、0.894 g (2.744 mmol) の 1,2 -ジブロモ - 1,1,2,2 - テトラクロロエタンを 添加し、及び、0.88 g (1.1 mmol) の リチウム *tert*-ブトキシドを 室温で 添加した。その混合物を 室温で 一晩攪拌し、その反応生成物を 減圧下で濃縮し、その残渣を 移動相として アセトニトリル / 水 + 0.1% ギ酸を使用する RP18 上での MPLC で 精製した。収量： 250 mg (理論値の 34.8%)。

50

【0302】

log P [a] : 1.27 ;

¹H-NMR (CD₃CN, 400MHz) ; δ = 1.51 (s, 9H), 3.60 (s, 3H), 7.65 (s, 1H) ppm.

【0303】

化合物(XIX-1)の調製

室温で、645mg (2.47mmol) の2-ブロモ-1-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸tert-ブチルを、1.7gのトリフルオロ酢酸と7mLのジクロロメタンの混合物の中で12時間攪拌した。溶媒を除去した。得られた蒸発残渣は、95%の目標生成物2-ブロモ-1-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸で構成されていた。これは、実質的に定量的な収率に相当する。10

【0304】

log P [a] : 0.0 ;

¹H-NMR (CD₃CN, 400MHz) ; δ = 3.65 (s, 3H), 7.78 (s, 1H) ppm.

【0305】

化合物(XXI-1)の調製

681mg (3.32mmol) の2-ブロモ-1-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸を7mLのジクロロメタンと3滴のジメチルホルムアミドに溶解させた溶液に、0.32mLの塩化オキサリル (1.2eq.) を滴下して加えた。4時間経過した後、その混合物を蒸発乾燥させた。その残渣に、10mLのジクロロメタン、359mg (1eq.) のN-メチルピリジン-3-アミン及び6eq. のN,N-ジイソプロピルエチルアミンを添加し、次いで、その混合物を1時間攪拌した。次いで、その混合物を蒸発乾燥させ、その残渣を移動相として酢酸エチル/メタノールを使用するシリカゲルMPLCによるクロマトグラフィーに付した。収量：411mg (理論値の43%)。20

【0306】

log P [n] : 0.76 ;

¹H-NMR (CD₃CN, 400MHz) ; δ = 3.41 (s, 3H); 3.51 (s, 3H), 7.28 - 7.35 (m, 2H), 7.59 - 7.61 (m, 1H), 8.37 - 8.43 (m, 2H) ppm.30

【0307】

化合物(I-B-1)の調製

250mg (0.618mmol) の化合物(XXI-1)と69mg (0.618mmol) の2-メルカプトピリミジンを圧延フランジベッセルの中で合し、150℃で2時間攪拌した。その混合物を飽和EDTA溶液で洗浄し、酢酸エチルで3回抽出した。その有機溶液を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。その残渣を移動相として酢酸エチル/メタノールの勾配を使用するシリカゲルMPLCで精製した。収量：65mg (理論値の30.6%)。

【0308】

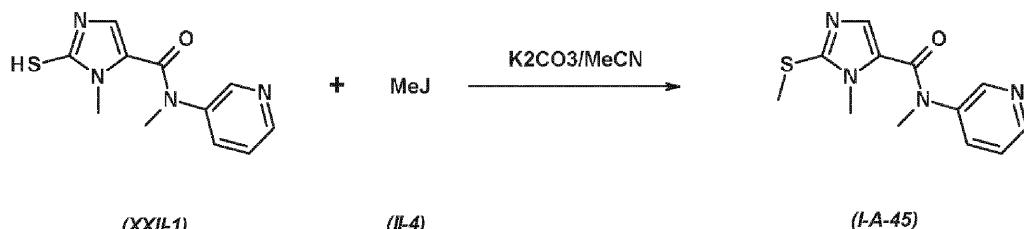
log P [a] : 0.42; log P [n] : 0.83;

¹H-NMR (CD₃CN, 400MHz) ; δ = 3.47 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 7.15 (m, 1H), 7.30 (br.s, 1H), 7.54 (br.s, 1H), 7.60 (br.d, 1H), 8.39 (br.s, 2H), 8.48 - 8.49 (m, 2H) ppm.40

【0309】

調製方法F実施例(I-A-45)

【化26】



【0310】

アルゴン下、10 mLのアセトニトリルの中の0.496 g (2 mmol)の化合物(XXII-1)と0.332 g (2.4 mmol)の炭酸カリウムと0.125 mL (2 mmol)のヨウ化メチルを環流しながら1時間沸騰させた。その反応混合物を減圧下で濃縮し、重炭酸ナトリウム溶液を添加し、その混合物を再度濃縮した。その残渣をエタノールと一緒に攪拌し、塩を濾過し、溶媒を蒸発させた。逆相クロマトグラフィーに付した後、その残渣によって237 mgの目標化合物(I-A-45)が得られた。

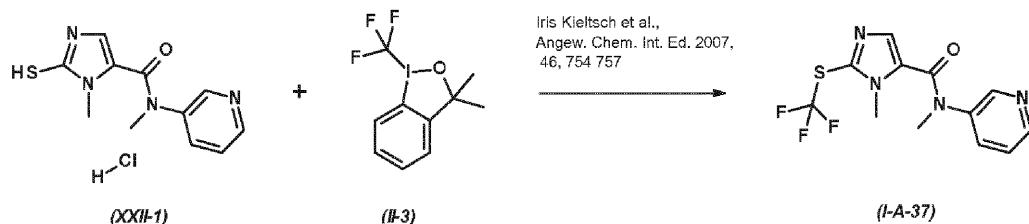
【0311】

分析に関しては、表2を参照されたい。

【0312】

実施例(I-A-37)

【化27】



【0313】

アルゴン下、0.420 g (1.47 mmol)の化合物(XXII-1)塩酸塩を5 mLのメタノールに溶解させ、その混合物を-78まで冷却した。アルキル化剤(II-3) (2 eq.)を添加した後、その混合物を1時間攪拌し、次いで、室温まで昇温させ、1 mLの飽和塩化アンモニウム溶液を添加し、その混合物を完全に濃縮した。その残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付した後、220 mgの目標化合物(I-A-37)が得られた。

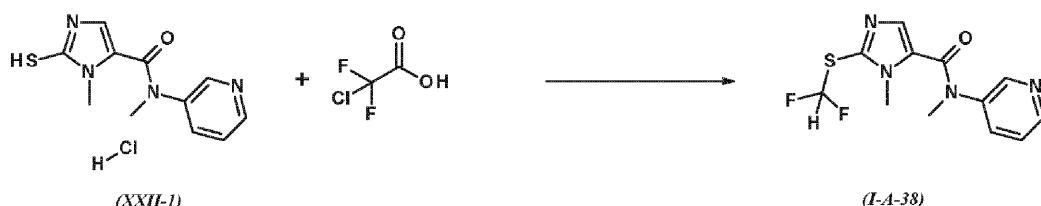
【0314】

分析に関しては、表2を参照されたい。

【0315】

実施例(I-A-38)

【化28】



【0316】

0.200 g (0.70 mmol)の化合物(XXII-1)塩酸塩を10 mLのジメチルホルムアミドに溶解させ、そして、攪拌しながら、3 eq.の炭酸カリウム及び2 eq.のクロロジフルオロ酢酸ナトリウムを添加した。95で3時間加熱した後、その混合物を室温まで冷却し、完全に濃縮した。その残渣を取って10 mLのメタノールの中に

10

20

30

40

50

入れ、その混合物をセライトで濾過した。その濾液を完全に濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーに付して、5.6 mg の目標化合物（I-A-38）が得られた。

[0 3 1 7]

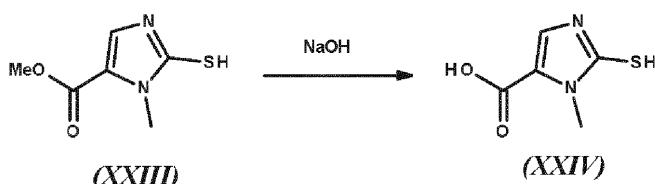
分析に関しては、表2を参照されたい。

(0 3 1 8)

化合物 (X X I I - 1) へと至る合成経路

化合物 (X X I V)

【化 2 9】



10

【 0 3 1 9 】

428 g (2.49 mol) の市販されている化合物 (XXII) を、2.8 L の 3 M 水酸化ナトリウム水溶液の中で、15 分で 30 分間攪拌した。次いで、6 M 塩酸を使用して、pH を 1 - 2 に調節し、そして、沈澱物を吸引濾過した。乾燥させることによって、363 g の化合物 (XXIV) が得られた。

[0 3 2 0]

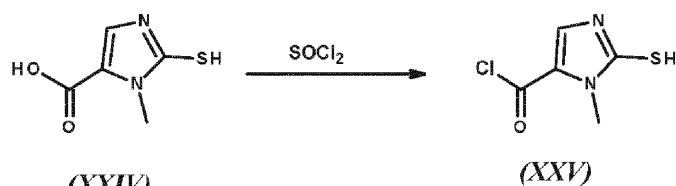
20

¹H-NMR (400 MHz, CD₃OD) : δ = 3.82 (s, 3 H), 7.58 (s, 1 H).

[0 3 2 1]

化合物 (X X V)

【化 3 0】



30

[0 3 2 2 1]

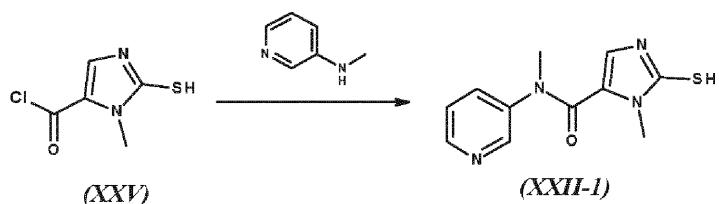
3.2 L のジクロロメタンと 30 mL のジメチルホルムアミドの中に 400 g (2.5 mol) の化合物 (XXIV) を最初に装入した。1.2 L の塩化チオニルを滴下して加え、次いで、その混合物を 50 °C で 2 時間攪拌した。その反応混合物を減圧下で濃縮した。これによって、580 g の粗製生成物が固体として得られた。この粗製生成物は、次の反応に直接使用した。

【0323】

化合物 (X X T T - 1)

【化 3.1】

40



【 0 3 2 4 】

106 g (601 mmol) の化合物 (XXV) (1.3 eq.) と 50 g (462 mmol) の 3-メチルアミノピリジン (1 eq.) を 750 mL のピリジンの中で 90 度で 1 時間攪拌した。次いで、その反応混合物を減圧下で濃縮し、その残渣を、100 : 1

から 5 : 1までのジクロロメタン / メタノールの勾配を使用して、シリカゲルで精製した。これによって、67.3 g の化合物 (XXII-1) が得られた。

【0325】

¹H-NMR (DMSO-d₆, 400 MHz); δ = 3.43 (s, 3H), 3.61 (s, 3H), 6.76 (s, 1H), 7.81 - 7.84 (m, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.67 (d, 1H), 8.91 (d, 1H)。

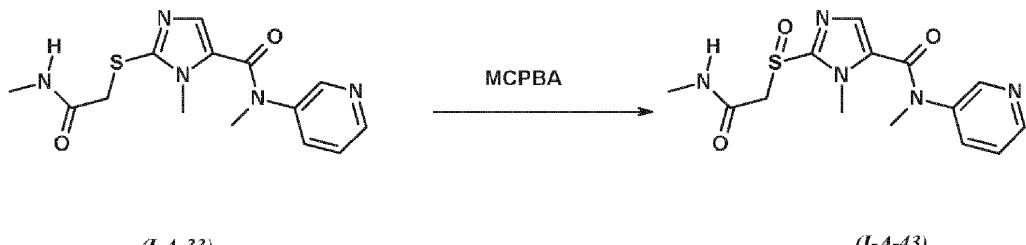
【0326】

調製方法 G

実施例 (I-A-43)

【化32】

10



【0327】

0.18 g (0.564 mmol) の化合物 (I-A-33) を 30 mL のジクロロメタンに溶解させ、そして、0 で攪拌しながら、順次、321 mg (2.82 mmol) のトリフルオロ酢酸及び 243 mg (1.41 mmol) の 3 - クロロペルオキシ安息香酸を添加した。その反応混合物を濃縮した。酢酸エチル / メタノールの勾配を使用するシリカゲルクロマトグラフィーに付して、62 mg の目標化合物 (I-A-43) が得られた。

20

【0328】

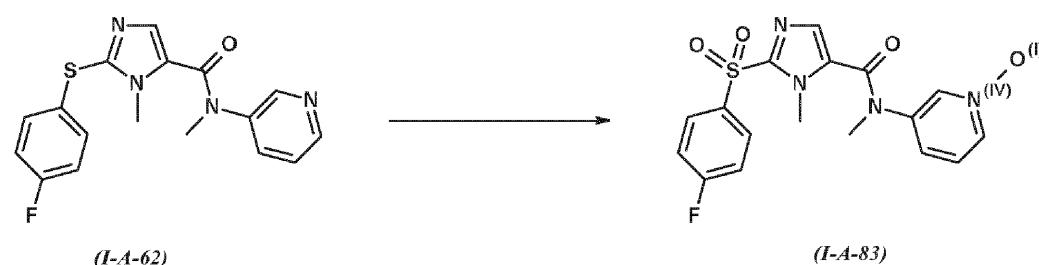
分析に関しては、表 2 を参照されたい。

【0329】

実施例 (I-A-83)

【化33】

30



【0330】

0.100 g (0.29 mmol) の化合物 (I-A-62) を 15 mL のジクロロメタンに溶解させ、そして、攪拌しながら、順次、5 eq. のトリフルオロ酢酸及び 2 eq. の 3 - クロロペルオキシ安息香酸を添加した。室温で 24 時間攪拌した後、追加の 1 eq. のトリフルオロ酢酸を添加し、その混合物をさらに 1 時間攪拌し、殆ど完全に濃縮し、そして、RPクロマトグラフィーに付した後、59 mg の目標化合物 (I-A-83) が得られた。

40

【0331】

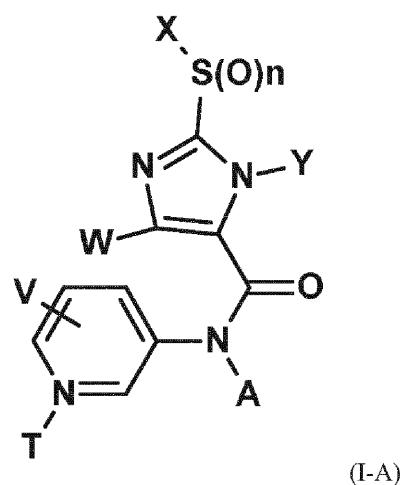
分析に関しては、表 2 を参照されたい。

【0332】

調製方法 A ~ 調製方法 D、調製方法 F 及び調製方法 G による方法と類似した方法で調製した式 (I) で表されるさらなる化合物が、下記表に記載されている。

【表 1】

式 (I-A) で表される化合物



10

〔式中、置換基は下記表において与えられている意味を有する〕

Ex. No.	X	n	W	Y	A	V	T
I-A-4	2-(4, 6-ジメチル)- ピリミジル-	0	H	CH ₃	H	H	電子対
I-A-5	n-ブチル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-6	n-ヘンチル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-7	ヘンジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-8	メチル	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-9	3-メチルチオフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-10	2, 2, 2-トリフルオロエチル -	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-11	フェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-12	4-メチルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-13	2-ビリミジル-	0	Br	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-14	エチルチオエチル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-15	2-ビリミジル-	0	Cl	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-16	2-ニトロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-17	シクロヘキシル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-18	-(CH ₂) ₂ -O-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-19	イソブロヒル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-20	-(CH ₂) ₃ -O-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-21	n-ブロヒル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-22	-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-23	-CH ₂ -CO-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-24	-CH ₂ -CO ₂ -C ₂ H ₅	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-25	-CH ₂ -CO ₂ -CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-26	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-27	アリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-28	-CH ₂ -CO-C(CH ₃) ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-29	-CH ₂ -CO ₂ H	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-30	ブロハニキル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-31	-CH ₂ -CO-シクロブロヒル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-32	-CH ₂ -CO-NH ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-33	-CH ₂ -CO-NH-CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対

10

20

30

40

50

I-A-34	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-35	3, 3-ジメチルアリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-36	エチル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-37	CF ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-38	CHF ₂	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-39	$-\text{CH}_2-\text{CNOCH}_3-\text{CH}_3$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-40	エチル	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-41	エチル	0	H	CH ₃	H	H	電子対
I-A-42	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_3$	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-43	$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_3$	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-44	メチル	0	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	電子対
I-A-45	メチル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-46	$-\text{CH}_2-\text{CF}_2-\text{CF}_2\text{Cl}$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-47	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-48	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{F}$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-49	$-\text{CH}_2-\text{CF}_2-\text{CHF}_2$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-50	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CF}_3$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-51	4-テトラヒドロ-チオビラニル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-52	4-テトラヒドロビラニル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-53	$-(\text{CH}_2)_2-\text{i-C}_3\text{F}_7$	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-54	3-オキセタニル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-55	5-オキサ-[3.3.0]-ビシクロヘプタン	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-56	2, 4, 5-トリクロロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-57	4-クロロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-58	4-メトキシフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-59	4-ジメチルアミノフェニル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-60	2, 5-ジクロロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-61	3-トリフルオロメチルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-62	4-フルオロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-63	4-tert-ブチルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対

10

20

30

40

50

I-A-64	4-クロ-3-トリフルオロメチルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-65	2-ビ ⁺ リジ ⁺ ル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-66	3-クロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-67	2-ジ ⁺ メチルアミノ-カロハ ⁺ モイルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-68	3-ニトロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-69	2-ジ ⁺ メチルアミノ-スルホニルフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-70	5-(2-クロ)-ビ ⁺ リジ ⁺ ル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-71	2-フルオロフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-72	2-メキシフェニル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-73	3-クロフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-74	3-クロフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-75	4-tert-ブ ⁺ チルフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-76	4-tert-ブ ⁺ チルフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-77	3, 5-ジ ⁺ クロロフェニル	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-78	3, 5-ジ ⁺ クロロフェニル	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-79	4-クロ-3-トリフルオロメチルフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-80	4-クロ-3-トリフルオロメチルフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-81	4-メキシフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-82	4-フルオロフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-83	4-フルオロフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	酸素
I-A-84	4-フルオロフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-85	2-ビ ⁺ リジ ⁺ ル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-86	2-ビ ⁺ リジ ⁺ ル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-87	フェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-88	フェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-89	4-ニトロフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-90	4-ニトロフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対

10

20

30

40

I-A-91	2-ジメチルアミノカルバモイルフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-92	2-ジメチルアミノカルバモイルフェニル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-93	4-メトキシフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-94	2-(5-フルオロ)ビリジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-95	3-トリフルオロメチルフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	酸素
I-A-96	3-トリフルオロメチルフェニル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-97	2-ビリミジル-	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-98	2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	電子対
I-A-99	2-ビリミジル-	2	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-100	2-(4-トリフルオロメチル)ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-101	2-(4-メチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-102	2-(4,6-ジメトキシ)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-103	2-(4,5-ジメチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-104	2-(5-メチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-105	2-(5-トリフルオロメチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-106	2-(4-メトキシ)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-107	2-(5-フルオロ)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-108	2-(6-メチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-109	2-(5-メチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-110	2-(3-トリフルオロメチル)-2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-111	2-ビリミジル-	0	H	Benzyl	CH ₃	H	電子対
I-A-112	-CH ₂ -2-ビリミジル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対

10

20

30

40

50

I-A-113	-CH ₂ -2-ヒリゾニル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-114	-CH ₂ -5-(1-メチル)イミダゾリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-115	-CH ₂ -3-(1-メチル)ヒリゾリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-116	-CH ₂ -4-ヒリゾル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-117	-CH ₂ -2-ヒリゾル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-118	-CH ₂ -2-(1-メチル)イミダゾリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-119	-CH ₂ -3-ヒリゾル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-120	-CH ₂ -2-フランル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-121	3, 4-ジクロロヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-122	-CH ₂ -5-(2-クロロ)-ヒリゾル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-123	2, 6-ジフルオロヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-124	2-フルオロ-6-メキシヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-125	2, 6-ジクロロヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-126	2-クロロ-6-トリフルオロメチルヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-127	2-クロロ-6-フルオロヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-128	-CH ₂ -2-(4, 6-ジメトキシ)-ヒリゾル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-129	2, 6-ジメチルヘンジル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-130	ヘンジル	1	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-131	-CH ₂ -1-(3-ニトロ-5-メチル)-ヒリゾリル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-132	-CH ₂ -CO-NH-シクロブチロヒリゾル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-133	-CH ₂ -CONH--C(CH ₃) ₂ -CO ₂ CH ₃	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-134	2-(1-メチル)-ヘンジル-イミダゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対

10

20

30

40

I-A-135	2-(5-メチル)-オキサゾ アゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-136	2-[3-メチル-6-(トリフ ルオロメチル)-イミダゾ [4.5]-ピリジニル- 10	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-137	3-[4-エチル-5-(トリフ ルオロメチル)]-- 1, 2, 4-トリアゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-138	3-[4-メチル-5-(トリフ ルオロメチル)]-- 1, 2, 4-トリアゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-139	3-[4-メチル-5-(ジフ ルオロメチル)]-- 1, 2, 4-トリアゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-140	2-(5-フェニル)- 1. 3. 4-チアジアゾリル - 20	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-141	2-(1-メチル-5-フェニ ル)イミダゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-142	2-(4, 5-ジメチル)-オ キサゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-143	2-(1-メチル-5-メトキシ カルボニル)-イミダゾリ ル	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-144	2-(1-メチル)-イミダ ゾリル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-145	1, 2-エタゾイル-	0	H	CH ₃	CH ₃	H	電子対
I-A-146	2-ピリミジル-	0	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	電子対
							30

【0333】

表2

表1に記載されている化合物に関する分析データ

実施例1-A-17以降は、そのNMRデータは、NMRピークリスト法を用いて編集した。

【0334】

選択された実施例の¹H NMRデータは、¹H NMRピークリストの形態で示されている。各シグナルピークに対して、最初に 値(ppm)が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する 値 - シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

【0335】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

1(強度1); 2(強度2); . . . ; i(強度i); . . . ; n(強度n)。

【0336】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種

類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0337】

1H NMRスペクトルの化学シフトの較正は、テトラメチルシランを用いて実施するか、及び／又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを用いて実施する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0338】

1H NMRピークのリストは、従来の1H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

10

【0339】

さらに、それらは、従来の1H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の対象の一部分を形成する）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0340】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、1H NMRピークの本発明者によるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、DMSO-D₆中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

20

【0341】

目標化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、90%を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【0342】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副産物の指紋（by-product finger prints）」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0343】

目標化合物のピークを既知方法（Mestrelle、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、1H NMRの慣習的な解釈における当該ピークのピッキングに類似しているであろう。

30

【0344】

1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【表2】

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-4	1.55	1.97	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400MHz); δ = 2.31 (s, 6H), 3.90 (s, 3H), 6.92 (s, 1H), 7.33-7.37 (m, 1H), 7.85 (s, 1H) 8.12-8.15 (m, 1H), 8.33-8.34 (d, 1H), 8.77 (br, 1H), 8.826-8.831 (d, 1H) ppm.
I-A-5	1.67	1.99	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400MHz); δ = 0.87 (t, 3H), 1.34-1.42 (m, 2H), 1.53-1.61(m, 2H), 3.02-3.06 (m, 2H), 3.38 (s 3H), 3.70 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.35-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H) 8.407-8.413 (d, 1H), 8.45-8.47 (m, 1H) ppm.
I-A-6	2.03	2.33	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400MHz); δ = 0.86 (t, 3H), 1.26-1.36 (m, 4H), 1.57-1.61(m, 2H), 3.02-3.06 (m, 2H), 3.38 (s 3H), 3.71 (s, 3H), 6.25 (s, 1H), 7.35-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H) 8.41-8.42 (d, 1H), 8.45-8.47 (m, 1H) ppm.
I-A-7	1.68	1.91	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400MHz); δ = 3.37 (s 3H), 3.53 (s, 3H), 4.18 (s, 2H), 6.28 (s, 1H), 7.16-7.18 (m, 2H), 7.25-7.30 (m, 3H), 7.37-7.39 (m, 1H), 7.66-7.68 (m, 1H) 8.380-8.384 (m, 1H), 8.47-8.48 (m, 1H) ppm.
I-A-8	0.45	0.67	¹ H-NMR (CD ₃ CN 400MHz); δ = 3.25 (s 3H), 3.42 (s, 3H), 4.05 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.34-7.39 (m, 1H), 7.68-7.71 (m, 1H), 8.435-8.441 (d, 1H), 8.47-8.49 (m, 1H) ppm.
I-A-9	2.0	2.12	¹ H-NMR (d6-DMSO,400MHz); δ = 2.41 (s, 3H),

10

20

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			3.39 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.48 (s, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.92-6.93 (m, 1H), 7.12-7.14 (m, 1H), 7.25 (t, 1H), 7.43-7.46 (m, 1H), 7.84-7.87 (m, 1H), 8.48-8.53 (m, 2H) ppm.
I-A-10	1,41	1,54	¹ H-NMR (CD ₃ CN, 400MHz); δ = 3.39 (s 3H), 3,76 (s, 3H), 3.80-3.89 (q, 2H), 6.29 (s, 1H), 7.34-7.38 (m, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H), 8.406-8.411 (d, 1H), 8.46-8.47 (m, 1H) ppm.
I-A-11	1,55	1,75	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 3.39 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 6.48 (s, 1H), 7.00-7.16 (m, 2H), 7.26-7.28 (m, 1H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 1H), 7.83-7.86 (m, 1H), 8.48-8.52 (m, 2 H) ppm
I-A-12	1,89	2.03	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 2,27 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.05-7.07 (m, 4H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.81-7.85 (m, 1H), 8.47-8.50 (m, 2 H) ppm
I-A-13	1,25	1,31	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 3.46 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 7.34-7.43 (m, 2H), 7.75-7.77 (m, 1H), 8.44-8.47 (m, 2H), 8.66-8.68 (m, 2 H) ppm
I-A-14	1,61	1,87	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 1.10-1.14 (t, 3H), 2.47-2.50 (m, 2H), 2.71-2.73 (m, 2H), 3.22-3.26 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.82-7.85 (m, 1H), 8.46-8.50 (m, 2H) ppm
I-A-15	1,24	1,34	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 3.45 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 7.35-7.43 (m, 2H), 7.76-7.78 (m, 1H), 8.44-8.47 (m, 2H), 8.67-8.68 (m, 2H) ppm
I-A-16	1,68	1,78	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO, 400MHz); δ = 3.42 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 6.26 (d, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.47-7.51 (m, 2H), 7.61-7.65 (m, 1H), 7.87-7.90 (m, 1H), 8.30-8.32 (m, 1H), 8.51-8.55 (m, 2 H) ppm
I-A-17	1,89	2,26	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,491(2,5);8,485(2,6);8,477(1,9);8,474(1,9);8,465(1,8);8,462(1,8);7,844(0,9);7,841(1,2);7,838(1,2);7,834(1,0);7,824(1,1);7,820(1,3);7,818(1,3);7,814(1,1);7,450(1,3);7,438(1,3);7,430(1,3);7,418(1,2);6,283(4,0);5,754(1,4);3,689(16,0);3,431(0,5);3,406(0,9);3,397(0,7);3,364(15,4);3,321(4,2);2,506(23,8);2,502(30,5);2,498(23,9);1,885(1,2);1,858(1,6);1,669(1,3);1,662(1,2);1,650(1,3);1,642(1,2);1,539(0,6);1,527(0,6);1,512(0,7);1,394(0,4);1,388(0,4);1,362(1,2);1,335(1,9);1,301(1,7);1,270(1,3);1,241(1,2);1,211(0,6);1,186(0,5);0,000(27,0)
I-A-18	0,76	1,14	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,502(1,8);8,495(1,8);8,484(1,2);8,481(1,3);8,473(1,2);8,469(1,3);7,857(0,6);7,854(0,8);7,851(0,8);7,848(0,7);7,837(0,7);7,833(0,8);7,831(0,9);7,827(0,7);7,460(1,0);7,448(1,0);7,440(0,9);7,428(0,9);6,230(3,2);3,677(12,9);3,504(1,7);3,488(4,1);3,473(2,2);3,361(12,2);3,325(12,0);3,240(2,1);3,224(3,9);3,209(16,0);3,166(0,8);2,525(0,3);2,508(16,1);2,503(21,6);2,499(16,3);0,008(0,4);0,000(1,1);-0,008(0,5)

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
I-A-19	1,23	1,53	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,491(2,1);8,485(2,2);8,478(1,6);8,474(1,7);8,466(1,6);8,462(1,6);7,847(0,8);7,843(1,0);7,841(0,9);7,837(0,8);7,827(1,0);7,823(1,1);7,820(1,1);7,817(0,9);7,452(1,1);7,440(1,2);7,431(1,1);7,419(1,0);6,295(3,7);3,702(15,9);3,597(0,4);3,580(1,1);3,563(1,5);3,547(1,1);3,530(0,5);3,368(14,9);3,318(18,5);2,510(12,4);2,506(23,6);2,502(30,4);2,497(22,5);1,244(16,0);1,227(15,8);0,000(5,4)
I-A-20	1,04	1,35	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,502(1,9);8,496(1,9);8,483(1,4);8,479(1,4);8,471(1,4);8,467(1,4);7,854(0,7);7,850(0,8);7,848(0,8);7,844(0,7);7,834(0,8);7,830(0,9);7,827(0,9);7,824(0,8);7,458(1,0);7,446(1,0);7,437(1,0);7,426(0,9);6,234(3,4);3,679(14,0);3,361(14,6);3,344(4,7);3,325(7,3);3,218(0,4);3,187(16,0);3,080(1,9);3,063(3,1);3,044(2,0);2,512(7,4);2,507(14,8);2,503(19,6);2,499(14,4);2,494(7,3);1,817(0,5);1,801(1,5);1,783(2,0);1,766(1,4);1,750(0,5);0,000(8,5);-0,008(0,4)
I-A-21	1,31	1,60	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,500(2,2);8,494(2,3);8,483(1,6);8,480(1,7);8,471(1,6);8,468(1,6);7,852(0,8);7,848(1,0);7,846(1,0);7,842(0,8);7,831(0,9);7,828(1,1);7,825(1,1);7,822(0,9);7,457(1,3);7,445(1,3);7,437(1,2);7,425(1,1);6,230(4,0);3,677(16,0);3,361(15,2);3,320(9,3);3,034(2,5);3,016(4,2);2,999(2,6);2,687(0,4);2,674(0,5);2,507(13,7);2,502(18,1);2,498(13,6);1,596(1,4);1,578(2,7);1,560(2,7);1,542(1,5);1,524(0,3);0,922(4,2);0,904(8,3);0,885(3,8);0,000(7,6);-0,008(0,3)
I-A-22	1,04	1,41	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,499(2,2);8,493(2,2);8,484(1,6);8,480(1,6);8,472(1,6);8,468(1,6);7,853(0,8);7,849(1,0);7,846(1,0);7,843(0,8);7,832(0,9);7,829(1,1);7,826(1,1);7,822(0,9);7,458(1,2);7,446(1,2);7,438(1,1);7,426(1,0);6,232(4,0);3,680(16,0);3,537(2,1);3,521(4,8);3,506(2,5);3,417(1,4);3,399(4,4);3,382(4,5);3,361(15,2);3,311(8,2);3,229(2,4);3,213(4,6);3,197(2,0);2,511(7,8);2,506(15,6);2,502(20,5);2,498(14,9);2,493(7,4);1,080(4,5);1,063(8,9);1,045(4,3);0,008(0,4);0,000(10,1);-0,008(0,4)
I-A-23	0,67;0,71		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,464(1,6);8,452(1,6);8,411(2,2);8,404(2,3);7,680(0,8);7,676(1,1);7,672(0,8);7,660(0,9);7,655(1,2);7,651(0,9);7,376(1,3);7,364(1,3);7,355(1,2);7,343(1,2);6,185(4,3);3,961(10,2);3,726(16,0);3,371(16,0);2,166(20,2);1,962(0,4);1,956(0,5);1,950(2,5);1,944(4,5);1,938(6,1);1,932(4,2);1,926(2,1);0,007(0,4);0,000(10,5);-0,001(10,5);-0,008(0,5)
I-A-24	1,20	1,34	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,468(1,4);8,464(1,5);8,456(1,5);8,452(1,5);8,412(2,0);8,406(2,1);7,687(0,8);7,683(1,0);7,680(0,9);7,677(0,8);7,666(1,0);7,662(1,1);7,660(1,1);7,656(0,9);7,377(1,2);7,365(1,2);7,357(1,1);7,345(1,0);6,224(3,9);4,102(1,4);4,084(4,0);4,067(4,1);4,049(1,4);3,820(10,7);3,738(16,0);3,375(16,0);2,502(1,1);2,182(0,3);1,957(0,3);1,951(1,8);1,9

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			45(3,2);1,939(4,3);1,932(3,0);1,926(1,6);1,174(4,5);1, 156(8,5);1,138(4,3);0,000(5,4)
I-A-25	0,88	1,09	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,471(1,3);8,468 (1,3);8,459(1,3);8,456(1,3);8,411(1,8);8,405(1,8);7,68 8(0,8);7,684(0,9);7,682(1,0);7,678(0,8);7,668(0,9);7,6 64(1,0);7,661(1,0);7,658(0,8);7,380(1,0);7,368(1,0);7, 360(0,9);7,348(0,8);6,220(3,4);3,836(9,5);3,734(16,0) ;3,692(0,3);3,665(0,5);3,660(0,5);3,623(14,8);3,432(0 ,5);3,389(1,0);3,377(15,4);2,500(2,2);2,135(0,4);2,12 6(0,4);2,118(0,5);2,112(0,5);2,105(0,5);2,099(0,4);1,9 62(0,8);1,950(10,0);1,944(18,1);1,938(24,1);1,932(17 ,0);1,926(8,9);0,008(1,3);0,000(31,4)
I-A-26	1,23	1,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,500(1,9);8,4 94(1,9);8,483(1,4);8,480(1,4);8,471(1,4);8,468(1,4);7, 852(0,7);7,848(0,9);7,845(0,8);7,842(0,7);7,831(0,8); 7,828(0,9);7,825(0,9);7,821(0,8);7,456(1,0);7,445(1,0));7,436(1,0);7,424(0,9);6,251(3,6);3,677(14,4);3,363(13,4);3,311(7,4);3,284(1,9);3,270(1,5);3,266(2,2);3,2 60(1,5);3,246(2,1);3,178(0,4);3,164(0,4);2,711(2,2);2, 697(1,5);2,691(2,5);2,689(2,4);2,673(2,1);2,511(4,3); 2,506(8,7);2,502(11,5);2,497(8,4);2,493(4,2);2,041(1 ,0);0,000(2,2)
I-A-27	1,08;1,11	1,40	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,463(1,4);8,460 (1,5);8,451(1,5);8,448(1,5);8,400(2,0);8,394(2,1);7,67 3(0,8);7,669(1,0);7,666(1,0);7,663(0,8);7,652(0,9);7,6 48(1,1);7,646(1,1);7,642(0,9);7,374(1,2);7,362(1,2);7, 353(1,1);7,342(1,0);6,264(3,9);5,911(0,6);5,904(0,3); 5,893(0,3);5,886(0,9);5,869(1,0);5,861(0,4);5,851(0,4) ;5,844(0,7);5,826(0,3);5,096(1,3);5,093(1,3);5,054(1, 2);5,051(1,2);5,026(1,4);5,024(1,4);5,001(1,3);4,999(1,4);3,725(16,0);3,658(3,4);3,641(3,3);3,379(16,0);2, 166(6,6);1,957(0,7);1,951(3,2);1,945(5,8);1,939(7,6); 1,933(5,3);1,926(2,8);0,000(7,0)
I-A-28	1,53	1,78	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,463(0,5);8,460 (0,6);8,451(0,5);8,448(0,6);8,408(0,7);8,402(0,7);8,03 4(0,4);7,677(0,4);7,674(0,4);7,670(0,4);7,656(0,4);7,6 53(0,5);7,650(0,4);7,372(0,5);7,361(0,5);7,352(0,4);7, 340(0,4);6,188(1,3);4,259(3,6);3,741(5,4);3,705(0,8); 3,390(0,9);3,371(5,4);2,502(2,4);2,138(0,3);1,956(0,7) ;1,950(3,2);1,944(5,9);1,938(7,9);1,932(5,8);1,926(3, 1);1,118(16,0);1,093(1,3);0,000(7,5)
I-A-29	0,28	1,05	¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,506(2,0);8,5 02(2,0);8,482(1,4);8,480(1,4);8,475(1,5);8,472(1,4);8, 139(1,2);7,843(0,9);7,841(1,0);7,839(1,0);7,837(0,8); 7,830(1,0);7,827(1,1);7,826(1,1);7,823(0,9);7,452(1,1));7,444(1,1);7,438(1,0);7,430(1,0);6,202(2,4);5,754(0, 6);3,884(8,4);3,697(16,0);3,358(15,5);3,340(0,4);3,33 3(0,4);3,327(0,4);2,541(11,6);2,507(5,9);2,504(11,9); 2,501(16,0);2,498(11,6);2,495(5,5)
I-A-30	0,87	1,22	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,469(1,5);8,466 (1,5);8,457(1,5);8,454(1,5);8,412(2,0);8,406(2,0);7,68 9(0,8);7,685(1,0);7,682(1,0);7,679(0,8);7,668(1,0);7,6 65(1,1);7,662(1,1);7,658(0,9);7,380(1,2);7,379(1,1);7,

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ; δ (ppm)	
			368(1,2);7,367(1,1);7,360(1,1);7,359(1,0);7,348(1,0);7,347(1,0);6,302(3,7);3,781(6,1);3,775(6,1);3,757(16,0);3,386(16,0);2,466(1,4);2,459(2,6);2,453(1,3);2,170(1,7);1,957(0,4);1,952(1,9);1,946(3,4);1,939(4,5);1,933(3,1);1,927(1,6);0,000(2,7)	
I-A-31	0,97	1,28	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ = 8,466(1,3);8,463(1,4);8,455(1,3);8,451(1,4);8,404(1,8);8,398(1,9);7,682(0,7);7,678(0,9);7,676(0,9);7,672(0,8);7,661(0,9);7,658(1,0);7,655(1,0);7,651(0,8);7,378(1,1);7,366(1,1);7,357(1,0);7,345(0,9);6,202(3,5);4,107(10,4);3,737(15,9);3,384(0,4);3,373(16,0);2,354(0,4);2,129(45,1);2,107(1,3);2,096(1,5);2,085(0,6);2,078(0,7);2,066(0,4);1,963(3,4);1,957(8,8);1,951(47,5);1,945(87,0);1,939(117,5);1,933(82,7);1,927(43,6);1,774(0,5);1,767(0,7);1,761(0,5);0,901(1,0);0,893(3,1);0,875(5,6);0,864(3,5);0,856(0,9);0,008(2,1);0,000(65,6)	10
I-A-32	0,11	0,50	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ = 8,475(1,5);8,472(1,6);8,463(1,6);8,460(1,6);8,418(2,1);8,412(2,2);7,695(1,0);7,690(0,8);7,673(1,1);7,388(1,2);7,376(1,2);7,368(1,1);7,356(1,1);6,258(3,1);3,734(10,9);3,654(9,4);3,383(16,0);3,280(0,7);3,269(0,7);2,149(58,1);2,119(0,5);2,113(0,6);2,106(0,7);2,101(0,5);1,963(2,7);1,957(7,2);1,951(35,9);1,945(64,9);1,939(86,7);1,933(60,5);1,927(31,8);1,774(0,4);1,768(0,5);1,762(0,4);0,007(1,3);0,000(34,8)	20
I-A-33	0,33	0,62	¹ H-NMR(600,1 MHz, CD3CN): δ = 8,472(1,1);8,470(1,1);8,464(1,2);8,462(1,1);8,4222(1,4);8,4216(1,4);8,418(1,5);7,691(0,7);7,689(0,8);7,687(0,8);7,685(0,7);7,678(0,7);7,675(0,8);7,673(0,8);7,671(0,7);7,382(0,9);7,381(0,9);7,374(0,9);7,373(0,9);7,368(0,9);7,367(0,8);7,360(0,8);7,359(0,8);6,245(2,1);3,719(16,0);3,652(7,8);3,380(15,5);2,613(6,4);2,605(6,4);2,195(14,1);1,949(1,7);1,945(3,1);1,941(4,5);1,937(3,0);1,932(1,5)	
I-A-34	0,59	0,81	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ = 8,464(1,6);8,453(1,6);8,414(2,2);8,408(2,3);7,684(1,1);7,680(0,9);7,664(1,2);7,660(1,0);7,381(1,3);7,369(1,3);7,360(1,2);7,348(1,1);6,228(4,1);4,009(9,2);3,743(16,0);3,378(16,0);3,014(0,4);2,950(14,7);2,867(0,4);2,848(13,5);2,170(28,7);1,963(1,0);1,952(12,6);1,946(23,5);1,940(32,2);1,934(23,6);1,928(12,9);0,000(7,7)	30
I-A-35	1,61	1,96	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ = 8,469(1,3);8,466(1,4);8,457(1,4);8,454(1,4);8,410(1,9);8,404(1,9);7,693(0,8);7,689(0,9);7,687(0,9);7,683(0,7);7,672(0,9);7,669(1,1);7,666(1,1);7,663(0,8);7,382(1,1);7,370(1,1);7,362(1,1);7,350(1,0);6,259(3,6);5,277(0,5);5,273(0,4);5,260(0,8);5,256(0,9);5,253(0,8);5,240(0,4);5,237(0,5);3,718(14,7);3,694(0,5);3,625(2,9);3,605(2,8);3,379(16,0);2,180(14,8);1,964(0,4);1,958(1,2);1,952(5,8);1,946(10,5);1,940(13,9);1,934(9,7);1,928(5,0);1,670(8,1);1,486(7,9);0,000(4,5)	40
I-A-36	0,95	1,31	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ = 8,466(1,4);8,463(1,4);8,454(1,5);8,451(1,4);8,415(2,0);8,409(2,0);7,688(0,8);7,685(1,0);7,682(0,9);7,678(0,8);7,668(1,0);7,6	

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			64(1,1);7,662(1,1);7,658(0,9);7,379(1,1);7,367(1,1);7,359(1,0);7,347(1,0);6,254(3,7);3,748(0,8);3,703(15,9);3,380(16,0);3,069(1,3);3,051(3,9);3,033(4,0);3,014(1,4);2,759(1,5);2,193(4,9);2,119(0,4);2,113(0,4);2,107(0,4);1,963(1,1);1,952(9,8);1,946(17,1);1,940(22,3);1,933(15,6);1,927(8,2);1,322(0,5);1,269(0,4);1,259(4,2);1,241(8,1);1,223(4,0);0,000(3,5)
I-A-37	1,29	1,45	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,501(2,4);8,494(2,5);8,483(1,7);8,480(2,0);8,472(1,8);8,468(2,0);7,864(1,0);7,861(1,3);7,858(1,4);7,854(1,2);7,844(1,1);7,840(1,4);7,838(1,5);7,834(1,2);7,450(1,5);7,438(1,5);7,429(1,4);7,418(1,3);6,592(1,4);3,867(16,0);3,402(17,1);3,372(1,4);3,321(15,5);2,506(21,8);2,502(29,3);2,498(23,9);1,621(1,7);1,236(0,8);0,000(6,0)
I-A-38	0,91	1,17	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,504(2,9);8,498(2,8);8,486(2,2);8,474(2,2);7,926(0,4);7,919(0,4);7,856(1,4);7,835(1,5);7,582(1,3);7,456(1,6);7,444(4,1);7,437(1,6);7,424(1,3);7,305(1,4);6,468(2,4);3,820(16,0);3,600(0,4);3,390(16,2);3,360(0,6);3,319(42,4);2,687(1,3);2,674(1,6);2,505(57,0);2,501(63,0);2,328(0,4);0,003(2,9);0,000(5,5)
I-A-39	1,13	1,37;1,45	¹ H-NMR(600,1 MHz, CD3CN): δ= 8,465(0,9);8,463(0,9);8,457(0,9);8,455(0,9);8,412(0,4);8,407(1,2);8,403(1,0);7,679(0,6);7,676(0,6);7,675(0,6);7,672(0,5);7,665(0,6);7,663(0,7);7,661(0,7);7,659(0,5);7,373(0,7);7,372(0,8);7,365(0,8);7,364(0,8);7,359(0,7);7,358(0,7);7,3513(0,7);7,3505(0,7);6,278(1,5);6,261(0,5);3,762(2,4);3,754(3,8);3,745(12,4);3,711(13,1);3,698(7,3);3,680(3,9);3,382(16,0);2,144(3,4);1,955(0,6);1,951(0,6);1,947(3,7);1,943(6,4);1,939(9,4);1,935(6,4);1,931(3,2);1,816(12,2);1,802(3,7);0,000(2,6)
I-A-40	0,68	0,88	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,479(1,5);8,476(1,6);8,467(1,6);8,464(1,6);8,431(2,0);8,426(2,1);7,695(0,8);7,692(1,1);7,689(1,1);7,686(1,0);7,675(1,0);7,671(1,2);7,669(1,2);7,665(1,0);7,379(1,2);7,367(1,3);7,358(1,2);7,346(1,0);6,495(1,2);4,062(0,5);4,047(16,0);3,423(16,0);3,391(1,4);3,372(4,0);3,354(4,1);3,335(1,4);2,755(0,8);2,176(7,0);1,952(2,6);1,946(4,5);1,940(6,0);1,934(4,5);1,928(2,5);1,227(4,2);1,209(8,1);1,190(4,0);0,000(0,4)
I-A-41	0,71	1,54	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,815(2,1);8,810(2,1);8,651(0,8);8,316(1,6);8,304(1,7);8,139(1,1);8,118(1,2);7,742(4,4);7,365(1,2);7,353(1,3);7,344(1,2);7,333(1,1);3,804(16,0);3,206(1,3);3,188(3,9);3,170(4,0);3,151(1,3);3,033(0,4);2,154(170,7);2,113(2,4);2,107(2,2);2,101(1,6);1,951(60,2);1,945(107,1);1,939(142,1);1,933(100,9);1,927(53,4);1,779(0,4);1,774(0,7);1,768(0,9);1,761(0,6);1,755(0,4);1,357(4,1);1,339(8,0);1,320(3,9);0,146(3,0);0,000(555,3);-0,008(49,4);-0,150(3,0)
I-A-42	0,35	0,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,478(1,4);8,475(1,4);8,467(1,5);8,463(1,5);8,430(1,8);8,424(1,9);7,685(0,8);7,682(0,9);7,676(0,8);7,665(0,9);7,662(1,1);7,6

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			59(1,1);7,656(0,8);7,378(1,1);7,366(1,1);7,358(1,1);7,346(1,0);6,770(0,3);6,524(0,8);4,179(9,3);4,019(15,9);3,425(16,0);2,661(7,6);2,649(7,6);2,147(33,0);2,106(0,3);1,963(1,3);1,951(17,8);1,945(32,6);1,939(44,6);1,933(32,1);1,927(16,9);0,146(1,1);0,000(210,5);-0,008(16,6);-0,150(1,1)
I-A-43	0,27	0,22	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,480(1,8);8,470(1,8);8,427(2,3);8,421(2,4);7,703(1,2);7,682(1,3);7,389(1,3);7,377(1,4);7,369(1,3);7,357(1,1);6,727(0,5);6,439(1,9);5,446(0,4);4,167(1,9);4,132(2,9);4,010(3,4);3,998(16,0);3,975(2,0);3,816(0,5);3,413(15,8);3,389(0,6);2,652(7,8);2,640(7,7);2,178(4,7);1,951(4,6);1,945(8,2);1,939(11,1);1,933(8,2);1,927(4,4);0,000(52,2);-0,001(52,2) 10
I-A-44	0,80	1,30	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,488(1,1);8,485(1,2);8,476(1,2);8,473(1,1);8,386(1,6);8,380(1,6);7,679(0,7);7,675(0,9);7,672(0,9);7,669(0,7);7,658(0,9);7,655(1,0);7,652(1,0);7,648(0,8);7,395(1,0);7,383(1,0);7,375(0,9);7,363(0,9);7,345(0,5);6,170(3,7);4,608(0,5);4,521(0,5);3,898(1,1);3,880(3,5);3,862(4,5);3,844(1,2);3,801(1,1);3,687(15,5);2,499(16,0);2,209(18,0);1,958(0,6);1,953(3,2);1,946(5,8);1,940(7,8);1,934(5,4);1,928(2,8);1,162(3,7);1,144(7,4);1,126(3,6);0,008(0,6);0,000(13,5);-0,008(0,6) 20
I-A-45	0,54	1,04	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,814(2,0);8,809(1,8);8,600(1,4);8,586(1,4);8,392(1,0);8,389(1,0);8,370(1,1);8,368(1,0);7,949(1,0);7,935(1,1);7,928(1,0);7,914(0,9);7,212(3,0);3,814(15,0);3,501(15,0);2,921(16,0);2,514(1,7);2,042(0,5);1,965(0,6);1,953(7,8);1,947(14,0);1,941(18,5);1,935(12,7);1,928(6,5);0,000(49,4);-0,008(2,5)
I-A-46	2,09	2,17	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,502(1,4);8,498(1,5);8,490(1,4);8,486(1,4);8,445(1,9);8,439(1,9);7,715(0,8);7,711(0,9);7,708(0,9);7,704(0,8);7,694(0,9);7,690(1,0);7,688(1,0);7,684(0,8);7,406(1,1);7,395(1,1);7,386(1,0);7,374(0,9);6,306(3,2);5,477(1,2);4,012(1,5);3,970(2,6);3,969(2,6);3,927(1,6);3,809(1,1);3,797(16,0);3,426(1,2);3,415(15,9);2,170(5,5);1,994(0,4);1,988(0,8);1,982(4,0);1,976(7,1);1,970(9,7);1,964(6,7);1,958(3,4) 30
I-A-47	1,65	1,84	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,506(1,3);8,502(1,4);8,494(1,4);8,490(1,4);8,453(1,9);8,447(1,9);7,724(0,8);7,720(0,8);7,718(0,8);7,714(0,7);7,704(0,9);7,700(1,0);7,697(0,9);7,694(0,8);7,414(1,0);7,402(1,1);7,394(1,0);7,382(0,9);6,293(3,6);5,477(2,0);3,730(16,0);3,413(15,8);3,272(2,0);3,253(2,2);3,248(1,0);3,233(2,3);2,646(0,3);2,638(1,0);2,626(0,5);2,623(0,5);2,619(0,9);2,611(1,1);2,599(1,0);2,591(0,9);2,584(0,5);2,572(0,9);2,564(0,3);2,173(3,3);1,994(0,4);1,988(0,8);1,982(4,1);1,976(7,5);1,970(10,3);1,964(7,1);1,958(3,6) 40
I-A-48	1,11	1,40	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,497(1,4);8,495(1,6);8,486(1,5);8,483(1,6);8,446(2,2);8,440(2,2);7,718(0,8);7,714(1,0);7,708(0,8);7,697(0,9);7,693(1,1);7,4

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			09(1,2);7,397(1,2);7,388(1,1);7,376(1,1);6,282(4,1);5,478(2,5);4,594(1,3);4,579(2,5);4,565(1,3);4,475(1,3);4,461(2,5);4,446(1,3);3,741(16,0);3,410(16,0);3,181(2,4);3,163(4,4);3,145(2,6);2,204(17,0);2,078(0,3);2,063(0,8);2,045(1,2);2,028(0,8);2,013(0,6);1,995(1,1);1,982(5,2);1,976(9,0);1,970(11,4);1,964(8,6);1,958(4,2);1,948(0,4)
I-A-49	1,55	1,71	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ 8,501(1,9);8,498(1,7);8,489(1,6);8,486(1,3);8,444(2,3);8,438(2,0);7,714(1,1);7,710(1,2);7,708(1,1);7,704(1,0);7,694(1,2);7,690(1,2);7,684(0,8);7,407(1,4);7,396(1,4);7,387(1,2);7,375(1,0);6,305(3,4);6,278(0,4);6,268(0,6);6,146(0,8);6,136(1,3);6,125(0,6);6,014(0,4);6,004(0,6);5,478(3,9);3,826(1,6);3,796(16,0);3,784(3,0);3,742(1,7);3,414(15,2);2,198(8,5);2,194(8,2);1,982(6,0);1,976(8,6);1,970(10,0);1,964(6,5);1,958(3,1)
I-A-50	1,94	2,10	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ 8,498(1,4);8,495(1,4);8,486(1,4);8,483(1,4);8,446(2,0);8,440(2,1);7,720(0,7);7,716(0,9);7,714(0,9);7,710(0,8);7,699(0,9);7,695(1,1);7,693(1,0);7,689(0,9);7,409(1,2);7,397(1,1);7,388(1,0);7,376(1,0);6,276(3,9);5,478(0,8);3,730(16,0);3,410(15,9);3,344(1,2);3,318(5,8);3,300(2,6);3,292(4,3);3,280(2,6);3,266(1,3);2,936(1,9);2,917(2,2);2,899(1,6);2,195(17,4);1,995(0,4);1,988(0,7);1,983(4,5);1,976(8,3);1,970(11,5);1,964(8,0);1,958(4,1)
I-A-51	1,47	1,73	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ 8,493(1,3);8,489(1,3);8,481(1,4);8,477(1,4);8,437(1,8);8,431(1,9);7,706(0,8);7,702(0,9);7,700(0,8);7,696(0,7);7,686(0,9);7,682(1,0);7,679(0,9);7,676(0,8);7,403(1,1);7,391(1,1);7,382(1,0);7,370(0,9);6,328(3,7);5,478(3,9);3,762(16,0);3,505(0,5);3,487(0,5);3,479(1,0);3,470(0,5);3,452(0,5);3,429(0,4);3,414(15,8);2,686(2,4);2,677(4,9);2,663(2,7);2,655(1,9);2,628(0,3);2,261(0,4);2,251(0,8);2,241(0,9);2,229(0,6);2,218(1,2);2,208(1,2);2,181(4,9);1,994(0,4);1,988(0,7);1,983(4,1);1,976(7,6);1,970(10,5);1,964(7,2);1,958(3,7);1,806(0,5);1,793(0,5);1,781(0,6);1,772(0,9);1,760(0,7);1,747(0,9);1,738(0,6);1,724(0,4);1,712(0,4)
I-A-52	0,90	1,25	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ 8,488(1,7);8,477(1,7);8,436(2,4);8,430(2,5);7,708(0,8);7,706(1,0);7,704(1,1);7,700(0,9);7,688(0,9);7,686(1,1);7,684(1,3);7,680(1,0);7,401(1,4);7,390(1,4);7,381(1,3);7,369(1,2);6,329(4,3);5,478(1,8);5,477(1,6);3,894(1,0);3,885(1,7);3,876(1,1);3,865(1,2);3,856(1,9);3,846(1,1);3,769(16,0);3,768(15,2);3,617(0,6);3,607(0,3);3,600(0,6);3,590(1,3);3,580(0,6);3,573(0,4);3,562(0,6);3,434(1,4);3,429(1,5);3,416(16,0);3,414(15,2);3,406(2,8);3,400(2,4);3,377(1,2);3,372(1,2);2,199(18,1);1,993(0,4);1,983(4,0);1,982(4,0);1,977(7,4);1,976(7,1);1,971(10,1);1,969(9,5);1,965(7,2);1,963(6,6);1,958(3,8);1,903(1,1);1,867(1,5);1,673(0,6);1,662(0,6);1,645(1,2);1,635(1,3);1,613(1,1);1,602(1,0);1,585(0,5);1,575(0,5)
I-A-53	2,68	2,76	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ 8,505(1,3);8,502(

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			1,3);8,494(1,3);8,490(1,3);8,453(1,7);8,447(1,8);7,72 3(0,7);7,719(0,8);7,716(0,8);7,712(0,7);7,702(0,8);7,6 98(0,9);7,696(0,9);7,692(0,8);7,412(1,0);7,411(1,0);7, 400(1,0);7,399(0,9);7,392(0,9);7,391(0,9);7,380(0,8); 6,282(3,5);5,478(1,0);3,731(16,0);3,412(15,6);3,304(1,2); 3,284(1,2);3,263(1,4);2,694(0,5);2,672(0,5);2,653(0,5); 2,643(0,5);2,621(0,5);2,602(0,5);2,181(7,5);1,988(0,7); 1,983(3,7);1,976(6,8);1,970(9,4);1,964(6,5);1,958(3,3)
I-A-54	0,63	0,98	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8,469(1,4);8,466(1,4); 8,457(1,4);8,454(1,4);8,411(1,9);8,405(1,9);7,687(0,8); 7,683(0,9);7,680(0,9);7,676(0,8);7,666(0,9);7,662(1,0); 7,660(1,0);7,656(0,8);7,380(1,1);7,378(1,0);7,368(1,1); 7,366(1,0);7,360(1,0);7,348(1,0);7,346(0,9);6,223(3,6); 5,448(1,2);4,940(2,1);4,923(4,1);4,905(2,3);4,602(0,7); 4,584(1,3);4,569(1,0);4,564(0,4);4,551(0,5);4,507(2,8); 4,491(4,0);4,475(1,8);3,716(16,0);3,377(16,0);2,175(18,4); 1,964(0,4);1,958(0,9);1,952(4,4);1,946(8,0);1,940(10,8); 1,934(7,4);1,927(3,7);0,008(1,0);0,000(21,4);-0,008(0,7)
I-A-55	1,01	1,27	¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,632(0,5);8,629(0,5); 8,546(0,4);8,539(0,4);8,486(2,2);8,481(2,2);8,478(1,7); 8,475(1,5);8,470(1,6);8,467(1,4);7,842(0,8);7,840(1,0); 7,838(0,9);7,836(0,8);7,829(0,9);7,826(1,0);7,825(1,0); 7,822(0,8);7,448(1,1);7,440(1,1);7,434(1,1);7,426(1,0); 6,256(2,7);4,536(8,2);4,427(8,1);4,244(0,7);3,900(3,3); 3,790(1,2);3,778(1,8);3,771(3,8);3,765(1,2);3,675(16,0); 3,449(2,9);3,361(14,7);3,338(0,9);3,330(1,3);3,306(255,1); 3,280(0,3);3,173(0,7);3,164(0,7);2,660(1,3);2,655(0,7); 2,646(1,4);2,642(1,3);2,637(1,5);2,628(0,7);2,624(1,4); 2,615(1,0);2,612(1,3);2,609(0,9);2,521(2,4);2,518(3,0); 2,515(3,1);2,506(79,7);2,503(156,7);2,500(210,1);2,497(156,0); 2,494(76,4);2,387(0,9);2,384(1,3);2,381(0,9);2,169(1,5); 2,165(0,7);2,157(1,5);2,152(1,3);2,147(1,4);2,139(0,7); 2,134(1,3);2,033(0,4);2,010(0,4);0,000(1,3)
I-A-56	2,86	2,92	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,559(2,4);8,552(2,5); 8,499(1,7);8,496(1,8);8,487(1,8);8,484(1,7);7,974(5,6); 7,862(0,9);7,858(1,1);7,855(1,0);7,852(0,9);7,841(1,1); 7,837(1,2);7,835(1,2);7,831(1,0);7,452(1,4);7,440(1,4); 7,431(1,3);7,420(1,2);6,721(5,0);6,558(2,3);5,754(2,1); 3,800(16,0);3,758(0,5);3,409(15,5);3,318(23,4);2,671(0,4); 2,507(46,4);2,502(60,3);2,498(45,2);2,329(0,4);1,989(0,5); 0,008(2,5);0,000(62,0)
I-A-57	2,02	2,14	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,515(2,4);8,509(2,6); 8,495(1,7);8,493(1,8);8,484(1,7);8,481(1,8);8,135(1,5); 7,855(0,9);7,851(1,1);7,850(1,1);7,846(1,0);7,834(1,0); 7,831(1,3);7,829(1,3);7,825(1,0);7,466(1,4);7,454(1,4); 7,446(1,3);7,434(1,3);7,423(0,5);7,416(4,3);7,399(1,6); 7,394(4,9);7,115(0,6);7,108(4,8);7,087(4,1);6,475(2,9); 5,754(2,7);3,741(16,0);3,392(15,6);3,321(2,5);2,507(15,4); 2,503(20,1);2,499(15,7);2,086(8,1);0,008(1,2);0,000(26,8)

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
I-A-58	1,62	1,79	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,496(1,9);8,489(2,0);8,478(1,4);8,475(1,5);8,467(1,4);8,463(1,4);7,839(0,7);7,835(0,9);7,832(0,8);7,829(0,7);7,818(0,8);7,814(1,0);7,812(0,9);7,808(0,8);7,448(1,1);7,436(1,1);7,428(1,0);7,416(1,0);7,218(3,3);7,213(1,1);7,201(1,1);7,196(3,9);7,188(0,4);6,944(0,4);6,936(3,9);6,931(1,3);6,919(1,1);6,914(3,3);6,906(0,3);6,344(2,6);4,108(0,4);4,095(1,3);4,082(1,3);4,069(0,5);3,741(16,0);3,736(14,8);3,369(13,3);3,320(9,1);3,177(5,7);3,163(5,5);2,688(0,9);2,675(1,0);2,506(15,5);2,502(20,5);2,497(15,3);0,008(1,1);0,000(27,6);-0,009(1,1)	10
I-A-59	1,55	2,11	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,486(1,2);8,480(1,3);8,469(0,9);8,466(0,9);8,458(0,9);8,454(0,9);8,140(1,9);7,830(0,5);7,827(0,6);7,824(0,6);7,821(0,5);7,810(0,5);7,806(0,6);7,804(0,6);7,800(0,5);7,441(0,7);7,429(0,7);7,421(0,6);7,409(0,6);7,180(2,0);7,175(0,8);7,158(2,1);6,676(2,0);6,654(1,9);6,263(1,7);3,732(8,0);3,357(9,0);2,891(16,0);2,506(13,5);2,502(17,4);2,498(13,4);2,073(0,7);0,007(0,9);0,000(16,4)	
I-A-60	2,55	2,58	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,548(2,3);8,542(2,3);8,495(1,6);8,491(1,7);8,483(1,7);8,479(1,7);7,853(0,9);7,850(1,1);7,847(1,0);7,843(0,9);7,833(1,0);7,829(1,2);7,827(1,2);7,823(1,0);7,517(1,7);7,512(3,1);7,508(1,7);7,446(1,3);7,434(1,3);7,425(1,2);7,414(1,1);7,078(6,4);7,074(6,3);6,542(2,3);5,754(1,8);3,784(16,0);3,403(15,3);3,318(15,9);2,524(0,7);2,511(12,8);2,507(24,6);2,502(31,9);2,498(24,0);2,086(1,3);0,000(0,4)	20
I-A-61			¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,531(3,6);8,525(3,7);8,493(2,5);8,481(2,5);7,928(1,0);7,921(1,0);7,860(1,3);7,856(1,7);7,854(1,7);7,840(1,4);7,837(1,6);7,758(0,8);7,747(0,9);7,638(1,2);7,619(2,3);7,591(1,6);7,571(2,2);7,552(0,9);7,459(3,2);7,446(2,1);7,434(1,9);7,425(1,5);7,413(1,4);7,315(1,7);7,295(1,5);7,090(0,5);7,079(0,5);7,070(0,7);7,058(0,6);6,862(0,6);6,859(0,6);6,855(0,6);6,838(0,5);6,515(3,0);6,209(1,0);5,843(0,4);5,755(1,1);3,774(16,0);3,750(5,7);3,398(15,7);3,377(5,8);3,353(0,5);3,321(30,3);2,688(3,8);2,675(4,0);2,502(54,8);2,328(0,4);0,032(0,3);0,000(38,1)	30
I-A-62	1,66	1,87	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,509(2,4);8,503(2,6);8,489(1,8);8,486(1,8);8,477(1,9);8,474(1,8);7,929(0,4);7,923(0,4);7,849(0,9);7,845(1,2);7,843(1,2);7,839(1,0);7,828(1,1);7,825(1,3);7,822(1,3);7,819(1,0);7,762(0,3);7,751(0,3);7,458(1,4);7,446(1,4);7,438(1,3);7,426(1,3);7,222(10,5);7,207(5,0);7,202(5,1);7,186(0,3);7,179(0,4);6,427(3,0);5,755(3,7);3,747(16,0);3,384(15,4);3,323(5,6);2,689(1,3);2,677(1,4);2,507(16,7);2,503(20,8);0,008(0,9);0,000(18,4)	
I-A-63	2,75	2,92	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,516(0,8);8,509(0,8);8,490(0,6);8,487(0,6);8,478(0,6);8,475(0,6);7,854(0,4);7,837(0,3);7,833(0,4);7,831(0,4);7,460(0,5);7,448(0,5);7,440(0,4);7,428(0,4);7,367(1,4);7,346(1,6);7,071(1,6);7,050(1,4);6,424(1,0);3,740(5,6);3,384(5,	40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			5);3,320(5,7);3,177(0,4);3,163(0,4);2,506(7,0);2,502(9,2);2,498(6,8);1,246(16,0);1,074(0,4);1,057(0,9);1,039(0,4);0,000(5,8)
I-A-64	2,63	2,71	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,526(2,8);8,520(2,9);8,493(2,2);8,482(2,2);7,854(1,5);7,852(1,4);7,834(1,6);7,832(1,5);7,702(2,3);7,681(2,5);7,592(2,9);7,589(2,9);7,448(1,5);7,436(1,6);7,428(1,5);7,416(1,4);7,330(1,6);7,309(1,5);6,514(3,0);5,756(3,5);5,755(4,1);3,778(16,0);3,398(15,7);3,322(15,0);2,503(30,6);0,000(22,0)
I-A-65	1,01	1,18	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,535(2,3);8,529(2,4);8,505(1,6);8,502(1,7);8,493(1,7);8,490(1,7);8,397(1,3);8,387(1,3);8,384(1,3);7,878(0,8);7,874(1,0);7,873(1,0);7,869(0,9);7,858(1,0);7,854(1,1);7,852(1,1);7,848(0,9);7,727(0,8);7,722(0,8);7,707(1,4);7,703(1,5);7,688(0,9);7,683(0,9);7,479(1,3);7,468(1,3);7,459(1,3);7,447(1,2);7,229(1,1);7,217(1,2);7,211(1,2);7,198(1,0);6,814(2,0);6,794(1,9);6,542(2,2);3,753(16,0);3,414(15,4);3,320(14,3);2,507(21,1);2,502(27,9);2,498(21,2);0,008(0,6);0,000(13,8)
I-A-66	1,97	2,11	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,532(2,3);8,526(2,4);8,495(1,6);8,491(1,7);8,483(1,7);8,479(1,7);7,858(0,8);7,854(1,0);7,852(1,0);7,848(0,9);7,838(0,9);7,834(1,1);7,832(1,1);7,828(1,0);7,456(1,3);7,444(1,3);7,435(1,2);7,423(1,2);7,380(0,7);7,360(2,2);7,341(3,1);7,335(2,7);7,332(1,7);7,320(0,5);7,315(0,7);7,312(0,4);7,136(1,5);7,131(2,8);6,993(0,9);6,989(1,7);6,986(1,0);6,976(0,9);6,971(1,5);6,967(0,9);6,512(2,5);5,755(1,2);3,760(16,0);3,398(15,4);3,321(12,6);2,507(17,4);2,502(23,0);2,498(17,5);2,086(1,8);0,007(0,5);0,000(13,1)
I-A-67	1,17	1,25	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,513(2,1);8,506(2,2);8,490(1,5);8,487(1,6);8,478(1,5);8,475(1,5);8,137(1,7);7,859(0,8);7,855(1,0);7,853(1,0);7,849(0,9);7,839(1,0);7,835(1,1);7,832(1,1);7,829(0,9);7,460(1,3);7,448(1,3);7,439(1,2);7,428(1,2);7,342(2,1);7,334(2,2);7,327(2,4);7,319(3,7);7,309(0,9);7,297(2,1);7,290(1,0);7,287(0,8);7,283(1,1);7,274(0,7);6,823(1,3);6,815(1,3);6,810(1,0);6,801(1,3);6,450(2,7);5,754(5,4);3,712(16,0);3,700(0,4);3,388(15,4);3,319(3,8);2,988(11,2);2,722(11,2);2,671(0,3);2,524(0,7);2,510(18,9);2,506(38,0);2,502(50,3);2,497(37,5);2,328(0,3);0,008(1,9);0,000(48,7);-0,008(2,3)
I-A-68	1,71	1,77	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,539(2,1);8,534(2,2);8,493(1,6);8,490(1,7);8,482(1,7);8,478(1,6);8,136(0,5);8,108(1,0);8,106(1,1);8,102(1,1);8,100(1,0);8,087(1,1);8,085(1,2);8,082(1,3);8,080(1,1);7,881(1,5);7,876(2,6);7,871(1,5);7,857(0,9);7,853(1,1);7,850(1,0);7,847(0,9);7,836(1,0);7,833(1,1);7,830(1,1);7,826(1,0);7,653(1,3);7,633(2,6);7,613(1,5);7,513(1,3);7,511(1,5);7,509(1,5);7,507(1,3);7,494(1,0);7,491(1,1);7,489(1,1);7,487(0,9);7,454(1,2);7,453(1,2);7,443(1,2);7,441(1,2);7,434(1,1);7,433(1,1);7,422(1,1);7,421(1,0);

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			6,544(2,3);3,783(16,0);3,404(15,3);3,311(4,4);2,524(0,4);2,511(8,9);2,507(17,7);2,502(23,0);2,498(17,0);2,073(10,4);0,000(1,9)
I-A-69	1,56	1,63	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,529(1,0);8,522(1,1);8,513(0,7);8,510(0,8);8,502(0,8);8,498(0,8);8,151(0,3);7,886(0,4);7,882(0,5);7,880(0,5);7,876(0,4);7,866(0,5);7,862(0,5);7,859(0,5);7,856(0,5);7,851(0,7);7,847(0,7);7,831(0,8);7,828(0,8);7,528(0,3);7,513(0,6);7,510(0,6);7,494(0,5);7,489(0,8);7,476(0,6);7,467(0,5);7,455(0,6);7,451(0,6);7,448(0,6);7,429(0,8);6,598(1,0);6,354(0,8);6,334(0,7);5,754(1,0);3,708(7,2);3,414(6,8);3,318(4,7);2,815(16,0);2,524(0,6);2,510(11,6);2,506(23,5);2,502(31,1);2,497(23,2);2,493(11,8);0,08(1,1);0,000(29,5);-0,008(1,3)
I-A-70	1,45	1,52	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,513(2,0);8,508(2,1);8,485(1,5);8,482(1,6);8,473(1,6);8,470(1,6);8,233(2,1);8,227(2,1);8,226(2,1);8,141(0,4);7,853(0,8);7,849(1,0);7,847(1,0);7,843(0,9);7,833(1,0);7,829(1,1);7,826(1,1);7,823(1,0);7,648(1,4);7,641(1,4);7,627(1,9);7,620(1,9);7,521(2,5);7,520(2,6);7,500(1,8);7,499(1,8);7,452(1,1);7,441(1,1);7,440(1,1);7,433(1,1);7,431(1,1);7,421(1,0);7,419(1,0);6,435(2,6);5,751(1,2);3,786(16,0);3,388(15,3);3,309(13,5);2,524(0,7);2,510(17,8);2,506(35,9);2,501(47,4);2,497(35,8);0,000(3,7)
I-A-71	1,68	1,78	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,513(2,5);8,507(2,4);8,498(0,9);8,487(2,1);8,484(2,1);8,475(1,7);8,472(1,6);7,855(1,2);7,851(1,3);7,849(1,3);7,845(1,3);7,835(1,3);7,831(1,3);7,828(1,2);7,825(1,0);7,456(1,7);7,444(1,6);7,435(1,5);7,423(1,2);7,397(0,4);7,392(0,5);7,383(0,6);7,376(1,0);7,358(1,1);7,354(0,8);7,344(0,6);7,340(0,5);7,312(1,1);7,309(1,1);7,292(0,9);7,288(1,5);7,285(1,1);7,267(0,7);7,264(0,6);7,188(1,1);7,185(1,1);7,169(1,7);7,166(1,6);7,151(0,9);7,147(0,8);6,920(0,9);6,916(1,0);6,900(1,6);6,896(1,5);6,881(0,7);6,877(0,7);6,438(2,9);6,237(0,4);3,779(3,2);3,767(16,0);3,674(1,6);3,400(3,2);3,389(15,6);3,373(0,4);3,360(1,6);3,322(3,5);3,311(12,5);3,037(0,4);2,510(27,1);2,506(37,5);2,501(41,6);2,497(28,4);0,858(0,5);0,840(0,9);0,821(0,4);0,011(0,5);0,000(2,8)
I-A-72	1,59	1,74	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,522(3,3);8,492(2,4);8,481(2,4);7,867(1,6);7,847(1,8);7,467(1,5);7,455(1,7);7,447(1,5);7,435(1,3);7,249(1,0);7,229(2,2);7,210(1,3);7,051(2,7);7,031(2,2);6,879(1,3);6,860(2,5);6,841(1,3);6,475(3,7);6,421(2,3);6,402(2,2);5,754(1,3);3,819(16,0);3,732(16,0);3,398(15,7);3,321(8,9);2,502(36,3);0,000(2,8)
I-A-73	1,81	1,87	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,509(2,2);8,503(2,2);8,460(1,6);8,457(1,7);8,448(1,7);8,445(1,7);7,927(1,2);7,923(2,5);7,918(2,0);7,907(1,4);7,888(2,4);7,873(1,4);7,868(1,3);7,850(0,9);7,846(1,1);7,844(1,0);7,840(0,9);7,830(1,0);7,826(1,1);7,824(1,2);7,820(1,0);7,725(1,7);7,705(2,7);7,685(1,2);7,420(1,3);7,408(1,3);7,399(1,2);7,387(1,1);6,583(0,6);4,030(16,0);4,0

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
			16(0,3);3,388(15,2);3,315(50,4);2,675(0,4);2,670(0,6);2,666(0,5);2,510(36,0);2,506(69,7);2,501(93,6);2,497(72,1);2,333(0,5);2,328(0,6);2,324(0,5);0,146(0,5);0,008(4,9);0,000(99,4);-0,008(4,9);-0,019(0,4);-0,150(0,5)	
I-A-74	1,45	1,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,505(2,3);8,499(2,4);8,476(1,7);8,472(1,8);8,464(1,8);8,461(1,9);8,137(2,6);7,842(0,9);7,839(1,1);7,836(1,1);7,832(1,0);7,822(1,1);7,818(1,3);7,816(1,3);7,812(1,1);7,661(0,9);7,657(1,2);7,654(1,7);7,650(3,3);7,645(4,2);7,642(2,9);7,629(2,0);7,610(2,5);7,601(0,5);7,598(0,4);7,589(1,2);7,551(1,3);7,547(2,1);7,543(1,3);7,532(0,9);7,528(1,3);7,525(0,8);7,431(1,3);7,419(1,3);7,411(1,3);7,399(1,2);6,471(1,1);3,907(16,0);3,376(15,3);3,316(5,7);2,670(0,4);2,666(0,3);2,506(46,5);2,501(62,9);2,497(50,5);2,328(0,4);2,324(0,3);0,008(2,8);0,000(63,9)	10
I-A-75	2,14	2,19	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,504(0,8);8,498(0,8);8,481(0,6);8,478(0,6);8,470(0,6);8,466(0,6);8,139(0,6);7,839(0,4);7,837(0,4);7,833(0,3);7,823(0,3);7,819(0,4);7,816(0,4);7,813(0,3);7,626(1,1);7,604(1,7);7,519(1,7);7,498(1,1);7,437(0,4);7,425(0,5);7,417(0,4);7,405(0,4);6,459(0,4);3,845(5,4);3,369(5,1);3,316(8,7);2,510(11,9);2,506(23,5);2,501(31,8);2,497(24,8);1,298(16,0);0,008(1,7);0,000(35,6);-0,008(1,8)	20
I-A-76	2,53	2,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,515(0,9);8,509(0,9);8,461(0,7);8,449(0,7);7,852(1,6);7,831(2,1);7,697(1,7);7,675(1,3);7,424(0,5);7,412(0,5);7,404(0,6);7,392(0,5);5,752(1,9);4,017(5,4);3,383(5,2);3,371(0,3);3,316(5,0);2,502(9,5);1,300(16,0);0,000(6,2)	
I-A-77			¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,467(1,2);8,464(1,3);8,455(1,3);8,452(1,3);8,400(1,7);8,394(1,7);7,651(0,7);7,647(0,9);7,645(0,8);7,641(0,7);7,630(1,0);7,626(2,2);7,621(3,2);7,617(1,6);7,515(5,3);7,511(4,8);7,355(1,0);7,343(1,0);7,334(0,9);7,322(0,9);6,424(1,2);3,918(16,0);3,391(16,0);2,142(23,5);2,113(1,1);2,106(0,9);2,100(0,7);2,094(0,4);1,963(2,1);1,957(4,1);1,951(26,4);1,945(48,5);1,939(66,8);1,933(46,1);1,926(23,8);1,767(0,4);0,146(1,2);0,008(10,3);0,000(243,1);-0,009(11,1);-0,033(0,6);-0,150(1,2)	30
I-A-78	2,37	2,53	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,512(2,5);8,506(2,5);8,462(1,8);8,460(1,9);8,451(1,9);8,448(1,9);8,118(1,8);8,114(2,9);8,110(1,8);7,933(6,3);7,928(6,0);7,848(1,3);7,827(1,4);7,422(1,4);7,410(1,4);7,401(1,3);7,390(1,2);6,625(0,8);5,753(1,7);4,042(16,0);3,394(15,4);3,315(45,2);2,671(0,6);2,501(97,2);2,328(0,7);0,000(22,3)	
I-A-79	2,16	2,29	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,503(2,9);8,498(2,9);8,467(2,3);8,455(2,3);8,072(3,7);7,973(0,8);7,952(5,1);7,922(0,6);7,845(1,5);7,824(1,7);7,425(1,5);7,413(1,6);7,405(1,5);7,393(1,4);6,450(1,5);5,752(3,7);3,985(16,0);3,380(15,6);3,313(43,1);2,891(0,7);2,731(0,7);2,670(0,9);2,501(137,8);2,327(0,9);0,000(30,9)	40
I-A-80	2,56	2,72	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,503(2,8);8,4	

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			98(2,8);8,455(2,2);8,444(2,2);8,256(1,5);8,235(1,8);8,192(3,3);8,063(2,7);8,042(2,2);7,848(1,5);7,829(1,6);7,419(1,5);7,407(1,6);7,399(1,4);7,387(1,3);6,604(0,9);4,043(16,0);3,390(15,6);3,314(43,1);2,671(0,8);2,501(125,8);2,328(0,8);0,000(25,2)
I-A-81	1,53	1,58	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,506(2,4);8,500(2,5);8,463(1,7);8,460(2,0);8,451(1,8);8,448(1,9);7,861(4,1);7,852(1,6);7,839(5,0);7,832(1,8);7,828(1,6);7,825(1,5);7,822(1,2);7,428(1,4);7,417(1,4);7,408(1,3);7,396(1,2);7,185(0,7);7,178(4,4);7,155(4,2);6,486(0,9);5,754(4,5);4,002(15,6);3,862(16,0);3,820(0,4);3,379(14,9);3,330(1,5);3,319(33,0);2,687(0,7);2,674(1,0);2,506(54,0);2,502(71,2);2,497(57,9);2,328(0,5);2,086(3,8);0,008(2,6);0,000(38,0)
I-A-82	1,53	1,62	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,506(1,8);8,501(1,9);8,460(1,5);8,448(1,4);8,314(0,5);8,027(2,0);8,014(2,1);8,009(1,5);8,004(2,2);7,996(1,1);7,992(2,0);7,901(1,2);7,898(1,1);7,882(0,6);7,851(0,9);7,847(1,1);7,845(1,1);7,841(0,9);7,831(1,0);7,827(1,2);7,824(1,2);7,821(1,0);7,530(2,3);7,508(4,0);7,486(2,0);7,426(1,2);7,414(1,2);7,406(1,1);7,394(1,0);6,536(0,7);4,021(16,0);3,384(15,2);3,317(96,9);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,1);2,506(159,2);2,501(207,5);2,497(158,2);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(1,0);0,000(5,0)
I-A-83	1,12	1,23	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,464(2,9);8,136(0,9);8,132(1,6);8,126(1,1);8,123(1,1);8,119(1,6);8,114(1,0);8,058(2,1);8,053(1,0);8,045(2,3);8,040(1,5);8,035(2,4);8,027(1,1);8,023(2,3);7,543(2,3);7,521(4,3);7,503(0,8);7,499(2,1);7,421(0,4);7,417(0,4);7,401(4,9);7,389(2,2);7,368(0,4);6,788(3,0);4,099(0,9);4,085(0,9);4,072(0,3);4,032(16,0);3,348(15,6);3,323(27,4);3,176(3,4);3,163(3,3);2,507(23,5);2,503(30,9);2,498(2,3,6);0,000(0,5)
I-A-84	1,22	1,27	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,497(2,2);8,491(2,3);8,478(1,6);8,475(1,7);8,466(1,6);8,463(1,6);7,842(0,9);7,838(1,1);7,832(0,9);7,821(1,0);7,818(1,2);7,815(1,1);7,812(0,9);7,684(1,9);7,679(1,0);7,671(2,1);7,667(1,5);7,662(2,4);7,654(1,1);7,649(2,2);7,472(0,3);7,465(2,3);7,460(0,9);7,442(4,4);7,426(2,0);7,420(2,6);7,406(1,2);6,452(1,1);5,754(2,0);3,880(16,0);3,372(15,2);3,318(34,3);2,671(0,4);2,506(49,2);2,502(63,2);2,497(47,1);2,328(0,4);2,086(0,5);0,008(0,5);0,000(7,4)
I-A-85	1,01	1,10	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,744(1,4);8,742(1,2);8,736(1,0);8,733(1,6);8,730(1,1);8,514(1,9);8,508(2,0);8,461(1,4);8,458(1,6);8,449(1,5);8,446(1,6);8,208(0,4);8,204(0,5);8,189(1,4);8,185(1,4);8,172(3,3);8,168(3,7);8,153(0,5);8,151(0,5);7,854(0,8);7,851(1,0);7,848(1,0);7,844(0,9);7,834(1,0);7,830(1,1);7,828(1,1);7,824(0,9);7,790(0,9);7,785(0,9);7,778(0,9);7,773(1,6);7,768(0,9);7,762(0,9);7,757(0,8);7,430(1,2);7,418(1,2);7,410(1,1);7,398(1,0);6,628(0,5);5,754(2,5);4,095(16,0);3,402(15,1);3,317(19,4);2,675(0,3);2,670(0

10

20

30

40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			,5);2,666(0,4);2,510(26,1);2,506(51,0);2,501(68,0);2, 497(51,7);2,492(26,7);2,328(0,4);0,000(0,4)
I-A-86	0,59	0,80	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,591(1,8);8,5 81(1,8);8,501(2,6);8,495(2,8);8,474(2,1);8,462(2,1);8, 171(0,8);8,155(1,7);8,152(1,9);8,136(4,8);8,035(2,5); 8,016(1,8);7,839(1,3);7,835(1,2);7,819(1,5);7,815(1,2));7,584(1,3);7,573(1,4);7,566(1,3);7,554(1,2);7,439(1, 5);7,427(1,5);7,419(1,5);7,407(1,3);6,433(1,3);3,857(16,0);3,370(16,0);3,320(3,9);2,671(0,4);2,501(55,8);2 ,329(0,4)
I-A-87	1,04	1,20	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,494(2,3);8,4 87(2,3);8,480(1,7);8,476(1,7);8,468(1,7);8,464(1,8);8, 138(1,2);7,836(0,9);7,832(1,0);7,831(1,0);7,827(0,9); 7,816(1,1);7,812(1,1);7,810(1,1);7,806(0,9);7,605(0,7));7,601(0,8);7,597(1,1);7,584(8,1);7,578(7,3);7,568(1, 6);7,557(0,8);7,435(1,3);7,423(1,3);7,415(1,2);7,403(1,2);7,395(0,3);6,466(1,0);5,754(3,4);4,021(0,9);4,01 2(0,8);3,832(16,0);3,382(1,0);3,367(15,2);3,343(1,4); 3,320(10,5);2,510(18,0);2,506(33,9);2,502(43,7);2,49 7(32,5);2,493(16,2);0,000(2,1)
I-A-88	1,37	1,47	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,507(2,2);8,5 00(2,2);8,460(1,6);8,457(1,6);8,448(1,7);8,445(1,6);7, 927(2,9);7,908(3,5);7,847(0,9);7,843(1,1);7,838(0,9); 7,827(1,0);7,822(1,2);7,817(1,0);7,809(0,7);7,790(1,9));7,772(1,2);7,691(2,6);7,671(3,6);7,652(1,5);7,420(1, 3);7,408(1,3);7,400(1,3);7,388(1,2);6,544(0,7);5,754(4,3);4,012(16,0);3,382(15,3);3,320(33,6);2,506(34,7); 2,501(44,4);2,497(33,4);0,000(1,9);-0,001(2,0)
I-A-89	1,20	1,38	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,495(2,5);8,4 89(2,7);8,463(1,8);8,460(2,0);8,447(2,7);8,441(2,9);8, 436(2,3);8,418(1,5);8,398(1,5);8,394(1,3);8,039(1,5); 8,019(1,9);7,892(1,7);7,872(2,8);7,852(1,3);7,844(1,0));7,838(1,3);7,835(1,1);7,824(1,1);7,818(1,4);7,814(1, 1);7,424(1,4);7,412(1,4);7,404(1,4);7,392(1,4);6,462(1,2);5,754(8,3);3,957(16,0);3,376(15,3);3,349(0,6);3, 319(46,3);2,671(0,4);2,666(0,3);2,506(48,2);2,502(63 ,4);2,497(51,2);2,328(0,4);0,000(13,5)
I-A-90	1,58	1,68	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,610(1,4);8,6 06(1,5);8,604(1,5);8,589(1,4);8,586(1,6);8,584(1,7);8, 550(2,9);8,502(2,3);8,497(2,4);8,449(1,9);8,438(1,9); 8,377(1,7);8,357(1,8);7,988(1,6);7,968(2,8);7,948(1,3));7,848(1,3);7,845(1,4);7,827(1,4);7,825(1,5);7,418(1, 4);7,406(1,4);7,397(1,4);7,385(1,2);6,610(0,8);5,754(10,9);4,049(16,0);3,387(15,5);3,330(29,8);2,670(0,5); 2,501(69,6);2,328(0,5);0,000(11,9)
I-A-91	0,76	0,96	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,539(2,4);8,5 33(2,4);8,480(1,7);8,477(1,8);8,469(1,8);8,465(1,7);8, 142(0,4);8,053(1,8);8,033(2,0);7,902(0,9);7,898(1,1); 7,892(0,9);7,882(1,1);7,877(1,2);7,872(1,0);7,756(0,9));7,754(0,9);7,735(1,8);7,718(1,0);7,715(1,0);7,607(1, 0);7,590(1,9);7,588(1,9);7,572(1,0);7,569(1,0);7,458(1,5);7,447(3,1);7,437(1,5);7,428(2,0);6,362(1,2);5,75 4(5,1);3,978(16,0);3,384(15,4);3,321(46,6);2,743(4,1)

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			;2,675(0,4);2,670(0,5);2,506(54,4);2,501(71,4);2,497(54,1);2,439(4,0);2,333(0,3);2,328(0,5);2,324(0,3);0,00(7,4)
I-A-92	1,12	1,29	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,522(2,3);8,516(2,3);8,453(1,8);8,443(1,8);8,134(1,2);8,034(1,8);8,014(2,1);7,839(1,3);7,819(2,1);7,802(2,0);7,783(1,3);7,710(1,3);7,691(1,9);7,673(0,8);7,455(2,1);7,436(1,9);7,416(1,4);7,404(1,4);7,396(1,3);7,384(1,3);6,548(0,7);5,754(6,4);3,986(15,8);3,395(15,4);3,321(37,3);2,958(16,0);2,670(0,5);2,646(14,9);2,506(45,7);2,502(58,2);2,498(45,4);2,329(0,4);0,000(4,4)
I-A-93	1,12	1,28	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,497(0,6);8,313(1,0);8,134(0,8);8,016(0,5);7,855(0,9);7,834(1,0);7,634(0,4);7,629(0,4);7,554(0,4);7,546(3,2);7,524(3,6);7,459(0,6);7,447(0,7);7,438(0,7);7,427(0,6);7,142(3,6);7,120(3,3);6,447(1,0);4,432(0,3);4,349(0,5);4,002(3,7);3,972(3,3);3,961(3,3);3,863(3,1);3,852(15,2);3,820(16,0);3,749(1,3);3,742(1,2);3,671(0,8);3,637(0,6);3,605(0,5);3,544(0,4);3,510(0,4);3,381(1,0);3,370(12,8);2,789(3,7);2,675(1,3);2,671(1,8);2,666(1,3);2,510(11,2,8);2,506(220,1);2,501(293,3);2,497(224,0);2,437(0,6);2,400(0,4);2,385(0,3);2,370(0,4);2,333(1,5);2,328(2,0);2,324(1,6);0,008(0,6);0,000(14,9);-0,008(0,6)
I-A-94	1,18	1,39	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8,484(1,3);8,481(1,4);8,473(1,4);8,469(1,4);8,430(1,9);8,424(2,0);8,287(1,9);8,280(2,0);7,705(0,7);7,702(0,9);7,699(0,8);7,696(0,7);7,685(0,8);7,681(1,0);7,679(1,0);7,675(0,8);7,473(0,7);7,465(0,6);7,451(1,2);7,444(1,2);7,430(0,7);7,422(0,7);7,396(1,1);7,384(1,1);7,376(1,0);7,364(0,9);6,957(1,2);6,947(1,2);6,935(1,1);6,925(1,1);6,487(2,5);5,447(5,3);3,779(16,0);3,423(15,8);2,763(0,7);2,751(0,7);2,165(8,4);1,958(0,5);1,952(3,2);1,946(5,8);1,940(7,9);1,934(5,4);1,927(2,8);0,008(0,7);0,000(17,4);-0,009(0,7)
I-A-95	1,41	1,39	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,449(2,9);8,138(0,9);8,134(1,7);8,129(1,1);8,124(1,1);8,120(1,7);8,116(1,0);8,020(2,5);7,984(1,2);7,965(1,6);7,941(1,2);7,921(1,8);7,854(1,4);7,834(1,9);7,815(0,8);7,419(0,5);7,415(0,4);7,398(4,7);7,383(2,0);7,362(0,5);6,740(3,7);5,755(8,3);3,962(16,0);3,375(0,4);3,340(15,9);3,320(34,9);2,671(0,4);2,506(49,1);2,502(64,8);2,497(49,9);2,328(0,4);0,008(0,8);0,000(16,2);-0,008(0,6)
I-A-96	1,74	1,80	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,502(2,4);8,496(2,4);8,468(1,7);8,465(1,9);8,456(1,8);8,453(1,9);7,971(3,7);7,955(1,6);7,915(1,1);7,895(1,8);7,841(2,1);7,823(2,6);7,814(1,2);7,803(0,6);7,539(0,4);7,422(1,4);7,410(2,1);7,402(1,3);7,390(1,3);6,807(0,8);6,457(1,0);5,754(1,7);3,953(16,0);3,774(2,5);3,375(15,4);3,364(2,8);3,349(0,6);3,318(96,5);2,675(0,7);2,671(0,9);2,666(0,7);2,506(102,8);2,501(134,3);2,497(102,4);2,333(0,6);2,328(0,9);0,008(1,5);0,000(31,3);-0,008(1,3)
I-A-97	0,45	0,48	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,661(6,4);8,649(6,5);8,423(2,7);8,163(0,9);8,159(1,1);8,156(1,1);8,

10

20

30

40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
			153(1,6);8,146(1,3);8,141(1,0);7,436(2,6);7,427(4,1);7,424(3,8);7,340(1,7);7,328(3,2);7,316(1,7);6,802(4,7);3,740(16,0);3,380(15,7);3,320(12,1);2,506(21,1);2,502(28,0);2,498(21,3);1,236(0,5);0,008(0,9);0,000(26,2)	
I-A-98	1,04	1,22	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,518(4,6);8,506(4,7);8,499(1,4);8,495(1,4);8,487(1,3);8,483(1,4);8,402(1,7);8,396(1,9);7,697(0,6);7,693(0,8);7,691(0,8);7,687(0,7);7,677(0,8);7,673(1,0);7,671(0,9);7,667(0,8);7,409(1,0);7,397(1,0);7,388(0,9);7,376(0,9);7,177(1,3);7,165(2,5);7,152(1,2);6,433(1,8);3,950(1,1);3,932(3,4);3,914(3,5);3,896(1,3);3,883(0,4);3,874(0,4);3,868(0,5);3,860(0,5);3,853(0,4);3,844(0,4);3,771(15,0);2,527(0,7);2,164(4,4);1,958(0,7);1,952(3,9);1,946(7,1);1,940(9,5);1,934(6,7);1,928(3,5);1,197(3,7);1,179(7,4);1,161(3,6);1,099(16,0);1,084(15,7);0,000(4,6)	10
I-A-99	0,66	0,87	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,553(1,9);8,543(6,2);8,531(5,7);7,924(0,9);7,904(1,1);7,575(0,9);7,563(1,0);7,555(1,0);7,542(0,9);7,209(1,3);7,197(2,5);7,185(1,2);6,700(2,3);4,099(0,5);4,073(1,2);4,040(0,8);3,986(0,8);3,951(0,7);3,907(0,6);3,878(0,6);3,853(0,5);3,810(15,8);3,760(0,4);3,654(1,0);3,467(16,0);3,453(0,8);3,409(1,0);3,337(0,5);3,277(6,0);1,964(0,6);1,958(1,5);1,952(8,2);1,946(15,0);1,940(20,2);1,934(14,1);1,928(7,4);0,000(7,2)	20
I-A-100	1,58		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 9,012(1,2);8,999(1,3);8,913(1,2);8,908(1,2);8,677(0,9);8,663(1,0);8,540(0,6);8,537(0,6);8,516(0,7);8,078(0,7);8,063(0,7);8,057(0,7);8,043(0,8);7,953(2,1);7,724(1,5);7,711(1,5);7,549(0,9);3,995(9,5);3,554(9,5);2,970(0,3);2,919(16,0);2,834(0,6);2,799(15,7);2,769(0,8);2,745(0,9);2,623(1,5);2,607(3,8);2,593(6,2);2,578(3,9);2,545(1,7);2,500(1,6);2,485(1,5);2,276(0,5);2,201(0,4);2,120(0,3);2,114(0,4);2,108(0,5);2,101(0,4);1,965(1,2);1,958(2,8);1,953(16,1);1,947(29,7);1,940(40,5);1,934(28,2);1,928(14,8);1,769(0,3);1,285(0,4);1,272(1,0);0,008(2,3);0,008(63,5);-0,008(3,0)	30
I-A-101	1,00		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,471(1,0);8,461(1,1);8,428(1,4);8,423(1,4);8,342(1,1);8,329(1,2);8,032(0,8);7,719(0,7);7,716(0,9);7,713(0,8);7,709(0,7);7,699(0,9);7,695(1,0);7,693(0,9);7,689(0,8);7,398(0,9);7,385(0,9);7,377(0,9);7,365(0,8);7,040(1,7);7,027(1,6);6,458(1,3);3,780(16,0);3,428(16,0);2,380(12,8);2,153(65,7);2,119(0,5);2,113(0,5);2,107(0,5);2,100(0,4);1,963(1,9);1,957(4,5);1,952(24,5);1,945(44,5);1,939(59,8);1,933(40,8);1,927(20,7);1,768(0,3);0,146(0,7);0,008(6,5);0,000(147,6);-0,009(6,1);-0,150(0,7)	
I-A-102	1,61	1,79	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,474(0,7);8,471(0,7);8,462(0,7);8,459(0,8);8,406(1,0);8,400(1,0);7,726(0,4);7,722(0,5);7,720(0,5);7,716(0,4);7,706(0,4);7,702(0,5);7,700(0,5);7,696(0,4);7,390(0,6);7,378(0,6);7,369(0,5);7,357(0,5);6,428(1,2);5,849(2,9);5,447(3,7);3,845(8,1);3,737(16,0);3,411(8,1);2,158(11,4);1,958(40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
			0,5);1,952(3,0);1,946(5,4);1,940(7,3);1,934(5,0);1,927(2,6);0,008(0,6);0,000(14,9);-0,008(0,6)	
I-A-103	1,23		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,474(1,1);8,463(1,1);8,428(1,3);8,174(1,9);7,717(0,8);7,714(0,9);7,708(0,7);7,697(0,9);7,693(1,0);7,691(1,0);7,687(0,8);7,398(1,0);7,387(1,0);7,378(0,9);7,366(0,8);6,449(1,0);4,089(0,5);3,915(0,4);3,774(15,5);3,451(0,5);3,427(16,0);2,467(0,4);2,340(12,4);2,179(265,0);2,159(12,3);2,113(0,4);2,107(0,4);2,101(0,3);1,964(2,2);1,952(27,8);1,946(50,3);1,940(67,5);1,934(46,1);1,928(23,7);1,769(0,4);0,146(0,7);0,008(6,8);0,000(150,8);-0,008(6,8);-0,150(0,8)	10
I-A-104	0,97		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,501(0,3);8,474(0,4);8,462(0,4);8,449(0,4);8,408(0,5);8,403(0,5);7,703(0,9);7,683(1,1);7,407(0,4);3,864(0,4);3,806(0,4);3,763(12,8);3,427(16,0);3,382(0,7);2,216(7,9);2,162(45,1);1,972(0,7);1,964(1,0);1,958(2,3);1,952(13,3);1,946(24,2);1,940(32,8);1,933(22,3);1,927(11,3);1,204(0,3);1,100(5,4);1,085(5,3);0,008(2,1);0,000(56,9);-0,009(2,0)	
I-A-105	1,64	1,73	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,087(6,0);9,085(6,0);8,529(2,0);8,523(2,1);8,500(1,6);8,497(1,7);8,488(1,7);8,485(1,7);7,865(0,8);7,861(0,9);7,858(0,9);7,855(0,8);7,844(0,9);7,841(1,0);7,838(1,0);7,834(0,9);7,488(1,1);7,476(1,1);7,468(1,0);7,456(1,0);6,522(1,2);5,754(9,2);3,770(16,0);3,417(15,1);3,321(12,8);2,520(0,5);2,511(8,3);2,507(17,5);2,502(23,5);2,498(16,9);2,493(8,1);0,008(1,2);0,000(36,7);-0,009(1,2)	20
I-A-106	1,20		¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,512(1,5);8,508(1,6);8,490(1,2);8,483(1,2);8,337(3,1);8,328(3,1);7,881(0,8);7,879(1,0);7,877(0,9);7,875(0,8);7,868(0,9);7,865(1,1);7,864(1,0);7,861(0,9);7,466(1,0);7,458(1,0);7,453(1,0);7,445(0,9);6,726(3,3);6,716(3,3);6,467(1,1);3,900(2,4);3,791(15,7);3,697(16,0);3,401(14,9);3,358(1,0);3,328(672,2);3,304(2,7);3,282(0,5);3,174(1,0);3,165(1,0);2,617(0,6);2,614(0,8);2,611(0,5);2,523(1,4);2,520(1,8);2,517(2,0);2,508(46,4);2,505(93,3);2,502(127,2);2,499(96,7);2,496(49,0);2,389(0,6);2,386(0,8);2,383(0,6);1,909(0,5);0,000(0,9)	30
I-A-107	1,04	1,20	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,490(4,7);8,436(0,4);7,710(0,5);7,706(0,7);7,704(0,6);7,700(0,5);7,689(0,6);7,686(0,7);7,683(0,7);7,680(0,6);7,406(0,4);7,394(0,5);7,386(0,5);7,374(0,4);6,491(0,6);5,446(3,5);3,776(15,9);3,430(16,0);1,958(0,5);1,952(3,8);1,946(7,1);1,939(9,8);1,933(6,7);1,927(3,4);1,538(0,4);0,008(0,8);0,000(25,5);-0,009(0,9)	
I-A-108	1,28	1,43	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,481(1,1);8,477(1,1);8,469(1,1);8,466(1,1);8,434(1,5);8,428(1,5);7,716(0,7);7,712(0,8);7,709(0,8);7,706(0,7);7,695(0,8);7,692(0,9);7,689(0,9);7,685(0,8);7,509(1,1);7,490(2,1);7,470(1,2);7,396(0,9);7,394(0,9);7,384(1,0);7,382(0,9);7,375(0,9);7,374(0,8);7,363(0,8);7,362(0,8);7,005(1,6);6,986(1,4);6,564(1,5);6,544(1,4);6,486(2,1);5,446(0,	40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
			4);3,788(16,0);3,426(15,9);2,401(10,8);2,152(13,0);1,964(0,5);1,957(1,0);1,952(7,1);1,945(13,4);1,939(18,5);1,933(12,7);1,927(6,5);1,270(0,4);0,008(1,3);0,000(40,6);-0,009(1,7)
I-A-109			¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,483(0,7);8,473(0,7);8,429(0,8);8,202(0,6);7,705(0,6);7,701(0,7);7,698(0,7);7,694(0,6);7,684(0,7);7,681(0,8);7,678(0,8);7,674(0,7);7,463(0,6);7,459(0,6);7,443(0,7);7,439(0,6);7,397(0,7);7,385(0,7);7,376(0,7);7,364(0,6);6,767(0,7);6,747(0,7);6,482(0,5);5,447(1,3);3,767(15,6);3,421(16,0);2,249(7,3);2,158(11,1);1,958(0,6);1,952(4,5);1,945(8,5);1,939(11,8);1,933(8,0);1,927(4,1);0,008(1,1);0,000(33,1);-0,009(1,1)
I-A-110	1,77	1,93	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,475(1,1);8,472(1,2);8,463(1,2);8,460(1,4);8,442(1,1);8,423(1,6);8,417(1,6);8,034(1,1);8,015(1,1);7,718(0,7);7,714(0,8);7,711(0,8);7,708(0,7);7,697(0,8);7,693(1,0);7,691(1,0);7,687(0,8);7,402(1,0);7,390(1,1);7,381(1,0);7,369(0,9);7,327(0,8);7,315(0,8);7,307(0,8);7,295(0,7);6,490(1,8);5,447(3,1);3,763(0,6);3,756(0,6);3,734(16,0);3,429(15,9);3,388(1,1);2,190(31,2);1,958(0,5);1,952(3,9);1,946(7,3);1,940(10,1);1,934(6,8);1,928(3,5);0,007(0,6);0,000(17,0);-0,009(0,6)
I-A-111	1,73	1,78	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,609(14,5);8,597(14,9);8,564(0,6);8,552(0,6);8,447(3,8);8,442(4,5);8,436(4,2);8,432(4,3);8,314(0,5);8,082(0,6);7,914(5,5);7,866(0,3);7,420(1,4);7,414(1,1);7,404(3,8);7,399(6,5);7,394(7,9);7,382(4,8);7,363(4,0);7,346(8,0);7,328(7,5);7,313(6,9);7,301(8,8);7,293(4,8);7,290(5,3);7,276(1,3);7,219(0,4);7,201(0,6);7,184(0,5);7,158(8,1);7,140(7,1);7,078(0,3);6,637(3,6);5,685(0,5);5,597(0,5);5,485(16,0);3,392(0,8);3,375(0,8);3,357(0,5);3,319(142,2);3,287(36,5);3,266(0,7);3,212(0,4);2,671(1,1);2,506(140,0);2,502(186,0);2,498(152,0);2,329(1,1);1,355(0,4);1,109(0,7);1,091(1,5);1,074(0,7);0,146(0,8);0,000(164,9);-0,150(0,8)
I-A-112	0,56	0,85	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,740(5,4);8,728(5,6);8,485(3,5);8,480(3,7);8,472(1,7);8,469(1,7);7,842(0,8);7,838(0,9);7,835(0,9);7,831(0,9);7,821(0,9);7,817(1,1);7,815(1,1);7,811(0,9);7,458(1,2);7,446(1,2);7,438(1,1);7,425(1,1);7,410(1,4);7,398(2,6);7,385(1,3);6,224(3,6);4,469(9,4);4,098(0,6);4,085(0,6);3,642(16,0);3,357(15,2);3,321(16,5);3,176(2,7);3,163(2,7);2,525(0,4);2,511(10,4);2,507(21,6);2,502(29,1);2,498(21,8);2,493(11,3);0,008(0,5);0,000(16,5);-0,008(0,7)
I-A-113	0,66	0,93	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,919(0,4);8,693(0,3);8,551(2,4);8,547(2,3);8,526(3,7);8,516(3,3);8,510(2,5);8,496(2,9);8,490(4,6);8,478(2,0);7,823(1,3);7,805(1,3);7,802(1,5);7,459(1,5);7,447(1,5);7,439(1,4);7,427(1,3);6,249(4,0);5,953(0,9);4,413(9,6);4,102(0,5);4,089(0,5);3,603(16,0);3,355(15,6);3,327(21,3);3,175(2,5);3,163(2,4);2,784(0,9);2,771(0,9);2,505(33,7);0,008(0,7);0,000(13,8)

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
I-A-114	0,20	0,85	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,497(3,9);8,492(3,3);8,485(2,0);8,482(1,8);7,815(0,8);7,809(1,0);7,805(0,9);7,795(1,0);7,791(1,1);7,789(1,2);7,785(1,0);7,551(3,3);7,470(1,3);7,458(1,3);7,450(1,2);7,438(1,1);6,567(3,2);6,285(3,8);4,279(8,4);4,098(0,9);4,085(0,9);3,560(16,0);3,540(15,9);3,360(15,8);3,342(0,6);3,321(9,3);3,303(0,6);3,175(4,2);3,163(4,2);2,506(26,0);2,502(34,4);2,497(25,8);0,008(0,6);0,000(16,9);-0,008(0,7)
I-A-115	0,76	1,12	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,496(2,7);8,490(3,8);8,481(1,8);8,478(1,6);7,854(0,9);7,850(1,1);7,847(1,0);7,843(0,9);7,833(1,0);7,829(1,2);7,827(1,1);7,823(0,9);7,557(2,6);7,552(2,5);7,468(1,3);7,456(1,3);7,448(1,2);7,436(1,2);6,278(3,8);5,939(2,8);5,934(2,7);4,174(8,9);4,101(0,5);4,088(0,5);3,763(16,0);3,599(15,8);3,364(15,1);3,322(13,8);3,176(2,2);3,162(2,1);2,524(0,5);2,506(20,9);2,502(26,4);2,498(18,9);0,008(0,4);0,000(11,8);-0,009(0,4)
I-A-116	0,16	1,11	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,500(1,6);8,497(1,8);8,488(1,8);8,485(1,8);8,472(2,6);8,464(4,8);8,460(2,9);8,448(4,3);8,439(0,5);8,435(0,5);7,843(0,8);7,837(1,1);7,833(0,9);7,823(1,0);7,817(1,2);7,813(1,0);7,467(1,3);7,455(1,3);7,447(1,3);7,435(1,2);7,237(0,4);7,222(0,4);7,194(3,6);7,179(3,6);6,269(3,8);4,246(8,1);3,681(0,4);3,600(0,4);3,580(16,0);3,385(0,5);3,353(15,5);3,321(33,9);2,506(38,1);2,502(50,4);2,498(3,8);2,329(0,3);1,236(0,4);0,007(1,0);0,000(25,1)
I-A-117	0,63	1,16	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,495(1,8);8,492(2,7);8,484(2,7);8,477(4,1);8,472(3,1);7,846(0,8);7,843(1,0);7,840(1,0);7,836(0,9);7,826(0,9);7,822(1,1);7,820(1,1);7,816(0,9);7,728(0,8);7,723(0,8);7,708(1,6);7,704(1,6);7,689(0,9);7,685(0,9);7,561(0,6);7,467(1,3);7,456(1,3);7,447(1,2);7,435(1,1);7,282(1,1);7,270(1,2);7,266(1,1);7,251(1,0);7,231(1,9);7,211(1,7);6,257(3,8);4,416(1,1);4,345(9,1);4,249(0,3);3,644(1,8);3,638(0,7);3,580(16,0);3,383(0,6);3,356(15,4);3,319(53,6);2,708(0,8);2,697(0,8);2,671(0,5);2,666(0,4);2,506(62,1);2,502(81,5);2,497(61,2);2,333(0,4);2,328(0,5);2,324(0,4);1,236(0,8);0,008(1,3);0,000(34,7);-0,008(1,6)
I-A-118		0,89	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,495(2,2);8,489(3,7);8,480(1,6);8,476(1,7);7,839(0,8);7,835(0,9);7,832(1,0);7,829(0,9);7,818(0,9);7,815(1,0);7,812(1,1);7,808(0,9);7,464(1,1);7,452(1,1);7,444(1,0);7,432(1,0);7,074(2,9);7,072(3,2);6,787(2,9);6,784(3,1);6,283(3,5);4,307(9,3);3,574(15,6);3,480(16,0);3,362(14,8);3,315(3,7);3,173(1,1);3,163(1,1);2,524(0,7);2,511(15,9);2,506(33,8);2,502(46,0);2,497(34,9);2,493(18,1);0,008(0,7);0,000(22,2);-0,008(1,0)
I-A-119	0,39	1,15	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,500(1,5);8,496(1,8);8,491(2,5);8,485(3,8);8,444(1,3);8,440(1,4);8,432(1,4);8,428(1,5);8,413(1,9);8,408(2,0);7,831(0,8);7,827(1,0);7,825(0,9);7,821(0,8);7,811(0,9);7,807(1,0)

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR ;δ (ppm)
);7,804(1,0);7,801(0,9);7,596(0,7);7,592(1,1);7,587(0,7);7,577(0,8);7,572(1,2);7,567(0,8);7,470(1,2);7,457(1,2);7,450(1,1);7,437(1,1);7,314(1,1);7,303(1,1);7,295(1,0);7,283(0,9);6,281(3,7);4,269(7,6);3,553(16,0);3,355(15,2);3,317(44,0);2,677(0,5);2,672(0,6);2,668(0,5);2,525(1,8);2,512(38,7);2,508(79,5);2,503(106,6);2,499(79,6);2,334(0,5);2,330(0,7);2,325(0,5);0,008(0,7);0,000(22,6);-0,008(1,0)
I-A-120	1,34	1,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,491(1,9);8,479(1,9);8,468(2,6);8,461(2,7);8,132(0,7);7,830(1,2);7,826(1,1);7,809(1,4);7,805(1,1);7,574(2,7);7,571(2,9);7,569(2,9);7,467(1,4);7,455(1,4);7,446(1,4);7,435(1,3);6,361(1,5);6,354(2,1);6,349(1,8);6,297(4,1);6,060(2,3);6,052(2,3);5,751(2,0);4,269(9,4);3,570(16,0);3,360(15,6);3,310(7,8);2,501(26,9);2,497(21,9);-0,001(1,7)
I-A-121	2,51	2,62	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,496(1,6);8,492(1,7);8,484(3,9);8,480(3,3);8,136(0,8);7,842(0,8);7,838(1,0);7,836(1,0);7,832(0,9);7,822(0,9);7,818(1,1);7,816(1,1);7,812(0,9);7,553(2,6);7,548(2,7);7,536(2,7);7,516(2,9);7,460(1,2);7,448(1,2);7,440(1,2);7,428(1,1);7,178(1,5);7,173(1,5);7,157(1,3);7,152(1,3);6,280(3,8);5,751(2,6);4,258(7,7);3,600(16,0);3,358(15,4);3,310(8,4);2,524(0,6);2,506(30,2);2,501(39,9);2,497(29,9);0,000(3,0)
I-A-122	1,37	1,58	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,481(1,7);8,472(1,9);8,469(1,8);8,394(2,3);8,388(2,6);8,172(2,0);8,166(2,3);7,654(1,2);7,651(1,1);7,640(1,1);7,634(1,4);7,630(1,2);7,577(1,2);7,570(1,4);7,556(1,4);7,550(1,5);7,394(1,3);7,382(1,5);7,374(1,4);7,362(1,2);7,310(2,3);7,290(2,0);6,268(3,7);4,186(8,5);3,701(0,4);3,584(15,6);3,370(16,0);2,501(1,2);2,163(40,1);2,113(0,5);2,106(0,4);2,100(0,4);1,951(13,0);1,945(23,4);1,939(32,0);1,933(25,9);1,927(16,2);1,270(0,4);0,000(24,1);-0,008(5,9)
I-A-123	1,69	1,92	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,487(1,3);8,484(1,3);8,475(1,3);8,472(1,3);8,391(1,7);8,386(1,7);7,675(0,7);7,671(0,8);7,668(0,8);7,664(0,7);7,654(0,9);7,650(1,0);7,648(0,9);7,644(0,8);7,395(1,0);7,393(1,0);7,383(1,0);7,381(1,0);7,375(0,9);7,373(0,9);7,363(0,9);7,361(0,8);7,331(0,6);7,327(0,6);7,314(0,4);7,310(1,2);7,306(0,4);7,293(0,6);7,289(0,7);7,272(0,3);6,956(1,6);6,936(2,6);6,927(0,3);6,916(1,5);6,264(3,2);5,447(2,6);4,156(5,1);3,628(15,2);3,376(16,0);2,178(21,3);1,958(0,5);1,952(3,5);1,946(6,5);1,940(8,9);1,934(6,1);1,927(3,1);0,008(0,6);0,000(16,4);-0,009(0,6)
I-A-124	1,72	2,03	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,479(1,3);8,476(1,3);8,467(1,3);8,464(1,2);8,406(1,5);8,404(1,6);8,399(1,5);8,398(1,4);7,682(0,8);7,678(0,9);7,675(0,8);7,671(0,8);7,661(1,0);7,658(1,0);7,655(0,9);7,651(0,8);7,391(1,0);7,389(1,0);7,379(1,0);7,377(1,0);7,371(0,9);7,369(0,9);7,359(0,8);7,357(0,8);7,286(0,5);7,269(0,7);7,265(1,2);7,248(1,2);7,244(0,7);7,227(0,6);6,770(1,3);6,749(1,1);6,712(0,7);6,689(1,3);6,668(0,6);6,666(

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
			0,6);6,268(3,0);5,451(0,4);5,447(5,1);4,150(4,4);4,147(4,2);3,754(14,4);3,619(15,8);3,379(16,0);2,170(42,1);1,964(0,4);1,958(0,9);1,952(4,1);1,946(7,2);1,940(9,5);1,933(6,4);1,927(3,2);0,008(1,0);0,004(1,6);0,000(15,8);-0,009(0,6)	
I-A-125	2,09	2,28	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,484(1,2);8,481(1,3);8,472(1,3);8,469(1,3);8,428(1,6);8,422(1,7);7,696(0,7);7,693(0,8);7,690(0,7);7,686(0,7);7,676(0,8);7,672(0,9);7,670(0,9);7,666(0,8);7,396(1,0);7,394(0,9);7,384(1,0);7,382(0,9);7,375(1,1);7,3704(2,7);7,3698(2,7);7,364(1,0);7,350(4,5);7,259(1,7);7,240(1,4);7,237(1,2);7,219(0,9);6,271(3,1);5,448(5,4);4,362(8,2);3,754(0,3);3,633(16,0);3,382(16,0);2,181(32,5);1,964(0,3);1,958(0,7);1,952(5,1);1,946(9,5);1,940(13,1);1,934(8,9);1,928(4,6);0,008(0,7);0,000(22,2);-0,009(0,7)	10
I-A-126	2,47	2,54	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,485(1,2);8,482(1,3);8,474(1,2);8,470(1,3);8,430(1,6);8,424(1,6);7,709(1,1);7,690(2,8);7,688(2,7);7,670(2,0);7,664(0,8);7,481(0,7);7,461(1,2);7,441(0,5);7,393(0,9);7,391(0,9);7,381(0,9);7,380(0,9);7,373(0,8);7,371(0,8);7,361(0,8);7,359(0,8);6,295(3,3);5,446(5,7);4,461(4,7);3,756(0,6);3,659(16,0);3,388(15,9);3,274(0,6);2,141(8,8);1,958(0,7);1,952(5,1);1,946(9,5);1,939(13,1);1,933(8,9);1,927(4,5);0,008(0,8);0,000(24,1);-0,009(0,7)	20
I-A-127	1,89	2,09	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,487(1,4);8,483(1,5);8,475(1,4);8,472(1,5);8,404(2,0);8,397(2,0);7,685(0,8);7,681(0,9);7,679(1,0);7,675(0,9);7,665(0,9);7,661(1,0);7,658(1,1);7,655(0,9);7,395(1,2);7,383(1,2);7,375(1,1);7,363(1,0);7,314(0,5);7,299(0,5);7,293(1,2);7,279(1,2);7,273(1,1);7,259(1,2);7,245(2,1);7,226(0,8);7,072(0,9);7,052(1,4);7,032(0,6);7,028(0,6);6,267(3,5);5,448(6,5);4,238(5,1);4,235(5,2);3,625(16,0);3,378(16,0);2,189(25,7);1,953(3,9);1,947(6,8);1,940(9,0);1,934(6,1);1,928(3,1);0,008(0,8);0,000(13,5);-0,009(0,5)	
I-A-128	1,41	1,68	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,465(0,6);8,461(0,6);8,453(0,6);8,449(0,6);8,402(0,8);8,396(0,8);7,676(0,4);7,673(0,4);7,670(0,4);7,666(0,4);7,656(0,4);7,652(0,4);7,650(0,4);7,646(0,4);7,374(0,5);7,372(0,5);7,362(0,5);7,360(0,5);7,354(0,4);7,352(0,4);7,342(0,4);7,340(0,4);6,257(1,7);5,958(2,3);5,447(0,5);4,217(4,4);3,813(16,0);3,696(8,0);3,689(0,4);3,375(8,0);2,169(14,8);1,958(0,4);1,952(2,7);1,946(5,0);1,940(6,9);1,934(4,7);1,928(2,4);0,000(9,7);-0,009(0,4)	30
I-A-129	2,32	2,44	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,488(1,2);8,484(1,3);8,476(1,3);8,472(1,3);8,411(1,6);8,405(1,7);7,696(0,7);7,692(0,8);7,689(0,8);7,686(0,7);7,675(0,8);7,672(0,9);7,669(0,9);7,665(0,7);7,402(1,0);7,400(0,9);7,390(1,0);7,388(0,9);7,381(0,9);7,380(0,8);7,370(0,8);7,368(0,8);7,100(0,5);7,084(0,9);7,078(1,0);7,063(1,8);7,031(3,3);7,012(1,2);6,306(3,5);5,446(6,4);4,259(7,8);3,764(0,6);3,552(16,0);3,376(15,8);3,268(0,6);2,416(0,3);2,340(0,3);2,328(0,4);2,255(20,5);2,169(23,9);	40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			1,972(0,7);1,963(0,3);1,957(0,7);1,952(4,9);1,945(9,1);1,939(12,6);1,933(8,6);1,927(4,4);0,008(0,5);0,000(16,5);-0,009(0,6)
I-A-130	1,18		¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,514(1,8);8,511(1,7);8,503(1,9);8,384(2,5);8,378(2,2);7,715(1,1);7,711(1,2);7,695(1,3);7,691(1,4);7,427(1,2);7,414(1,4);7,406(1,2);7,395(1,1);7,362(5,2);7,356(5,1);7,351(3,6);7,349(3,7);7,056(2,4);7,051(2,5);7,041(2,6);6,448(2,3);4,422(8,2);3,544(16,0);3,387(16,0);2,134(175,3);2,125(19,2);2,106(1,4);2,100(0,9);1,951(85,8);1,945(141,2);1,939(167,4);1,933(116,4);1,927(58,6);1,773(0,8);1,767(0,9);1,761(0,7);1,286(0,4);1,273(0,5);0,146(0,4);0,080(0,8);0,000(68,9);-0,009(7,5);-0,149(0,4);-0,383(6,2)
I-A-131	1,28	1,40	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,501(2,5);8,494(2,8);8,488(1,9);8,480(1,7);8,476(1,8);7,831(0,8);7,827(1,0);7,825(1,0);7,821(0,9);7,810(0,9);7,804(1,2);7,800(1,0);7,455(1,4);7,443(1,4);7,434(1,3);7,422(1,2);6,819(3,8);6,355(3,1);5,667(8,2);4,109(0,6);4,096(1,7);4,083(1,7);4,070(0,6);3,544(16,0);3,361(15,8);3,321(18,5);3,176(8,0);3,163(7,7);2,525(0,5);2,507(20,5);2,502(27,6);2,498(20,8);2,003(12,4);0,008(0,5);0,000(14,7);-0,008(0,7)
I-A-132	0,59	0,94	¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,504(2,0);8,500(2,0);8,480(1,5);8,478(1,5);8,473(1,6);8,470(1,5);8,165(0,8);8,160(0,8);7,842(0,9);7,839(1,0);7,838(1,0);7,835(0,9);7,828(1,0);7,826(1,1);7,824(1,1);7,822(0,9);7,449(1,1);7,448(1,1);7,441(1,1);7,440(1,1);7,436(1,1);7,435(1,0);7,428(1,0);7,427(1,0);6,218(2,3);3,710(0,6);3,699(16,0);3,694(9,2);3,361(14,9);3,315(18,1);3,173(0,5);3,164(0,5);2,578(0,4);2,572(0,6);2,566(0,9);2,560(0,9);2,554(0,6);2,548(0,4);2,507(6,8);2,504(14,0);2,501(18,8);2,498(13,9);2,495(6,6);0,596(0,6);0,587(1,8);0,584(2,3);0,576(2,3);0,572(1,9);0,564(0,7);0,337(0,7);0,329(2,0);0,325(2,1);0,322(1,9);0,319(2,0);0,311(0,6);0,000(0,5)
I-A-133	1,06	1,22	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,464(0,9);8,425(0,4);7,897(0,4);7,719(0,6);7,701(0,9);7,385(0,6);6,340(1,0);6,245(0,7);3,982(0,4);3,843(2,2);3,739(10,6);3,640(4,0);3,625(4,7);3,610(0,7);3,567(9,3);3,389(8,2);3,380(4,0);2,308(16,0);1,964(1,1);1,952(13,8);1,946(25,4);1,940(34,5);1,933(24,6);1,927(13,0);1,849(0,5);1,832(0,4);1,774(0,5);1,768(0,5);1,762(0,5);1,756(0,5);1,305(15,6);0,146(0,3);0,008(3,6);0,000(78,1);-0,150(0,4)
I-A-134	1,27	1,56	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,438(1,2);8,434(1,2);8,426(1,3);8,422(1,5);8,419(1,7);8,412(1,6);7,685(0,7);7,681(0,8);7,679(0,8);7,675(0,7);7,665(0,8);7,661(0,9);7,658(0,9);7,654(0,8);7,559(1,2);7,539(1,3);7,434(1,0);7,414(1,4);7,357(0,9);7,356(0,9);7,345(0,9);7,344(0,9);7,337(0,9);7,335(0,8);7,325(0,8);7,324(0,8);7,307(0,6);7,305(0,7);7,289(1,2);7,287(1,3);7,269(0,9);7,266(0,8);7,243(1,0);7,240(1,0);7,222(1,2);7,220(

10

20

30

40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
			1,0);7,205(0,5);7,202(0,5);6,392(1,8);5,447(3,0);3,85 5(15,7);3,764(16,0);3,404(15,8);3,388(0,4);2,184(70, 5);1,972(0,9);1,964(0,6);1,958(1,2);1,952(7,8);1,946(14,5);1,940(19,8);1,934(13,5);1,927(6,9);1,269(0,5);1 ,204(0,5);0,008(0,5);0,000(16,6);-0,009(0,6)
I-A-135	0,62	0,89	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,470(0,5);8,407 (0,5);7,699(0,6);7,696(0,7);7,693(0,7);7,690(0,6);7,67 9(0,7);7,675(0,8);7,673(0,8);7,669(0,7);7,386(0,6);7,3 74(0,6);7,366(0,5);7,354(0,5);6,435(1,1);5,447(1,5);3, 880(15,2);3,847(0,7);3,411(15,1);2,649(0,7);2,436(16 ,0);2,163(23,5);1,964(0,4);1,958(0,7);1,952(4,6);1,94 6(8,5);1,940(11,8);1,934(8,1);1,928(4,1);0,008(0,5);0, 000(13,5);-0,009(0,5)
I-A-136			¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,637(1,7);8,635 (1,6);8,473(0,8);8,463(0,8);8,440(0,9);8,158(1,4);7,71 8(0,6);7,714(0,7);7,711(0,7);7,708(0,6);7,697(0,7);7,6 94(0,9);7,691(0,9);7,687(0,8);7,395(0,7);7,383(0,8);7, 374(0,8);7,363(0,7);6,481(0,5);6,222(0,5);5,447(5,0); 3,849(15,1);3,808(14,9);3,763(3,8);3,427(16,0);3,388 (3,9);2,171(32,3);1,965(0,5);1,959(1,0);1,953(6,7);1,9 47(12,4);1,940(17,2);1,934(11,7);1,928(5,9);0,008(0, 6);0,000(18,6);-0,009(0,6)
I-A-137	1,41	1,46	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,453(0,6);8,442 (0,7);8,396(0,8);7,673(0,7);7,670(0,8);7,667(0,7);7,66 3(0,6);7,653(0,7);7,649(0,8);7,647(0,8);7,643(0,7);7,3 56(0,8);7,345(0,7);7,336(0,7);7,324(0,6);6,357(1,3);5, 446(4,8);4,263(0,7);4,245(2,2);4,227(2,2);4,208(0,7); 3,926(16,0);3,756(1,9);3,393(15,7);3,388(2,5);2,142(12,3);1,963(0,5);1,957(1,0);1,952(5,6);1,945(10,4);1, 939(14,4);1,933(9,9);1,927(5,0);1,295(2,7);1,277(5,6) ;1,259(2,7);0,000(0,6)
I-A-138	1,12	1,26	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,455(0,9);8,444 (0,9);8,395(1,1);7,676(0,7);7,672(0,9);7,670(0,9);7,66 6(0,7);7,656(0,8);7,652(1,0);7,650(1,0);7,646(0,8);7,3 62(0,9);7,350(1,0);7,341(0,9);7,330(0,8);6,339(1,8);5, 446(3,6);3,902(16,0);3,733(10,1);3,390(16,0);3,021(0 ,3);2,141(17,9);1,963(0,5);1,957(1,0);1,951(5,7);1,94 5(10,6);1,939(14,5);1,933(10,1);1,927(5,1);0,000(0,5)
I-A-139	0,87	1,00	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,452(1,2);8,441 (1,2);8,395(1,6);8,390(1,5);7,673(0,8);7,668(1,0);7,66 4(0,8);7,652(0,9);7,647(1,2);7,643(0,9);7,359(1,1);7,3 47(1,1);7,339(1,0);7,327(1,0);7,103(1,3);6,973(2,7);6, 843(1,3);6,321(2,2);5,447(4,0);4,103(0,7);3,923(0,7); 3,894(16,0);3,718(13,2);3,388(15,8);3,021(1,7);2,162 (23,5);1,964(0,7);1,958(1,7);1,952(8,0);1,946(14,1);1, 940(18,8);1,934(12,8);1,928(6,4);1,271(0,4);0,882(0, 6)
I-A-140	1,92	1,96	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,482(0,9);8,473 (0,9);8,470(0,9);8,411(1,1);8,406(1,0);7,931(0,4);7,92 4(2,0);7,920(2,1);7,916(1,0);7,915(1,0);7,910(0,9);7,9 04(2,0);7,900(2,2);7,727(0,8);7,723(0,9);7,720(0,8);7, 716(0,8);7,706(0,9);7,703(0,9);7,700(0,9);7,696(0,8); 7,572(0,4);7,568(0,3);7,554(0,9);7,552(1,0);7,545(0,8)

10

20

30

40

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)
);7,541(1,6);7,536(2,9);7,535(2,8);7,530(1,6);7,524(0,9);7,520(1,3);7,516(2,2);7,509(0,4);7,505(0,5);7,501(0,7);7,494(0,5);7,394(0,8);7,392(0,9);7,382(0,9);7,380(0,9);7,372(0,8);7,361(0,7);7,360(0,7);6,530(1,6);5,447(2,7);3,886(16,0);3,870(0,7);3,425(15,8);3,410(0,7);2,156(9,3);1,964(1,3);1,958(1,9);1,952(7,0);1,946(11,8);1,940(15,9);1,934(11,1);1,927(6,1);0,000(2,5)
I-A-141	1,39	1,84	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,438(1,4);8,390(1,2);7,687(0,4);7,666(1,4);7,646(1,3);7,489(2,5);7,472(2,0);7,393(3,4);7,353(1,3);7,344(1,4);5,446(5,4);4,057(0,4);3,861(2,4);3,805(2,7);3,763(0,5);3,602(2,4);3,433(0,5);3,387(16,0);2,156(30,0);1,963(0,8);1,951(8,5);1,945(15,3);1,939(20,4);1,933(14,6);1,927(7,7);1,269(0,7);0,823(0,3);0,000(1,9) 10
I-A-142	1,31	1,47	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,464(1,0);8,454(1,0);8,405(1,3);8,399(1,2);7,688(0,8);7,684(0,9);7,682(0,9);7,678(0,8);7,668(0,8);7,664(0,9);7,662(0,9);7,658(0,8);7,375(1,0);7,363(1,0);7,355(0,9);7,343(0,8);6,391(1,3);5,447(6,3);3,845(16,0);3,763(0,3);3,405(16,0);3,388(0,5);2,174(22,0);1,983(7,9);1,982(8,1);1,964(0,7);1,958(1,1);1,952(4,0);1,946(6,8);1,940(9,0);1,934(6,0);1,928(3,0);1,270(0,4);0,000(0,5) 20
I-A-143	1,12	1,27	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,450(1,0);8,447(1,0);8,438(1,0);8,435(1,0);8,392(1,3);8,386(1,3);7,666(0,7);7,662(0,8);7,660(0,8);7,656(0,6);7,646(0,8);7,642(0,9);7,639(0,9);7,636(0,7);7,611(0,7);7,358(0,9);7,347(0,9);7,338(0,8);7,326(0,7);6,325(0,5);5,447(5,2);3,863(10,4);3,830(8,8);3,810(0,5);3,799(16,0);3,763(0,8);3,386(15,7);2,164(26,8);1,964(0,6);1,958(1,2);1,952(6,7);1,946(12,4);1,940(17,0);1,934(11,6);1,928(5,8);1,270(0,4);0,000(1,5) 30
I-A-144		0,86	¹ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN): δ= 8,447(1,4);8,443(1,5);8,435(1,4);8,432(1,5);8,386(2,0);8,379(2,0);7,659(0,7);7,655(0,9);7,650(0,8);7,639(0,8);7,634(1,0);7,630(0,8);7,351(1,1);7,339(1,1);7,331(1,0);7,319(1,0);7,129(2,9);6,962(2,8);6,259(2,8);5,447(4,1);3,853(16,0);3,806(1,4);3,647(15,2);3,386(1,9);3,375(15,7);2,170(4,9);1,964(0,5);1,958(1,0);1,952(4,8);1,946(8,7);1,939(11,8);1,933(8,3);1,927(4,3);0,000(1,0) 40
I-A-145	0,31	0,85	¹ H-NMR(600,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,587(5,5);8,585(5,8);8,580(6,0);8,577(6,0);8,571(7,7);8,568(7,8);7,894(3,4);7,891(4,0);7,890(3,9);7,887(3,5);7,880(3,8);7,878(4,2);7,876(4,3);7,874(3,7);7,5254(4,5);7,5245(4,4);7,5174(4,5);7,5166(4,4);7,512(4,4);7,511(4,4);7,504(4,2);7,503(4,1);5,718(5,0);4,449(8,6);4,437(15,3);4,424(9,6);3,948(10,1);3,935(16,0);3,923(9,0);3,790(0,4);3,686(0,5);3,494(0,5);3,459(0,6);3,450(0,7);3,370(4,4);3,346(7,9);3,335(73,5);3,216(0,6);2,794(0,4);2,787(0,4);2,720(2,5);2,614(0,5);2,611(0,3);2,523(0,7);2,520(0,9);2,517(0,8);2,508(23,1);2,505(50,2);2,502(69,7);2,499(51,5);2,496(25,3);2,389(0,3);2,386(0,5);2,383(0,3);1,194(0,4);1,182(0,7);1,170(0,4);0,000(2,5) 40
I-A-146	1,11	1,27	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,632(15,5);8,

Ex. No.	logP[a]	logP[b]	1H-NMR ;δ (ppm)	
			620(16,0);8,505(3,7);8,502(4,1);8,493(4,1);8,490(4,6);8,485(5,6);8,479(5,4);8,313(0,5);7,842(1,9);7,838(2,3);7,835(2,3);7,831(2,1);7,821(2,2);7,817(2,5);7,815(2,7);7,811(2,2);7,492(2,9);7,480(2,9);7,471(2,7);7,459(2,6);7,329(4,1);7,317(7,8);7,304(4,0);6,535(4,3);5,754(1,0);4,306(1,7);4,288(5,9);4,271(6,0);4,253(1,8);3,417(36,1);3,317(141,0);2,675(1,1);2,670(1,4);2,666(1,0);2,524(3,5);2,510(74,8);2,506(159,0);2,501(224,8);2,497(171,3);2,492(84,5);2,333(0,9);2,328(1,3);2,324(1,0);1,310(6,5);1,292(14,9);1,274(6,4);0,146(0,6);0,08(4,5);0,000(133,6);-0,008(5,1);-0,150(0,6)	10

【0345】

生物学的実施例サツマイモネコブセンチュウ (Meloiodogyne incognita) 試験

溶媒： 125.0 重量部のアセトン

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で稀釈して所望の濃度とする。

【0346】

容器に、砂、活性化合物溶液、サツマイモネコブセンチュウ (Meloiodogyne incognita) の卵 / 幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根では、こぶが形成される。

【0347】

14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力 (%) を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し、0%は、処理された植物におけるこぶの数が処理されていない対照におけるこぶの数に相当することを意味する。

【0348】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 ppm の施用量で、90% の効力を示す： I-A-7；I-A-35。

【0349】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒： 7.8 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppm の濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0350】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (Myzus persicae) が発生しているハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0351】

5又は6日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0352】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、100% の効力を示す： I-A-1、I-A-2、I-A-3、I-A-8、I-A-10、I-A-11、I-A-18、I-A-19、I-A-21、I-A-22、I-A-26、I-A-37、I-A-40、I-A-45、I-A-46、I-A-47

20

30

40

50

、 I - A - 48、 I - A - 49、 I - A - 50、 I - A - 51、 I - A - 52、 I - A - 53、 I - A - 54、 I - A - 65、 I - A - 68、 I - A - 69、 I - A - 70、 I - A - 71、 I - A - 94、 I - A - 95、 I - A - 96、 I - A - 101、 I - A - 102、 I - A - 103、 I - A - 104、 I - A - 105、 I - A - 106、 I - A - 108、 I - A - 110、 I - A - 112、 I - A - 116、 I - A - 122、 I - A - 126、 I - A - 134、 I - A - 135、 I - A - 136、 I - A - 138、 I - A - 139、 I - A - 140、 I - A - 141、 I - A - 144、 I - A - 145、 I - B - 1。

【0353】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： I - A - 5、 I - A - 6、 I - A - 7、 I - A - 12、 I - A - 14、 I - A - 16、 I - A - 23、 I - A - 24、 I - A - 25、 I - A - 27、 I - A - 28、 I - A - 30、 I - A - 31、 I - A - 36、 I - A - 38、 I - A - 39、 I - A - 41、 I - A - 55、 I - A - 58、 I - A - 59、 I - A - 60、 I - A - 61、 I - A - 62、 I - A - 64、 I - A - 67、 I - A - 73、 I - A - 74、 I - A - 75、 I - A - 77、 I - A - 79、 I - A - 82、 I - A - 83、 I - A - 84、 I - A - 86、 I - A - 87、 I - A - 97、 I - A - 98、 I - A - 100、 I - A - 107、 I - A - 109、 I - A - 113、 I - A - 117、 I - A - 119、 I - A - 120、 I - A - 123、 I - A - 124、 I - A - 125、 I - A - 127、 I - A - 128、 I - A - 130、 I - A - 131、 I - A - 132、 I - A - 137、 I - A - 142。

【0354】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： I - A - 78、 I - A - 146。

【0355】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： I - A - 9。

【0356】

ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験 ; OP - 抵抗性

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppm の濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0357】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0358】

6 日間経過した後、効力 (%) を求める。100 % は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0 % は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0359】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： I - A - 6、 I - A - 78、 I - A - 105。

【0360】

マスタードビートル (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

10

20

30

40

50

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0361】

ハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (*mustard beetles*) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫を寄生させる。

【0362】

7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

【0363】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / haの施用量で、100%の効力を示す： I-A-79、I-A-80。

【0364】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / haの施用量で、83%の効力を示す： I-A-15。

【0365】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験

溶媒： 14重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、1000 ppmの濃度で当該配合物溶液に添加する。

【0366】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生しているピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性化合物調製物を噴霧することによって処理する。

【0367】

6日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0368】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、99%の効力を示す： I-A-66。

【0369】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-A-44、I-A-99。

【0370】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 ppmの施用量で、99%の効力を示す： I-A-4、I-A-20、I-A-57、I-A-89。

【0371】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 ppmの施用量で、95%の効力を示す： I-A-93。

【0372】

対照実施例

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験 (MYZUPE)

10

20

30

40

50

溶媒 : 78 . 0 重量部のアセトン
1 . 5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0373】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。 10

【0374】

所望の期間が経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0375】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術と比較して優れた効力を示す： 表を参照されたい。

【0376】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験 ; OP - 抵抗性 (TETRUR)

溶媒 : 78 . 0 重量部のアセトン
1 . 5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。 20

【0377】

全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が発生しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。 30

【0378】

所望の期間が経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0379】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術と比較して優れた効力を示す： 表を参照されたい。

【0380】

マスタードビートル (*Phaedon cochleariae*) - 噴霧試験 (PHACE)

溶媒 : 78 . 0 重量部のアセトン
1 . 5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。 40

【0381】

50

ハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (*mustard beetle*) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫を寄生させる。

【0382】

所望の期間が経過した後、効力 (%) を求める。100% は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し、0% は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

【0383】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術と比較して優れた効力を示す： 表を参照されたい。

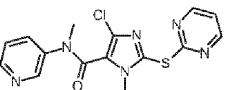
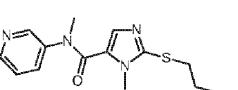
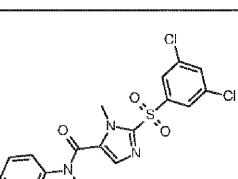
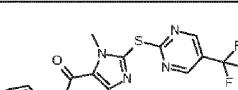
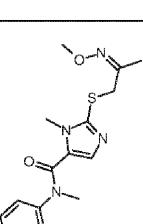
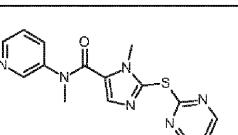
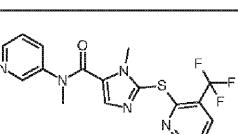
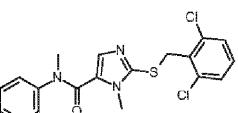
10

【表3】

物質	構造	動物種	濃度	効力 (%) [dat:処理後日数]
Ex. No. 13 従来技術 WO2011/009804		PHAEKO TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 500 g ai/ha 100 g ai/ha	0 7 dat 0 6 dat 0 6 dat
Ex. No. 14 従来技術 WO2011/009804		PHAEKO TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 500 g ai/ha 100 g ai/ha	0 7 dat 0 6 dat 0 6 dat
Ex. No. I-A-79 本発明		PHAEKO	500 g ai/ha	100 7 dat
Ex. No. I-A-80 本発明		PHAEKO	500 g ai/ha	100 7 dat

20

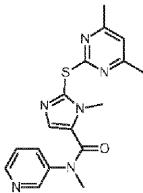
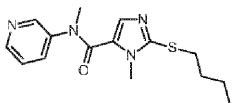
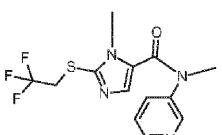
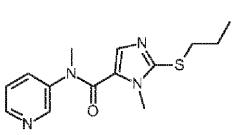
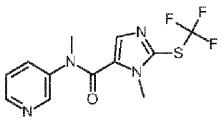
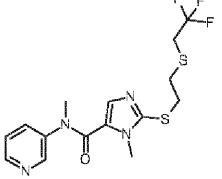
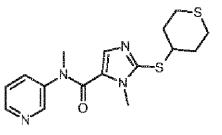
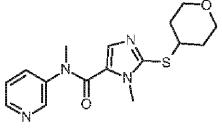
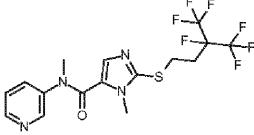
30

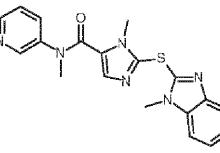
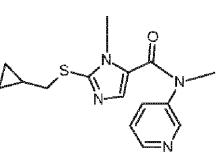
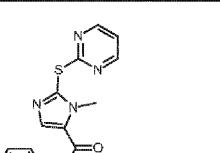
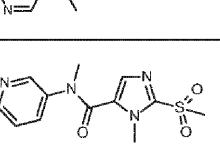
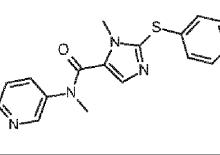
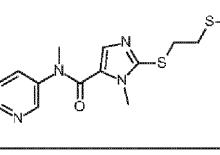
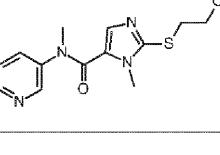
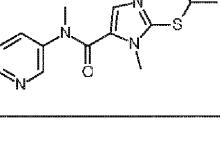
Ex. No. I-A-15 本発明		PHAEKO	500 g ai/ha	83 7 dat
Ex. No. I-A-6 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 6 dat 90 6 dat
Ex. No. I-A-78 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 6 dat 90 6 dat
Ex. No. I-A-105 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	90 6 dat 100 6 dat
Ex. No. I-A-39 本発明		TETRUR	500 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-107 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 6 dat 90 6 dat
Ex. No. I-A-110 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 6 dat 100 6 dat
Ex. No. I-A-125 本発明		TETRUR MYZUPE	500 g ai/ha 100 g ai/ha	70 6 dat 70 6 dat

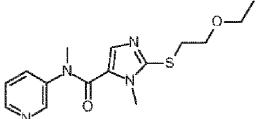
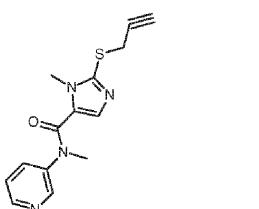
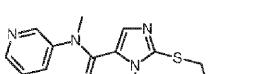
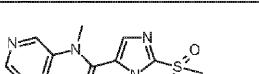
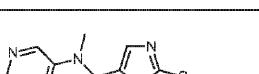
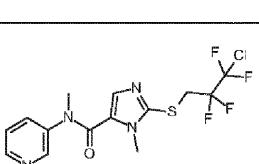
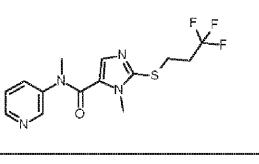
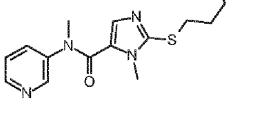
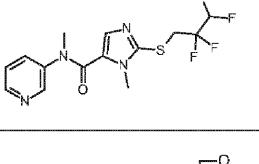
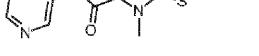
10

20

30

Ex. No. I-A-1 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-5 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-10 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-21 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-37 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-50 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 5 dat
Ex. No. I-A-51 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 5 dat
Ex. No. I-A-52 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 5 dat
Ex. No. I-A-53 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 5 dat

Ex. No. I-A-65 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
Ex. No. I-A-134 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 5 dat
Ex. No. I-A-2 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-3 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-8 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-11 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-14 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-18 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-19 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat

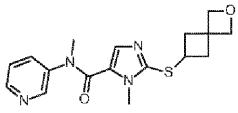
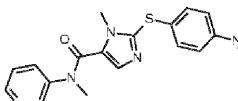
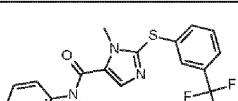
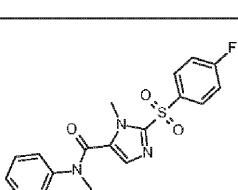
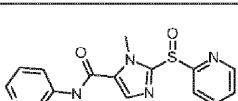
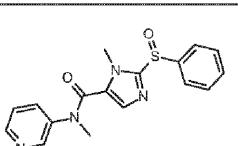
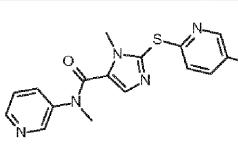
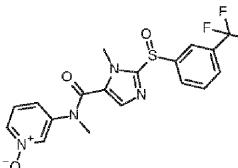
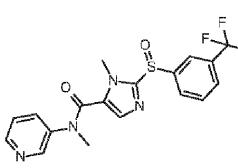
Ex. No. I-A-22 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-30 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-36 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-40 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-45 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-46 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-47 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-48 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-49 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-54 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat

10

20

30

40

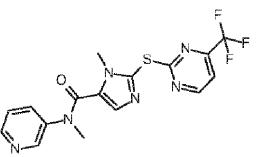
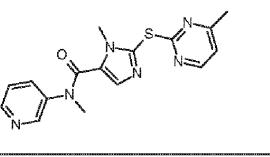
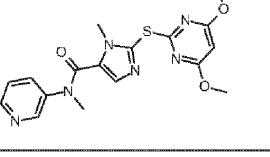
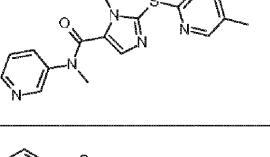
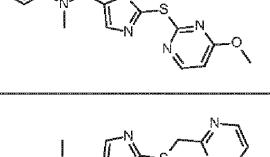
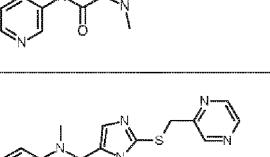
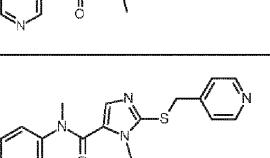
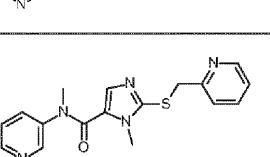
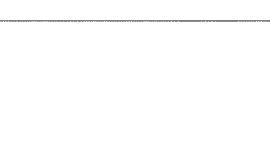
Ex. No. I-A-55 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-59 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-61 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-82 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-86 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-87 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-94 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-95 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-96 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat

10

20

30

40

Ex. No. I-A-100 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-101 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-102 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-104 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-106 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-112 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-113 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-116 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-117 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat

10

20

30

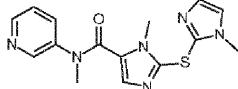
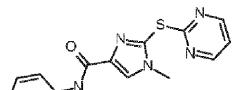
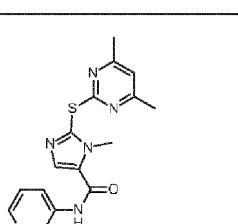
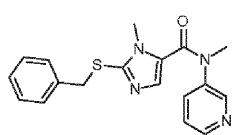
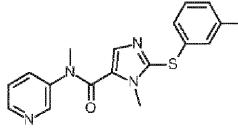
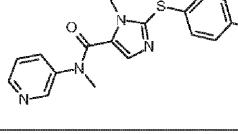
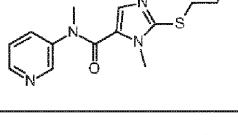
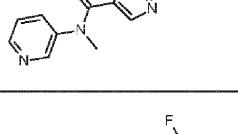
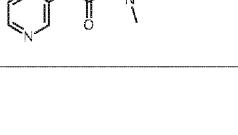
Ex. No. I-A-122 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-128 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
Ex. No. I-A-130 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-135 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-136 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-137 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-138 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-139 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat
Ex. No. I-A-142 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat

10

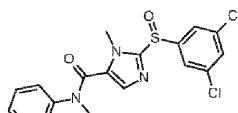
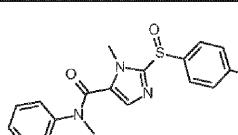
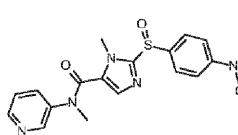
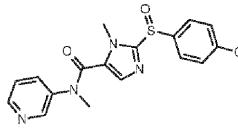
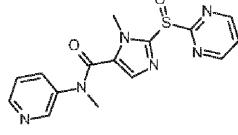
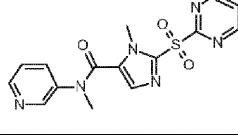
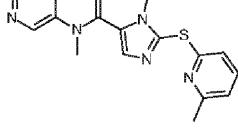
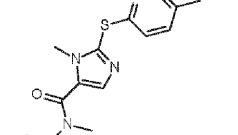
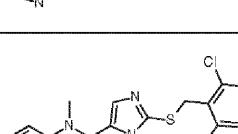
20

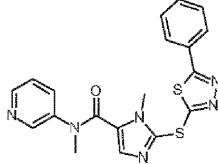
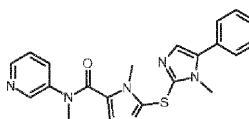
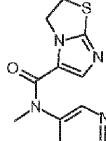
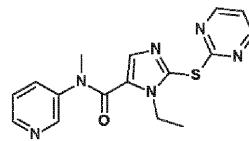
30

40

Ex. No. I-A-144 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat	
Ex. No. I-B-1 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat	
Ex. No. I-A-4 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	10
Ex. No. I-A-7 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-9 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	20
Ex. No. I-A-12 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-26 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	30
Ex. No. I-A-27 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-38 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	40

Ex. No. I-A-43 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-56 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-58 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-60 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-62 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-64 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-69 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-70 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat
Ex. No. I-A-71 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat

Ex. No. I-A-77 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-84 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	10
Ex. No. I-A-89 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-93 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-97 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	20
Ex. No. I-A-99 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-108 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	30
Ex. No. I-A-109 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	
Ex. No. I-A-126 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 6 dat	40

Ex. No. I-A-140 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 5 dat
Ex. No. I-A-141 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 5 dat
Ex. No. I-A-145 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70 5 dat
Ex. No. I-A-146 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 5 dat

10

20

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 7 A
C 0 7 D 417/14 (2006.01)	C 0 7 D 417/14	
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	C
A 0 1 N 43/50 (2006.01)	A 0 1 N 43/50	N
A 0 1 N 43/82 (2006.01)	A 0 1 N 43/82	
A 0 1 N 43/76 (2006.01)	A 0 1 N 43/76	
A 0 1 N 43/52 (2006.01)	A 0 1 N 43/52	
A 0 1 N 43/824 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	B
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/824	C
	A 0 1 N 43/653	N

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也

(74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文

(72)発明者 フィッシャー,ライナー
ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム、ネリ - ザクス - シュトラーセ・ 2 3

(72)発明者 ハイル,マルクス
ドイツ国、4 2 7 9 9 ・ライヒリンゲン、アム・ヴァイセン・シュタイン・ 4 3 ア-

(72)発明者 ヤンセン,ヨハンнес - ルドルフ
ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム、クニプラーターシュトラーセ・ 4 7

(72)発明者 キューブラー,ズザンネ
ドイツ国、4 0 5 8 9 ・デュッセルドルフ、パストーア - デル - リング・ 5 2

(72)発明者 ヴィルケ,ダーヴィト

ドイツ国、40219・デュッセルドルフ、フリーデンシュトラーセ・39
 (72)発明者 コーラー,アドリース
 ドイツ国、40764・ランゲンフェルト、ハイムヘンヴェーク・9
 (72)発明者 ウィロー,マテュー
 ドイツ国、40215・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラーセ・15
 (72)発明者 アイルムース,サッシャ
 ドイツ国、42799・ライヒリンゲン、ノイエンカンプ・9アー
 (72)発明者 イルク,ケルシュテイン
 ドイツ国、50670・ケルン、ノイッサー・バール・32
 (72)発明者 マルサム,オルガ
 ドイツ国、51503・レスラート、フォア・デム・クロスターホーフ・19
 (72)発明者 レーセル,ペーター
 ドイツ国、51371・レーバークーゼン、アム・ショッカー・5
 (72)発明者 ポーツ,ダニエラ
 ドイツ国、52391・フェットヴァイス、オストシュトラーセ・1
 (72)発明者 アンデルシュ,ヴォルフラム
 ドイツ国、51469・ベルギッシュ・グラートバハ、シュロダーディヒャー・ヴェーク・77

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 特開平01-146820(JP,A)
 特表2013-500246(JP,A)
 国際公開第2014/063942(WO,A1)
 特表2014-500282(JP,A)
 国際公開第2010/112177(WO,A1)
 ソ連国特許発明第00725566(SU,A)
 Norris, D. et al., Synthesis of imidazo[1,5-a]quinoxalin-4(5H)-one template via a novel intramolecular cyclization process, Tetrahedron Letters, 2001年, 42(26), pp. 4297-4299

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D
 A01N
 A61K
 C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)