

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2009-514823

(P2009-514823A)

(43) 公表日 平成21年4月9日(2009.4.9)

(51) Int.Cl.	F 1	テーマコード (参考)
C07D 209/12 (2006.01)	C07D 209/12	C S P 4C063
AO1N 43/38 (2006.01)	AO1N 43/38	4C086
AO1N 47/12 (2006.01)	AO1N 47/12	Z 4C204
C07F 7/18 (2006.01)	C07F 7/18	T 4H011
AO1N 43/84 (2006.01)	AO1N 43/84	1 O 1 4H049

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 101 頁) 最終頁に続く

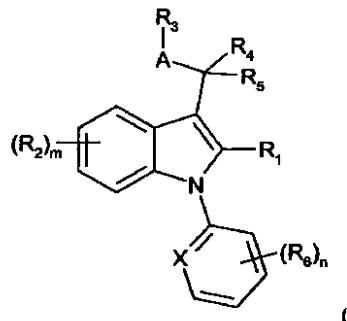
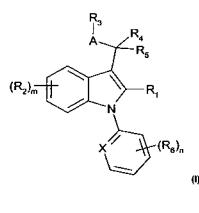
(21) 出願番号	特願2008-538302 (P2008-538302)	(71) 出願人	597011463 ノバルティス アクチエンゲゼルシャフト スイス国、4056 バーゼル、リヒトシ ュトラーセ 35
(86) (22) 出願日	平成18年11月2日 (2006.11.2)	(74) 代理人	100062007 弁理士 川口 義雄
(85) 翻訳文提出日	平成20年6月26日 (2008.6.26)	(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(86) 國際出願番号	PCT/EP2006/010518	(74) 代理人	100140523 弁理士 渡邊 千尋
(87) 國際公開番号	W02007/051619	(74) 代理人	100119253 弁理士 金山 賢教
(87) 國際公開日	平成19年5月10日 (2007.5.10)	(74) 代理人	100103920 弁理士 大崎 勝真
(31) 優先権主張番号	05023947.4		
(32) 優先日	平成17年11月3日 (2005.11.3)		
(33) 優先権主張國	歐州特許庁 (EP)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】殺虫剤としてのN-(ヘテロ)アリールインドール誘導体

(57) 【要約】

本発明は、一般式 (I)



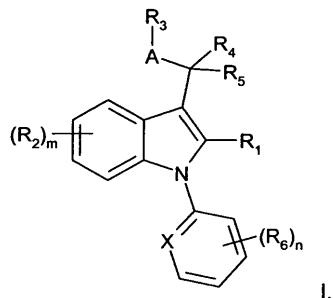
の化合物 (式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、A、X、m及びnは、請求項1に記載の意味を有する。)、及び場合によってはその鏡像異性体に関する。これらの活性成分は、有利な殺虫性を有する。これらの活性成分は、温血動物及び植物に付いた寄生生物の防除に特に適切である。

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式の化合物。

【化 1】



10

(式中、

R_1 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、非置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、(ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、アミノ、N-モノ-若しくはN,N-ジ- $C_1 - C_4$ - アルキルアミノ、N-ベンジルアミノ又はN-ピリジルメチルアミノで置換された) $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ- $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルキニル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、ハロ- $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、SH、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ- $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ- $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ- $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 $NHCOR_7$ 、 $NHOOR_7$ 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、 $C_1 - C_4$ - アルキル-シリル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換アリールアルキルチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールアルキルオキシ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ- $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R₂ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシル - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ -

20

30

40

50

C_6 - アルキルチオ、ハロ - C_3 - C_6 - シクロアルキルチオ、 C_1 - C_6 - アルキルスルフィニル、 C_3 - C_6 - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキルスルフィニル、ハロ - C_3 - C_6 - シクロアルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 - アルキルスルホニル、 C_3 - C_6 - シクロアルキルスルホニル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキルスルホニル、ハロ - C_3 - C_6 - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールアルキルオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールチオ置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 - アルキル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキル、 C_1 - C_6 - アルコキシ、ハロ - C_1 - C_6 - アルコキシ、 NH_2 、 C_1 - C_6 - アルキルアミノ、ジ - C_1 - C_6 - アルキルアミノ、 C_1 - C_6 - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、それによって、 m が 1 よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、異なっていてもよく、又は 2 個の R_2 基はこれらが結合している環原子と一緒に、(窒素、硫黄若しくは酸素からなる群から選択される 1 若しくは 2 個の追加のヘテロ原子、又は 1 個のカルボニル基を含んでいてもよく、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 - アルキル及び C_1 - C_6 - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される 1 から 4 個の置換基で置換されていてもよい) 5 から 6 原子の脂肪族環を形成し、

R_3 は、水素、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_3 - C_6 - シクロアルキル、 C_1 - C_6 - シクロアルキルメチル、 C_1 - C_4 - アルコキシメチル、 C_1 - C_2 - アルコキシ - C_1 - C_2 - アルコキシメチル、非置換フェノキシメチル、フェニル部分においてハロゲン、 C_1 - C_2 - アルキル、ハロ - C_1 - C_2 - アルキル又は C_1 - C_2 - アルコキシで置換されたフェノキシメチル、ベンジルオキシメチル、 C_2 - C_6 - アルケニル、 C_2 - C_6 - アルキニル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキル、ハロ - C_3 - C_6 - シクロアルキル、ハロ - C_1 - C_6 - シクロアルキルメチル、ハロ - C_2 - C_6 - アルケニル、ハロ - C_2 - C_6 - アルキニル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、 $CSNR_7R_8$ 、 C_1 - C_4 - アルキル - シリル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 - アルキル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキル、 C_1 - C_6 - アルコキシ、ハロ - C_1 - C_6 - アルコキシ、 NH_2 、 C_1 - C_6 - アルキルアミノ、ジ - C_1 - C_6 - アルキルアミノ、 C_1 - C_6 - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_4 は、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_2 - C_6 - アルケニル、 C_2 - C_6 - アルキニル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキル、ハロ - C_2 - C_6 - アルケニル、ハロ - C_2 - C_6 - アルキニル、 C_3 - C_8 - シクロアルキル、ハロ - C_3 - C_8 - シクロアルキル、ヒドロキシ - C_1 - C_6 - アルキル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 - アルキル、ハロ - C_1 - C_6 - アルキル、 C_1 - C_6 - アルコキシ、ハロ - C_1 - C_6 - アルコキシ、 NH_2 、 C_1 - C_6 - アルキルアミノ、ジ - C_1 - C_6 - アルキルアミノ、 C_1 - C_6 - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_5 は、水素、 C_1 - C_8 - アルキル、 C_2 - C_6 - アルケニル、 C_2 - C_6 - アルキニル、

10

20

30

40

50

ニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、フェニル C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルキルチオメチル、ヒドロキシメチル、C₁ - C₄ - アルコキシメチル、N 原子が非置換であるアミノメチル、N 原子が C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル - 若しくはハロ - C₁ - C₂ - アルコキシ - 置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン - 、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル - 若しくはハロ - C₁ - C₂ - アルコキシ - 置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、ハロ - C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₅ - C₆ - シクロアルキルメチル（式中、シクロアルキルの 1 から 3 個の炭素原子は、NH、N(C₁ - C₄ - アルキル)、O 及び S からなる群から選択されるヘテロ原子で置換されていてよい。）、シアノ、COR₇、COOR₇、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇ 及び CONR₇R₈ からなる群から互いに独立に選択され、

又は R₄ と R₅ は、これらが結合している炭素原子と一緒に、（窒素、硫黄若しくは酸素からなる群から選択される追加の 1 個のヘテロ原子、又は 1 個のカルボニル基を含んでいてもよく、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル及び C₁ - C₆ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される 1 から 4 個の置換基で置換されていてよい）3 から 6 原子の脂肪族環を形成し、

R₆ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、SO₃R₇、SO₂NR₇R₈、NR₇R₈、COR₇、COOR₇、CONR₇R₈、SF₅、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールチオ置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇ 及び CONR₇R₈ からなる群から互いに独立に選択され、それによって、n が幾つであっても、R₆ は同一でも、異なっていてもよく、

R₇ 及び R₈ は互いに独立に、水素、非置換若しくは置換 C₁ - C₆ - アルキル、非置換若しくは置換 C₁ - C₂ - アルコキシ C₁ - C₂ - アルキル、非置換若しくは置換 C₂

10

20

30

40

50

- C₆ - アルケニル、非置換若しくは置換 C₂ - C₆ - アルキニル、非置換若しくは置換 C₃ - C₆ - シクロアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、NO₂、C₁ - C₆ - アルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ及びアルコキシカルボニルからなる群から互いに独立に選択される。）；非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル（アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇ 及びCONR₇R₈ からなる群から互いに独立に選択される。）であり、
10

A は O、S、SO 又は SO₂ であり、

X は C 又は N であり、

m は 0、1、2、3 又は 4 であり、

n は 1、2、3、4 又は 5 であって、

ただし、X が C である場合には、n は 1 よりも大きい。）

【請求項 2】

R₁ が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、SO₃R₇、SO₂NR₇R₈、NR₇R₈、NHCOR₇、NHCOOR₇、COR₇、COOR₇、CONR₇R₈、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換アリールアルキルチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇ 及びCONR₇R₈ からなる群から互いに独立に選択され、
20

R₂ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、
30

50

アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 C 10 ONR_7R_8 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び C 20 ONR_7R_8 からなる群から互いに独立に選択され、それによって、 m が 1 よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、異なっていてもよく、

R_3 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - シクロアルキルメチル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - シクロアルキルメチル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、 $CNSNR_7R_8$ 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_4 が、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ハロ - $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ヒドロキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

又は、 R_3 と R_4 が、これらが結合している酸素及び炭素原子と一緒に、(窒素、硫黄若しくは酸素の追加の 1 個の原子、又は 1 個のカルボニル基を含んでいてもよく、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル及び $C_1 - C_6$ - アルコキシからなる群から選択される 1 から 4 個の置換基で置換されていてもよい) 3 から 6 原子の環を形成し、

R_5 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ハロ - $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアル

10

20

30

40

50

キル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、SO₃R₇、SO₂NR₇R₈、NR₇R₈、COR₇、COOR₇、CONR₇R₈、SF₅、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇及びCONR₇R₈からなる群から互いに独立に選択され、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

R₇及びR₈が互いに独立に、水素、非置換若しくは置換C₁ - C₆ - アルキル、非置換若しくは置換C₂ - C₆ - アルケニル、非置換若しくは置換C₂ - C₆ - アルキニル、非置換若しくは置換C₃ - C₆ - シクロアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、NO₂、C₁ - C₆ - アルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ及びアルコキシカルボニルからなる群から互いに独立に選択される。）、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、NH₂、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆ - アルキルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇及びCONR₇R₈からなる群から互いに独立に選択される。）であり、

AがO、S、SO又はSO₂であり、

XがC又はNであり、

mが0、1、2、3又は4であり、

nが1、2、3、4又は5であって、

ただし、XがCである場合には、nは1よりも大きい、

請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項3】

R₁が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₆ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される、請求項1又は2に記載の式Iの化合物。

【請求項4】

R₁が、水素、非置換C₁ - C₄ - アルキル、（ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルチオ、N - モノ - 若しくはN,N - ジ - C

10

20

30

40

50

$C_1 - C_2 -$ アルキルアミノ又は $N -$ ピリジルメチルアミノ - で置換された $) C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_2 - C_4 -$ アルケニル、 $C_2 - C_4 -$ アルキニル、 $C_1 - C_4 -$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシカルボニル、 非置換フェニル、 非置換フェニルチオ、 (ハロゲンニトロ、 シアノ、 $C_1 - C_4 -$ アルキル、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシ又はハロ - $C_1 - C_4 -$ アルコキシで各々置換された) フェニル及びフェニルチオ、 並びにナフチルである、 請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

R_1 が、 水素、 非置換 $C_1 - C_2 -$ アルキル、 ヒドロキシル若しくは $C_1 - C_2 -$ アルコキシで置換された $C_1 - C_2 -$ アルキル、 $C_1 - C_2 -$ アルコキシカルボニル、 非置換フェニル、 ハロゲン置換フェニル、 フェニルチオ、 又はナフチルである、 請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物。 10

【請求項 6】

R_2 が、 ハロゲン、 ニトロ、 シアノ、 $C_1 - C_4 -$ アルキル、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシ、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルコキシ、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシカルボニル、 又は非置換若しくは置換アリール、 非置換若しくは置換アリールオキシ ($aryoxy$)、 非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、 置換基は、 ハロゲン、 ニトロ、 シアノ、 $C_1 - C_4 -$ アルキル、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシ及びハロ - $C_1 - C_4 -$ アルコキシからなる群から選択され、 それによって、 m が 1 よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、 異なっていてもよい、 請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。 20

【請求項 7】

R_2 が、 ハロゲン、 シアノ、 ニトロ、 $C_1 - C_2 -$ アルキル、 ハロ - $C_1 - C_2 -$ アルキル、 ヒドロキシ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 ヒドロキシ、 $C_1 - C_2 -$ アルコキシ、 ベンジルオキシ、 アミノ、 $N -$ モノ - 若しくは $N, N -$ ジ $C_1 - C_2 -$ アルキルアミノ、 又は $C_1 - C_2 -$ アルコキシカルボニルであり、 又は 2 個の R_2 基が、 これらが結合している炭素原子と一緒にジオキソラン環を形成している、 請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 8】

R_3 が、 水素、 $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_3 - C_4 -$ シクロアルキルメチル、 $C_2 - C_4 -$ アルケニル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシカルボニル、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_4 -$ アルケニルオキシカルボニル、 $C_2 - C_4 -$ アルキニルオキシカルボニル、 ハロ - $C_2 - C_4 -$ アルキニルオキシカルボニル、 チオフェニルカルボニル、 ピペロニルカルボニル、 $C_1 - C_4 -$ アルキルアミノカルボニル、 ジ ($C_1 - C_4 -$ アルキル) アミノカルボニル、 $C_1 - C_4 -$ アルキルアミノチオカルボニル、 ジ ($C_1 - C_4 -$ アルキル) アミノチオカルボニル、 非置換若しくは置換 $C_1 - C_4 -$ アルキルカルボニル (置換基は、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4 -$ アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。) ; 非置換若しくは置換ベンジル、 非置換若しくは置換ベンゾイル、 非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、 又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニル (各場合において、 置換基は、 ハロゲン、 シアノ、 $C_1 - C_4 -$ アルキル、 ハロ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_1 - C_4 -$ アルコキシ及びハロ - $C_1 - C_4 -$ アルコキシからなる群から選択される。) である、 請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。 30 40

【請求項 9】

R_3 が、 水素 ; $C_1 - C_4 -$ アルキル ; $C_3 - C_4 -$ シクロアルキルメチル ; $C_1 - C_2 -$ アルコキシメチル ; $C_1 - C_2 -$ アルコキシ - $C_1 - C_2 -$ アルコキシメチル ; 非置換ベンジル、 又はハロゲン、 ハロ - $C_1 - C_2 -$ アルキル若しくはシアノで置換されたベンジル ; 非置換フェノキシメチル、 非置換ベンジルオキシメチル、 又はフェニル部分においてハロゲンで置換されたフェノキシメチル若しくはベンジルオキシメチル ; カルボキシメトキシメチルカルボニル ; R_7 が $C_1 - C_6 -$ アルキル、 アセチルオキシ - $C_1 - C_4 -$ アルキル、 $C_5 - C_6 -$ シクロアルキル、 非置換フェニル、 (ハロゲン、 ハロ - $C_1 -$ 50

C_2 - アルキル又はシアノで置換された)フェニル、フェニルエチル、チエニル、又はピペロニルである COR_7 基; R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルコキシ、アミノ、又は N - モノ - 若しくは N , N - ジ - $C_1 - C_2$ - アミノである $C(ONHR_7)$ 基; R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、ベンジル、非置換 $C_2 - C_4$ - アルケニル若しくはハロゲン置換 $C_2 - C_4$ - アルケニルである、又は $C_2 - C_4$ - アルキニルである、 $C(O)OR_7$ 基; 又は R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換フェニル若しくは(ハロゲン、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルキルで置換された)フェニルである $C(S)NHR_7$ 基である、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

10

【請求項 10】

R_3 が、水素、メチル、シクロプロピルメチル、2 - プロペニル、メトキシカルボニル、2 - プロペニルオキシカルボニル、ハロ - ビニルオキシカルボニル、プロパルギルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、 $C_1 - C_2$ - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_2$ - アルキルアミノチオカルボニル、メチルカルボニル、ベンジル、ベンゾイル、ベンジルオキシカルボニル又はフェニルアミノカルボニルである、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 11】

R_4 が、非置換 $C_1 - C_4$ - アルキルである、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル若しくは $C_1 - C_4$ - アルコキシで置換された $C_1 - C_4$ - アルキルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

20

【請求項 12】

R_4 がメチル又はトリフルオロメチルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 13】

R_5 が、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ピペロニル、非置換若しくは置換フェニル、又は非置換若しくは置換ベンジルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及びハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

30

【請求項 14】

R_5 が、水素; $C_1 - C_8$ - アルキル; ハロ- $C_1 - C_2$ - アルキル; ヒドロキシメチル; ベンジル; $C_5 - C_6$ - シクロアルキル; $C_2 - C_6$ - アルケニル; $C_2 - C_4$ - アルキニル; フェニル- $C_2 - C_4$ - アルキニル; $C_3 - C_6$ - シクロアルキル- $C_2 - C_4$ - アルキニル; $C_1 - C_2$ - アルキルチオメチル; $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル; N 原子が非置換であるアミノメチル、N 原子が $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ- $C_1 - C_2$ - アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロゲン - 、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ- $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル; N - $C_1 - C_2$ - ピペラジニルメチル; モルホリニルメチル; N - イミダゾールメチル; ピペロニル; 非置換フェニル、又はハロゲン、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_2$ - アルコキシ若しくはハロ- $C_1 - C_2$ - アルキルチオで置換されたフェニル; シアノ; 又は $COOR_7$ 基(式中、 R_7 は水素又は $C_1 - C_2$ - アルキルである。)である、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

40

【請求項 15】

R_5 がメチル、トリフルオロメチル、エテニル又はエチニルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 16】

R_6 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アル

50

キル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ又はハロ - C₁ - C₄ - アルキルチオ、SF₅であり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよい、請求項1から15のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項17】

R₆が、C₁ - C₂ - アルキル、フェニル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CHO、C(O) - C₁ - C₂ - アルキル、C(O)O - C₁ - C₂ - アルキル、N - モノ - 若しくはN, N - ジ - C₁ - C₂ - アルキルアミノ、SF₅又はSO₃Hであり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよい、請求項1から15のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

10

【請求項18】

R₆がハロゲン又はトリフルオロメチルであり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよい、請求項1から15のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項19】

AがOである、請求項1から18のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項20】

Xが、非置換Cである、又はR₆基で置換されたCである、請求項1から19のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

20

【請求項21】

mが0又は1である、請求項1から20のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項22】

nが2又は3である、請求項1から21のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項23】

R₁が、水素、非置換C₁ - C₄ - アルキル、(ハロゲン、シアノ、ヒドロキシリ、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルチオ、N - モノ - 若しくはN, N - ジ - C₁ - C₂ - アルキルアミノ又はN - ピリジルメチルアミノ - で置換された)C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルキルカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、非置換フェニル、非置換フェニルチオ、(ハロゲンニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はハロ - C₁ - C₄ - アルコキシで各々置換された)フェニル及びフェニルチオ、並びにナフチルであり、

30

R₂が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₂ - アルコキシ、ベンジルオキシ、アミノ、N - モノ - 若しくはN, N - ジC₁ - C₂ - アルキルアミノ、又はC₁ - C₂ - アルコキシカルボニルであり、又は2個のR₂基が、これらが結合している炭素原子と一緒にジオキソラン環を形成しており、

R₃が、水素；C₁ - C₄ - アルキル；C₃ - C₄ - シクロアルキルメチル；C₁ - C₂ - アルコキシメチル；C₁ - C₂ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルコキシメチル；非置換ベンジル、又はハロゲン、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル若しくはシアノで置換されたベンジル；非置換フェノキシメチル、非置換ベンジルオキシメチル、又はフェニル部分においてハロゲンで置換されたフェノキシメチル若しくはベンジルオキシメチル；カルボキシメトキシメチルカルボニル；R₇がC₁ - C₆ - アルキル、アセチルオキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₅ - C₆ - シクロアルキル、非置換フェニル、(ハロゲン、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル又はシアノで置換された)フェニル、フェニルエチル、チエニル、又はピペロニルであるCOR₇基；R₇がC₁ - C₆ - アルキル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₂ - アルコキシ、アミノ、又はN - モノ - 若しくはN, N - ジ - C₁ - C₂ - アミノであるCONHR₇基；R₇がC₁ - C₆ - アルキル、ベンジル、非置換C₂ - C₄ - アルケニ

40

50

ル若しくはハロゲン置換 $C_2 - C_4$ - アルケニルである、又は $C_2 - C_4$ - アルキニルである、 $C(O)OR_7$ 基；又は R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換フェニル若しくは（ハロゲン、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルキルで置換された）フェニルである $C(S)NHR_7$ 基であり、

R_4 が、非置換 $C_1 - C_4$ - アルキルであり、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル若しくは $C_1 - C_4$ - アルコキシで置換された $C_1 - C_4$ - アルキルであり、

R_5 が、水素； $C_1 - C_8$ - アルキル；ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル；ヒドロキシメチル；ベンジル； $C_5 - C_6$ - シクロアルキル； $C_2 - C_6$ - アルケニル； $C_2 - C_4$ - アルキニル；フェニル - $C_2 - C_4$ - アルキニル； $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_2 - C_4$ - アルキニル； $C_1 - C_2$ - アルキルチオメチル； $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル；N 原子が非置換であるアミノメチル、N 原子が $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_2$ - アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロゲン - 、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル；N - $C_1 - C_2$ - ピペラジニルメチル；モルホリニルメチル；N - イミダゾールメチル；ピペロニル；非置換フェニル、又はハロゲン、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルキルチオで置換されたフェニル；シアノ；又は $COOR_7$ 基（式中、 R_7 は水素又は $C_1 - C_2$ - アルキルである。）であり、

R_4 と R_5 が、これらが結合している炭素原子と一緒にピペリジニル又は $N - C_1 - C_2$ - ピペリジニル環を形成しており、

R_6 が、 $C_1 - C_2$ - アルキル、フェニル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 CHO 、 $C(O) - C_1 - C_2$ - アルキル、 $C(O)O - C_1 - C_2$ - アルキル、 $N - Mono$ - 若しくは $N, N - Di - C_1 - C_2$ - アルキルアミノ、 SF_5 又は SO_3H であり、それによって、 n が幾つであっても、 R_6 は同一でも、異なっていてもよく、

A が O であり、

X が、非置換 N 若しくは C であり、又は R_6 基で置換された N 若しくは C であり、

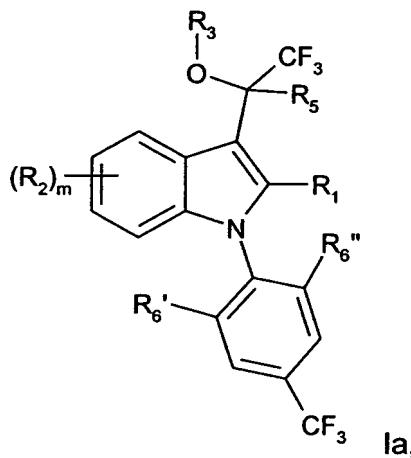
m が 0、1 又は 2 であり、 n が 2 又は 3 である、

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 2 4】

次式の化合物。

【化 2】



（式中、 R_1 は、水素、非置換 $C_1 - C_2$ - アルキル、又はヒドロキシル若しくは $C_1 - C_2$ - アルコキシで置換された $C_1 - C_2$ - アルキルであり、 R_2 はハロゲンであり、 m は 0 又は 1 であり、 R_3 は水素、 $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル又は $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_2$ - アルコキシメチルであり、 R_5 はメチル、エテニル又はエチニルであり、 R_6' 及び R_6'' は各々独立にフッ素、塩素又はシアノである。）

10

20

30

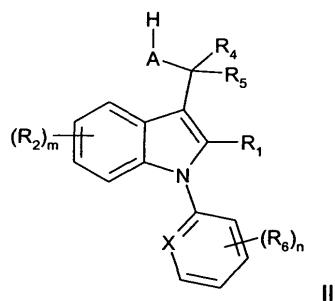
40

50

【請求項 25】

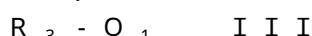
次式の化合物

【化3】



10

(式中、R₁、R₂、R₄、R₅、R₆、A、X、m及びnは、式Iで定義したとおりである。)が、場合によっては塩基触媒の存在下で、次式の化合物



(式中、R₃は、式Iで定義したとおりであり、Q₁は脱離基である。)と反応させることを特徴とする、請求項1に記載のそれぞれ遊離型又は塩型の式Iの化合物の調製方法。

【請求項 26】

ヒト以外の温血動物及び植物に付いた外寄生生物を防除するための、請求項1から24のいずれか一項に記載の式Iの化合物の使用。

20

【請求項 27】

生理的に許容される担体及び/又は分散剤に加えて、請求項1から24のいずれか一項に記載の少なくとも1種類の式Iの化合物の有効量を活性成分として含む、ヒト以外の温血動物又は植物に付いた寄生生物を防除する組成物。

【請求項 28】

それによって請求項1から24のいずれか一項に記載の少なくとも1種類の式Iの化合物の有効量が寄生生物又はその所在位置に対して使用される、ヒト以外の温血動物又は植物に付いた寄生生物を防除する方法。

【請求項 29】

ヒト以外の温血動物又は植物に付いた寄生生物を防除する方法における、請求項1から24のいずれか一項に記載の式Iの化合物の使用。

30

【請求項 30】

温血動物又は植物に付いた寄生生物に対する薬剤組成物の調製における、請求項1から24のいずれか一項に記載の式Iの化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【発明の開示】

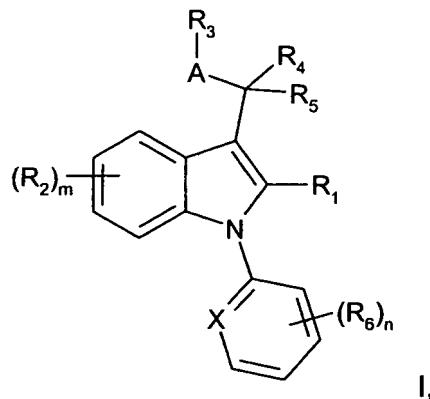
【0001】

本発明は、次式の新しいN-アリールインドール化合物、生産用温血家畜、家庭内の動物、及び植物に付いた外寄生生物、特にマダニ及びノミの防除におけるその製造及び使用、並びにこれらの化合物の少なくとも1種類を含む殺虫剤に関する。

40

【0002】

【化4】



10

式中、

R_1 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、非置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、(ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、アミノ、 N - モノ - 若しくは N, N - ジ - $C_1 - C_4$ - アルキルアミノ、 N - ベンジルアミノ又は N - ピリジルメチルアミノで置換された) $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、 SH 、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 $NHCOR_7$ 、 $NHOOR_7$ 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、 $C_1 - C_4$ - アルキル - シリル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換アリールアルキルチオ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、又は非置換若しくは置換アリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールアルキルオキシ、アリールチオ、アリールアルキルチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_2 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ヒドロキシル - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、 SH 、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルス

40

50

ルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールアルキルオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールチオ置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、それによって、 m が1よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、異なっていてもよく、又は2個の R_2 基はこれらが結合している環原子と一緒に、(窒素、硫黄若しくは酸素からなる群から選択される1若しくは2個の追加のヘテロ原子、又は1個のカルボニル基を含んでいてもよく、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル及び $C_1 - C_6$ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される1から4個の置換基で置換されていてもよい)5から6原子の脂肪族環を形成し、

R_3 は、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - シクロアルキルメチル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシメチル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル、非置換フェノキシメチル、フェニル部分においてハロゲン、 $C_1 - C_2$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルコキシで置換されたフェノキシメチル、ベンジルオキシメチル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - シクロアルキルメチル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、 $CSNR_7R_8$ 、 $C_1 - C_4$ - アルキル - シリル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_4 は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ハロ - $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ヒドロキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 COR_7 、 $COOR_7$ 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R_5 は、水素、 $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ -

10

20

30

40

50

- アルキニル、フェニル $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオメチル、ヒドロキシメチル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシメチル、N原子が非置換であるアミノメチル、N原子が $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロゲン - 、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン - 、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ハロ - $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_5 - C_6$ - シクロアルキルメチル(式中、シクロアルキルの1から3個の炭素原子は、NH、N($C_1 - C_4$ - アルキル)、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子で置換されていてもよい。)、シアノ、COR₇、COOR₇、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、NH₂、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロC₁ - C₆ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇及びCONR₇R₈からなる群から互いに独立に選択され、

又はR₄とR₅は、これらが結合している炭素原子と一緒に、(窒素、硫黄若しくは酸素からなる群から選択される追加の1個のヘテロ原子、又は1個のカルボニル基を含んでいてもよく、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル及び $C_1 - C_6$ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される1から4個の置換基で置換されていてもよい)3から6原子の脂肪族環を形成し、

R₆は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、SH、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、SO₃R₇、SO₂NR₇R₈、NR₇R₈、COR₇、COOR₇、CONR₇R₈、SF₅、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールオキシ及びヘテロアリールチオ置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、NH₂、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、COR₇、COOR₇及びCONR₇R₈からなる群から互いに独立に選択され、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

R₇及びR₈は互いに独立に、水素、非置換若しくは置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換若しくは置換 $C_1 - C_2$ - アルコキシC₁ - C₂ - アルキル、非置換若しくは置換 $C_2 - C_6$ - アルケニル、非置換若しくは置換 $C_2 - C_6$ - アルキニル、非置換若しくは置換

10

20

30

40

50

$C_3 - C_6$ - シクロアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ及びアルコキシカルボニルからなる群から互いに独立に選択される。）；非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル（アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル置換基は、各場合において、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ- $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択される。）であり、
10

AはO、S、SO又は SO_2 であり、

XはC又はNであり、

mは0、1、2、3又は4であり、

nは1、2、3、4又は5であって、

ただし、XがCである場合には、nは1よりも大きい。

【0003】

置換N-アリールインドール化合物は、例えば、ナトリウムチャネル阻害剤、ドパミン受容体拮抗物質、抗うつ剤又は抗炎症剤として薬剤活性を示すことが知られている。驚くべきことに、この化合物クラスのある種の誘導体が、特に生産用家畜、家庭内の動物、及び植物に付いた外寄生生物に対して、優れた殺虫性を有することが今回見出された。
20

【0004】

上記及び下記において使用する一般用語は、特に断らない限り、以下の意味を有する。

【0005】

（基それ自体として、また、他の基及び化合物、例えばハロゲンアルキル、アルコキシ及びアルキルチオの構造上の要素として）アルキルは、各場合において当該の基又は化合物中の特定の数の炭素原子を十分に考慮して、直鎖、すなわちメチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル若しくはヘキシル、又は分枝、例えば、イソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル若しくはイソヘキシル、好ましくは直鎖若しくは分枝 $C_1 - C_4$ - アルキル、特に $C_1 - C_2$ - アルキルである。
30

【0006】

（基それ自体として、また、他の基及び化合物の構造上の要素として）アルケニルは、各場合において当該の基又は化合物中の特定の数の炭素原子、及び共役又は孤立二重結合を十分に考慮して、直鎖、例えば、アリル、2-ブテニル、3-ペンテニル、1-ヘキセニル若しくは1,3-ヘキサジエニル、又は分枝、例えば、イソプロペニル、イソブテニル、イソプレニル、tert-ペンテニル若しくはイソヘキセニルである。

【0007】

（基それ自体として、また、他の基及び化合物の構造上の要素として）アルキニルは、各場合において当該の基又は化合物中の特定の数の炭素原子、及び共役又は孤立二重結合を十分に考慮して、直鎖、例えば、プロパルギル、2-ブチニル(butiny1)、3-ペンチニル(pentiny1)、1-ヘキシニル(hexiny1)、1-ヘプチニル/heptiny1)若しくは3-ヘキセン-1-イニル(iny1)、又は分枝、例えば、3-メチルブタ-1-イニル、4-エチルペンタ-1-イニル若しくは4-メチルヘキサ-2-イニルである。
40

【0008】

（基それ自体として、また、シクロアルキルメチルなどの他の基及び化合物の構造上の要素として）シクロアルキルは、各場合において当該の基又は化合物中の特定の数の炭素原子を十分に考慮して、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル、特にシクロペンチル又はシクロヘキシルである。

【0009】

10

20

30

40

50

炭素原子がヘテロ原子で置換された C₅ - C₆ - シクロアルキルの例は、モルホリニル、ピペリジニル、ピペラジニル、N - メチル - 若しくは N - エチルピペラジニル、テトラヒドロフラニル又はジオキソラニル、特にモルホリニル及び N - メチル - 又は N - エチルピペラジニルである。

【0010】

(基それ自体として、また、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオなどの他の基及び化合物の構造上の要素として)ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素、特にフッ素又は塩素である。

【0011】

ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオなどのハロゲン置換炭素含有基及び化合物は、部分ハロゲン化又は過ハロゲン化することができ、それによって複数のハロゲン化の場合には、ハロゲン置換基は同一でも、異なっていてもよい。(基それ自体として、また、ハロゲン - アルコキシ、ハロゲン - アルキルチオなどの他の基及び化合物の構造上の要素として)ハロゲン - アルキルの例は、CHF₂、CF₃など、フッ素、塩素及び / 又は臭素で一置換から三置換されたメチル; CH₂CF₃、CF₂CF₃、CF₂CC₁₃、CF₂CHC₁₂、CF₂CHF₂、CF₂CF₁₂、CF₂CHBr₂、CF₂CHC₁F、CF₂CHBrF 又はCC₁FCHC₁Fなど、フッ素、塩素及び / 又は臭素で一置換から五置換されたエチル; CH₂CHBrCH₂Br、CF₂CHFCF₃、CH₂CF₂CF₃、CH(CF₃)₂など、フッ素、塩素及び / 又は臭素で一置換から七置換されたプロピル又はイソプロピル; CF(CF₃)CHFCF₃、CH₂(CF₂)₂CF₃など、フッ素、塩素及び / 又は臭素で一置換から九置換されたブチル又はその異性体の 1 つ; CF(CF₃)(CHF)₂CF₃、CH₂(CF₂)₃CF₃など、フッ素、塩素及び / 又は臭素で 1 回から 11 回置換されたペンチル又はその異性体の 1 つ; 並びに (CH₂)₄CHBrCH₂Br、CF₂(CHF)₄CF₃、CH₂(CF₂)₄CF₃、C(CF₃)₂(CHF)₂CF₃など、フッ素、塩素及び / 又は臭素で 1 回から 13 回置換されたヘキシル又はその異性体の 1 つである。

【0012】

(基それ自体として、また、アリールアルキル、アリールオキシ、アリールアミノなどの他の基及び化合物の構造上の要素として)アリールは、例えば、非置換フェニル、一置換から五置換されたフェニル、非置換ナフチル、又は一置換から七置換されたナフチル、特に非置換フェニル又は置換フェニルである。

【0013】

基それ自体として、また、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアリールアミノなどの他の基及び化合物の構造上の要素として、ヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジル、s - トリアジニル、1, 2, 4 - トリアジニル、チエニル、フラニル、ピリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、インドリル又はインダゾリル、好ましくはピリジル、ピリミジル、ピリル、イミダゾリル又はフラニル、特にピリジル又はピリミジルのような基であるが、これらだけに限定されない。

【0014】

アリールアルキルは、アルキルとアリールという用語の組合せ、例えばベンジルとみなされる。

【0015】

ヘテロアリールアルキルは、アルキルとヘテロアリールという用語の組合せとみなされる。

【0016】

アルコキシ基は、好ましくは 1 から 6 炭素原子、より好ましくは 1 から 4 炭素原子、特に 1 又は 2 炭素原子の鎖長を有する。アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、n - ブトキシ、イソブトキシ、sec - ブトキシ及び tert

10

20

30

40

50

- プトキシ、並びに異性体ペンチルオキシ及びヘキシルオキシ、好ましくはメトキシ及びエトキシである。ハロアルコキシ基は、好ましくは、1から6炭素原子の鎖長を有する。ハロアルコキシは、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ及び2,2,2-トリクロロエトキシ、好ましくはジフルオロメトキシ、2-クロロエトキシ及びトリフルオロメトキシである。

【 0 0 1 7 】

アルキルチオ基は、好ましくは、1から6炭素原子の鎖長を有する。アルキルチオは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ又はtert-ブチルチオ、好ましくはメチルチオ及びエチルチオである。

0

〔 0 0 1 8 〕

本発明の範囲内の好ましい実施形態は以下のとおりである。

〔 0 0 1 9 〕

1. R_1 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、ハロ - $C_2 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、SH、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 $NHCOR_7$ 、 $NHCOOR_7$ 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 $CONR_7R_8$ 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換アリールアルキルチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、

R₂ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、SH、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、ハロ - C₃ - C₆ - シクロアルキルスルホニル

10

50

ルスルホニル、 SO_3R_7 、 $\text{SO}_2\text{NR}_7\text{R}_8$ 、 NR_7R_8 、 COR_7 、 COOR_7 、 CONR_7R_8 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールアルキルオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、ジ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、 COR_7 、 COOR_7 及び CONR_7R_8 からなる群から互いに独立に選択され、それによって、 m が1よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、異なっていてもよく、

R_3 が、水素、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -シクロアルキルメチル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -シクロアルキルメチル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、 COR_7 、 COOR_7 、 CONR_7R_8 、 CSNR_7R_8 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、ジ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、 COR_7 、 COOR_7 及び CONR_7R_8 からなる群から互いに独立に選択され、

R_4 が、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -シクロアルキル、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_8$ -シクロアルキル、ヒドロキシ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 COR_7 、 COOR_7 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、ジ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、 COR_7 、 COOR_7 及び CONR_7R_8 からなる群から互いに独立に選択され、

R_5 が、水素、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -シクロアルキル、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_8$ -シクロアルキル、 COR_7 、 COOR_7 、ピペロニル、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、ジ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルアミノ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、 COR_7 、 COOR_7 及び CONR_7R_8 からなる群から互いに独立に選択され、

R_6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキル、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニル、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニル、ヒドロキシ、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニルオキシ、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニルオキシ、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキルオキシ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルコキシ、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルケニルオキシ、ハロ- $\text{C}_2\text{-C}_6$ -アルキニルオキシ、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキルオキシ、 SH 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -シクロアルキルチオ、ハロ- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -アルキルチオ、ハロ- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -

10

20

30

40

50

- シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、ハロ - $C_3 - C_6$ - シクロアルキルスルホニル、 SO_3R_7 、 $SO_2NR_7R_8$ 、 NR_7R_8 、 COR_7 、 $COOR_7$ 、 C
 ONR_7R_8 、 SF_5 、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換アリールチオ、非置換若しくは置換ヘテロアリール、非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリールオキシ、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールチオであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択され、それによって、 n が幾つであっても、 R_6 は同一でも、異なっていてもよく、

R_7 及び R_8 が互いに独立に、水素、非置換若しくは置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換若しくは置換 $C_2 - C_6$ - アルケニル、非置換若しくは置換 $C_2 - C_6$ - アルキニル、非置換若しくは置換 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ及びアルコキシカルボニルからなる群から互いに独立に選択される。）、非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールアルキル、非置換若しくは置換ヘテロアリール、又は非置換若しくは置換ヘテロアリールアルキル（各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 COR_7 、 $COOR_7$ 及び $CONR_7R_8$ からなる群から互いに独立に選択される。）であり、

A が O 、 S 、 SO 又は SO_2 であり、

X が C 又は N であり、

m が 0 、 1 、 2 、 3 又は 4 であり、

n が 1 、 2 、 3 、 4 又は 5 であって、

ただし、 X が C である場合には、 n は 1 よりも大きい、

式 I の化合物。

【0020】

2. R_1 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 NR_7R_8 、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル及びハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルからなる群から互いに独立に選択され、

好みしくは、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ及びハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシか

10

20

30

40

50

らなる群から互いに独立に選択され、

より好ましくは、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、置換基は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル及びハロ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択され、

最も好ましくは、水素、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、非置換フェニルチオ又は非置換ナフチルである、

式Iの化合物。

【0021】

上記意味及び好ましい形態 (preference) に加えて、R₁ の更に好ましい意味は、(例えば、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、アミノ、N - モノ - 若しくはN, N - ジ - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、N - ベンジルアミノ又はN - ピリジルメチルアミノで置換された) C₁ - C₆ - アルキルに関する。

【0022】

したがって、特に好ましいR₁ 基の更なる群は、水素、非置換C₁ - C₄ - アルキル、(ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルチオ、N - モノ - 若しくはN, N - ジ - C₁ - C₂ - アルキルアミノ又はN - ピリジルメチルアミノ - で置換された) C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルキルカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、非置換フェニル、非置換フェニルチオ、(ハロゲンニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はハロ - C₁ - C₄ - アルコキシで各々置換された) フェニル及びフェニルチオ、並びにナフチルを含み、更により好ましいR₁ 基は、水素、非置換C₁ - C₂ - アルキル、ヒドロキシル若しくはC₁ - C₂ - アルコキシで置換されたC₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、フェニルチオ、及びナフチル、特に水素である。

【0023】

3. R₂ が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - ヒドロキシアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、N R₇ R₈、又は非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル及びハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニルからなる群から選択され、それによって、m が 1 よりも大きい場合には、R₂ は同一でも、異なっていてもよく、

好ましくは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルオキシ、非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₄ - アルコキシからなる群から選択され、それによって、m が 1 よりも大きい場合には、R₂ は同一でも、異なっていてもよく、

より好ましくは、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルコキ

10

20

30

40

50

シカルボニル、又は非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、C₁ - C₂ - アルキル及びC₁ - C₂ - アルコキシからなる群から選択され、それによつて、mが1よりも大きい場合には、R₂は同一でも、異なつてもよく、最も好ましくは、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル又はベンジルオキシ；特にハロゲン、ニトロ、メチル、メトキシ、メトキシカルボニル又はベンジルオキシ、特に塩素などのハロゲン、特にフッ素である、式Iの化合物。

【0024】

2個のR₂基が、これらが結合している環原子と一緒に、5から6原子の環を形成している場合には、好ましくは、この環は、O及びNからなる群から選択される1又は2個の同じ又は異なるヘテロ原子を含む、非置換5若しくは6員シクロアルキル環、又はC₁ - C₄ - アルキルで置換された5若しくは6員シクロアルキル環、特にジオキソラン環である。

10

【0025】

特に好ましいR₂基の更なる群は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₂ - アルコキシ、ベンジルオキシ、アミノ、N - モノ - 若しくはN, N - ディC₁ - C₂ - アルキルアミノ、及びC₁ - C₂ - アルコキシカルボニルを含み、又は2個のR₂基は、これらが結合している炭素原子と一緒にジオキソラン環を形成している。

20

【0026】

4. R₃が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換C₁ - C₆ - アルキルカルボニル(置換基は、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。)；非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニル(各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル及びハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニルからなる群から互いに独立に選択される。)であり、

30

好ましくは、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換C₁ - C₆ - アルキルカルボニル(置換基は、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。)；非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボ

40

50

ニル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₆ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択される。）であり、

より好ましくは、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₄ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₄ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₄ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換C₁ - C₄ - アルキルカルボニル（置換基は、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。）；非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニル（各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₄ - アルコキシからなる群から選択される。）であり、

最も好ましくは、水素、C₁ - C₂ - アルキル、C₃ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₃ - アルケニル、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₃ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₃ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₃ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₂ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₂ - アルキル)アミノチオカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルカルボニル、ベンジル、ベンゾイル、ベンジルオキシカルボニル又はフェニルアミノカルボニルであり、

特に、水素、メチル、シクロプロピルメチル、2 - プロペニル、メトキシカルボニル、2 - プロペニルオキシカルボニル、ハロ - ビニルオキシカルボニル、プロパルギルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノチオカルボニル、メチルカルボニル、ベンジル、ベンゾイル、ベンジルオキシカルボニル又はフェニルアミノカルボニルである、式Iの化合物。

【0027】

上記意味及び好ましい形態に加えて、R₃の更に好ましい意味は、C₁ - C₄ - アルコキシメチル、C₁ - C₂ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルコキシメチル、非置換フェノキシメチル、フェニル部分においてハロゲン、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル又はC₁ - C₂ - アルコキシで置換されたフェノキシメチル、ベンジルオキシメチル、及びCOR₇基（式中、R₇は、非置換C₁ - C₂ - アルコキシC₁ - C₂ - アルキル、カルボキシ置換C₁ - C₂ - アルコキシC₁ - C₂ - アルキル、又はCOO - C₁ - C₂ - アルキルである。）に関する。この群内のR₃の特に好ましい意味は、C₁ - C₂ - アルコキシメチル、C₁ - C₂ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルコキシメチル、非置換フェノキシメチル、フェニル部分においてハロゲン、ベンジルオキシメチル及びカルボキシメチルカルボニルで置換されたフェノキシメチルである。

【0028】

したがって、特に好ましいR₃基の更なる群は、水素；C₁ - C₄ - アルキル；C₃ - C₄ - シクロアルキルメチル；C₁ - C₂ - アルコキシメチル；C₁ - C₂ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルコキシメチル；非置換ベンジル、又はハロゲン、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル若しくはシアノで置換されたベンジル；非置換フェノキシメチル、非置換ベンジルオキシメチル、又はフェニル部分においてハロゲンで置換されたフェノキシメチル若しくはベンジルオキシメチル；カルボキシメチルカルボニル；R₇がC₁ - C₆ -

10

20

30

40

50

アルキル、アセチルオキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_5 - C_6$ - シクロアルキル、非置換フェニル、(ハロゲン、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル又はシアノで置換された)フェニル、フェニルエチル、チエニル、又はピペロニルである COR_7 基; R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ、アミノ、又は N - モノ - 若しくは N, N - ジ - $C_1 - C_2$ - アミノである $CONHR_7$ 基; R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、ベンジル、非置換 $C_2 - C_4$ - アルケニル若しくはハロゲン置換 $C_2 - C_4$ - アルケニルである、又は $C_2 - C_4$ - アルキニルである、 $C(O)OR_7$ 基; 及び R_7 が $C_1 - C_6$ - アルキル、非置換フェニル、若しくは(ハロゲン、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルキルで置換された)フェニル、特に水素である $C(S)NHR_7$ 基を含む。

10

【0029】

5. R_4 が、非置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $COOR_7$ 又はハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルであり、置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及びハロ - $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から選択され、

好ましくは、非置換 $C_1 - C_4$ - アルキル、置換 $C_1 - C_4$ - アルキル又はハロ - $C_1 - C_4$ - アルキルであり、置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から選択され、より好ましくは $C_1 - C_3$ - アルキル又はハロ - $C_1 - C_2$ - アルキルであり、より好ましくは $C_1 - C_2$ - アルキル又はハロ - $C_1 - C_2$ - アルキルであり、最も好ましくはメチル又はハロメチルであり、特にメチル又はトリフルオロメチルである、

20

式Iの化合物。

【0030】

6. R_5 が、水素、 $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ - $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ピペロニル、 $COOR_7$ 、非置換若しくは置換フェニル、又は非置換若しくは置換ベンジルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル及びハロ - $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルからなる群から互いに独立に選択され、

30

好ましくは、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、ピペロニル、非置換若しくは置換フェニル、又は非置換若しくは置換ベンジルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及びハロ - $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択され、

より好ましくは、 $C_1 - C_2$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル、エテニル、エチニル、フェニル又はベンジルであり、

40

最も好ましくは、メチル、ハロメチル、フェニル又はベンジルであり、

特に、メチル又はトリフルオロメチルである、

式Iの化合物。

【0031】

上記意味及び好ましい形態に加えて、 R_5 の更に好ましい意味は、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオメチル；ヒドロキシメチル； $C_1 - C_4$ - アルコキシメチル； N 原子が非置換であるアミノメチル、 N 原子が $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロゲン - 、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン - 、ハロ - $C_1 - C_2$ - アルキル - 若しくはハロ - $C_1 - C_2$ - アルコキシ - 置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル； $C_5 - C_6$ - シクロアルキルメチ

50

ル(シクロアルキルの1から3個の炭素原子は、NH、N(C₁-C₄-アルキル)、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子で置換されていてもよい。)；フェニル-C₂-C₆-アルキニル、特にフェニルエチニル；C₃-C₆-シクロアルキル-C₂-C₆-アルキニル、特にシクロプロピルエチニル；及びシアノに関する。

【0032】

したがって、特に好ましいR₅基の更なる群は、水素；C₁-C₈-アルキル；ハロ-C₁-C₂-アルキル；ヒドロキシメチル；ベンジル；C₅-C₆-シクロアルキル；C₂-C₆-アルケニル；C₂-C₄-アルキニル；フェニル-C₂-C₄-アルキニル；C₃-C₆-シクロアルキル-C₂-C₄-アルキニル；C₁-C₂-アルキルチオメチル；C₁-C₂-アルコキシメチル；N原子が非置換であるアミノメチル、N原子がC₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、ベンジル、非置換フェニル、ハロゲン-、ハロ-C₁-C₂-アルキル-若しくはハロ-C₁-C₂-アルコキシ-置換フェニル、非置換ピリジルメチル、又はハロゲン置換ピリジルメチルで一置換又は二置換されたアミノメチル；N-C₁-C₂-ピペラジニルメチル；モルホリニルメチル；N-イミダゾールメチル；ピペロニル；非置換フェニル、又はハロゲン、ハロ-C₁-C₂-アルキル、ハロ-C₁-C₂-アルコキシ若しくはハロ-C₁-C₂-アルキルチオで置換されたフェニル；シアノ；及びCOOR₇基(式中、R₇は水素又はC₁-C₂-アルキルである。)を含む。R₅の最も好ましい意味は、C₁-C₈-アルキル、ハロ-C₁-C₂-アルキル、C₂-C₆-アルケニル又はC₂-C₄-アルキニル、特にメチル、トリフルオロメチル、エテニル又はエチニルである。

【0033】

R₄とR₅が、これらが結合している炭素原子と一緒に環を形成している場合、この環は、例えば、ピペリジニル又はN-C₁-C₂-ピペリジニル環である。

【0034】

7. R₆が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、ハロ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、ハロ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、ハロ-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、ハロ-C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル又はハロ-C₁-C₆-アルキルスルホニル、SF₅であり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

好ましくは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁-C₄-アルキル、ハロ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、ハロ-C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ又はハロ-C₁-C₄-アルキルチオ、SF₅であり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

より好ましくは、ハロゲン、シアノ、C₁-C₂-アルキル、ハロ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-アルコキシ又はハロ-C₁-C₂-アルコキシ、SF₅であり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

最も好ましくは、ハロゲン、メチル、ハロメチル、メトキシ、又はハロメトキシ、SF₅であり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよく、

特に、ハロゲン又はトリフルオロメチルであり、それによって、nが幾つであっても、R₆は同一でも、異なっていてもよい、

式Iの化合物。

【0035】

特に好ましいR₆基の更なる群は、C₁-C₂-アルキル、フェニル、ハロ-C₁-C₂-アルキル、ハロ-C₁-C₂-アルコキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CHO、C(O)-C₁-C₂-アルキル、C(O)O-C₁-C₂-アルキル、N-モノ-及びN,N-ジ-C₁-C₂-アルキルアミノ、SF₅並びにスルホ(SO₃H)を含む。R₆の最も好ましい意味は、塩素、フッ素、トリフルオロメチル又はシアノ、特に塩素及びトリフルオロメチルである。

【0036】

10

20

30

40

50

8. A が O 又は S であり、

好ましくは O である、

式 I の化合物。

【0037】

9. X が C であり、

好ましくはハロゲン置換 C である、

式 I の化合物。

【0038】

10. m が 0、1、2、3 又は 4 であり、

好ましくは 0、1 又は 2 であり、

より好ましくは 0 又は 1 である、

式 I の化合物。

【0039】

11. n が 1、2、3 又は 4 であり、

好ましくは 1、2 又は 3 であって、ただし、X が C である場合には、n は 1 よりも大きい、

より好ましくは 2 又は 3 であり、

最も好ましくは 3 である、

式 I の化合物。

【0040】

12. R₁ が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、N R₇ R₈、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル及びハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニルからなる群から互いに独立に選択され、

R₂ が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、N R₇ R₈、又は非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールオキシ、非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル及びハロ - C₁ - C₆ - アルキルスルホニルからなる群から選択され、それによって、m が 1 よりも大きい場合には、R₂ は同一でも、異なっていてもよく、

R₃ が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキ

10

20

30

40

50

ル) アミノカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ($C_1 - C_6$ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル(置換基は、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。)；非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニル(各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル及びハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルからなる群から互いに独立に選択される。)であり、

R_4 が、非置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、置換 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $COOR_7$ 又はハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルであり、置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及びハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から選択され、

R_5 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルケニル、ハロ- $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ピペロニル、 $COOR_7$ 、非置換若しくは置換フェニル、又は非置換若しくは置換ベンジルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル及びハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルから互いに独立に選択され、

R_6 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル又はハロ- $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 SF_5 であり、それによって、 n が幾つであっても、 R_6 は同一でも、異なっていてもよく、

A が O 又は S であり、

X が C であり、

m が 0、1、2、3 又は 4 であり、

n が 1、2、3 又は 4 であって、ただし、 X が C である場合には、 n は 1 よりも大きい、

式 I の化合物。

【0041】

13. R_1 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ及びハロ- $C_1 - C_6$ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択され、

R_2 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニル、又は非置換若しくは置換アリール、非置換若しくは置換アリールオキシ($aryoxy$)、非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及びハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシからなる群から選択され、それによって、 m が 1 よりも大きい場合には、 R_2 は同一でも、異なっていてもよく、

10

20

30

40

50

R₃ が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₆ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換C₁ - C₆ - アルキルカルボニル(置換基は、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択される。)；非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₆ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択され、

R₄ が、非置換C₁ - C₄ - アルキル、置換C₁ - C₄ - アルキル又はハロ - C₁ - C₄ - アルキルであり、置換基は、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシからなる群から選択され、

R₅ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、ピペロニル、非置換若しくは置換フェニル、又は非置換若しくは置換ベンジルであり、各場合において、置換基は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₄ - アルコキシからなる群から互いに独立に選択され、

R₆ が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ又はハロ - C₁ - C₄ - アルキルチオ、SF₅ であり、それによって、n が幾つであっても、R₆ は同一でも、異なっていてもよく、

A が O であり、

X がハロゲン置換 C であり、

m が 0、1 又は 2 であり、

n が 1、2 又は 3 であって、ただし、X が C である場合には、n は 1 よりも大きい、式 I の化合物。

【0042】

14. R₁ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、非置換若しくは置換フェニル、非置換若しくは置換フェニルチオ、又は非置換若しくは置換ナフチルであり、置換基は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル及びハロ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択され、

R₂ が、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、又は非置換若しくは置換ベンジルオキシであり、置換基は、ハロゲン、C₁ - C₂ - アルキル及びC₁ - C₂ - アルコキシからなる群から選択され、それによって、m が 1 よりも大きい場合には、R₂ は同一でも、異なっていてもよく、

R₃ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - シクロアルキルメチル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、ハロ - C₂ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、C₂ - C₄ - アルキニルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノチオカルボニル、非置換若しくは置換C₁ - C₄ - アルキルカルボニル(置換基は、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルキルカルボニルオキシ及びフェニルからなる群から選択され、

10

20

30

40

50

される。) ; 非置換若しくは置換ベンジル、非置換若しくは置換ベンゾイル、非置換若しくは置換ベンジルオキシカルボニル、又は非置換若しくは置換フェニルアミノカルボニル(各場合において、置換基は、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びハロ - C₁ - C₄ - アルコキシからなる群から選択される。)であり、

R₄ が、C₁ - C₂ - アルキル又はハロ - C₁ - C₂ - アルキルであり、

R₅ が、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、エテニル、エチニル、フェニル又はベンジルであり、

R₆ が、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₂ - アルキル、ハロ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、又はハロ - C₁ - C₂ - アルコキシ、SF₅ であって、それによ 10
って、n が幾つであっても、R₆ は同一でも、異なっていてもよく、

A がO であり、

X がハロゲン置換C であり、

m が0 又は1 であり、

n が2 又は3 である、

式I の化合物。

【0043】

15. R₁ が、水素、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシカルボニル、非置換フェニル、ハロゲン置換フェニル、非置換フェニルチオ又は非置換ナフチルであり、

R₂ が、ハロゲン、ニトロ、メチル、メトキシ、メトキシカルボニル又はベンジルオキシであり、

R₃ が、水素、メチル、シクロプロピルメチル、2 - プロペニル、メトキシカルボニル、2 - プロペニルオキシカルボニル、ハロ - ビニルオキシカルボニル、プロパルギルオキシカルボニル、チオフェニルカルボニル、ピペロニルカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノカルボニル、C₁ - C₂ - アルキルアミノチオカルボニル、メチルカルボニル、ベンジル、ベンゾイル、ベンジルオキシカルボニル又はフェニルアミノカルボニルであり、

R₄ が、メチル又はトリフルオロメチルであり、

R₅ が、メチル又はトリフルオロメチルであり、

R₆ が、ハロゲン又はトリフルオロメチルであり、それによって、n が幾つであっても、R₆ は同一でも、異なっていてもよく、

A がO であり、

X がハロゲン置換C であり、

m が0 又は1 であり、

n が3 である、

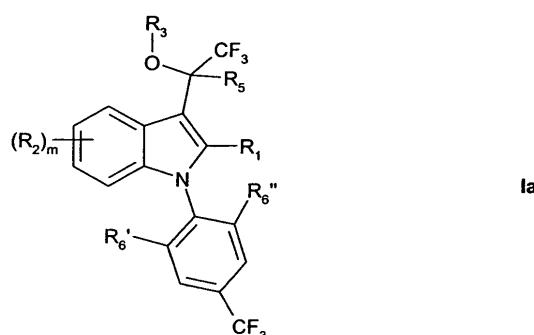
式I の化合物。

【0044】

16. 次式の化合物。

【0045】

【化5】



(式中、R₁、R₂、R₃、R₅ 及びm は、各々上記意味及び好ましい形態が適用され

10

20

30

40

50

、 R_6' 及び R_6'' は独立にハロゲン又はシアノ、例えば独立にフッ素、塩素又はシアノ、特に各々塩素である。)特に好ましい実施形態は、 R_1 が水素、非置換 $C_1 - C_2$ - アルキル、又はヒドロキシル若しくは $C_1 - C_2$ - アルコキシで置換された $C_1 - C_2$ - アルキル、特に水素であり、 R_2 がハロゲン、特にフッ素であり、 m が 0 又は 1 であり、 R_3 が水素、 $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル又は $C_1 - C_2$ - アルコキシ - $C_1 - C_2$ - アルコキシメチル、特に水素であり、 R_5 がメチル、エテニル又はエチニル、特にメチルであり、 R_6' 及び R_6'' が各々独立にフッ素、塩素又はシアノであり、好ましくは一方が塩素、他方が塩素、フッ素又はシアノであり、特に各々塩素である、上記式 I a の化合物に関する。

【0046】

10

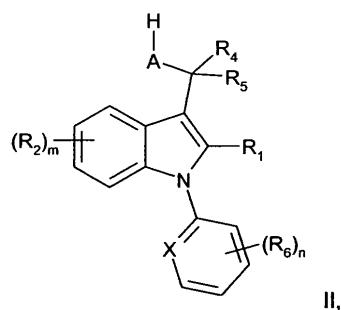
本発明においては、表 1 から 3 に記載の式 I の化合物が特に好ましく、合成例に挙げた式 I の化合物が最も好ましい。

【0047】

本発明の別の目的は、例えば、次式の化合物

【0048】

【化6】



20

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 A 、 X 、 m 及び n は、上で定義したとおりである。)が、場合によっては塩基触媒の存在下で、次式の化合物

$R_3 - Q_1$ I III

30

(式中、 R_3 は、上で定義したとおりであり、 Q_1 は脱離基である。)と反応することを特徴とする、それぞれ遊離型又は塩型の式 I の化合物の調製方法である。必要に応じて、それぞれ遊離型若しくは塩型の、本方法によって、若しくは別 の方法で得ることができる式 I の化合物は、式 I の別の化合物に転化することができ、本方法によって得ることができる異性体混合物は分離され、単離された所望の異性体及び/又は本方法によって得ることができる式 I の遊離化合物は塩に転化され、又は本方法によって得ることができる式 I の化合物の塩は、式 I の遊離化合物、若しくは別 の塩に転化される。

【0049】

化合物 I の塩に対して上で述べたことは、上記及び下記の出発材料の塩にも同様に当てはまる。

【0050】

40

反応相手は、互いにそのまで、すなわち、溶媒又は希釈剤を添加せずに、例えば、溶融状態で (in the melt) 反応し得る。しかし、ほとんどの場合、不活性溶媒若しくは希釈剤又はその混合物を添加することが有利である。かかる溶媒又は希釈剤の例は、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、テトラリン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ブロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン、テトラクロロエテンなどの芳香族、脂肪族及び脂環式炭化水素並びにハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメトキシジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンなどのケトン；N, N - ジメチルホルムアミド、N, N -

50

ジエチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル；及びジメチルスルホキシドなどのスルホキシドである。

【0051】

好ましい脱離基Q₁は、ハロゲン、特に塩素、臭素及びヨウ素である。

【0052】

反応の促進に適切な塩基は、例えば、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物、水素化物、アミド、アルカノラート、アセタート、カルボナート、ジアルキルアミド又はアルキルシリルアミド；アルキルアミン、アルキレンジアミン、N-アルキル化されてもよい、不飽和でもよい、シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム、並びに炭素環式アミンである。例として挙げることができる塩基は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメタノラート、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブタノラート、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1,5-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-5-エン(DBU)である。ジイソプロピルエチルアミン及び水素化ナトリウムが好ましい。

10

20

30

【0053】

反応は、有利には、約0から約100、好ましくは約10から約40の温度範囲で起こる。

【0054】

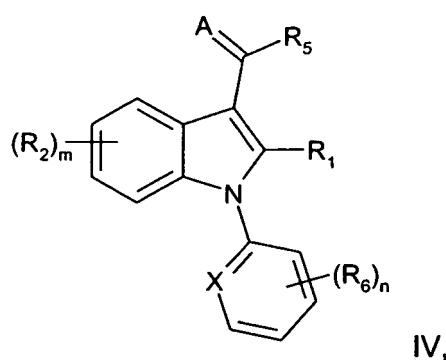
好ましい方法においては、式IIの化合物は、アミド、好ましくはN,N-ジメチルホルムアミド中で、塩基の存在下で、式IIIの化合物と室温で反応する。

【0055】

本発明の別の目的は、例えば、次式の化合物

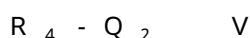
【0056】

【化7】



40

(式中、R₁、R₂、R₅、R₆、X、A、m及びnは、式Iで定義したとおりである。)が、次式の化合物



(式中、R₄は、上で定義したとおりであり、Q₂は脱離基である。)と反応することを特徴とする、それぞれ遊離型又は塩型の式IIの化合物の調製方法である。必要に応じて、それぞれ遊離型若しくは塩型の、本方法によって、若しくは別の方法で得ることができる式IIの化合物は、式IIの別の化合物に転化することができ、本方法によって得ができる異性体混合物は分離され、単離された所望の異性体及び/又は本方法によって得ができる式IIの遊離化合物は塩に転化され、又は本方法によって得ができる

50

できる式Ⅱの化合物の塩は、式Ⅱの遊離化合物、若しくは別の塩に転化される。

【0057】

反応相手は、互いにそのまで、すなわち、溶媒又は希釈剤を添加せずに、例えば、溶融状態で反応し得る。しかし、ほとんどの場合、不活性溶媒若しくは希釈剤又はその混合物を添加することが有利である。かかる溶媒又は希釈剤の例は、ベンゼン、トルエン、キシレン、メチレン、テトラリン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、プロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン、テトラクロロエテンなどの芳香族、脂肪族及び脂環式炭化水素並びにハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジブロピルエーテル、ジイソブロピルエーテル、ジブチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメトキシジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジエチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル；及びジメチルスルホキシドなどのスルホキシドである。

10

【0058】

好ましい脱離基Q₂は、MgBr、MgCl、MgI又はLi、特にMgBrである。

【0059】

反応は、有利には、約-20から約100、好ましくは約0から約30の温度範囲で起こる。

20

【0060】

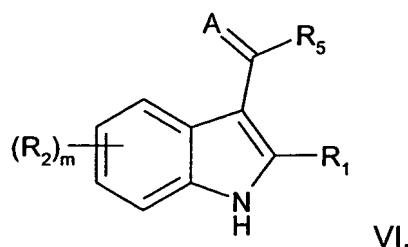
好ましい方法においては、式Ⅴの化合物は、エーテル、好ましくはジエチルエーテル中で、式Ⅴの化合物と室温で反応する。

【0061】

本発明の別の目的は、例えば、次式の化合物

【0062】

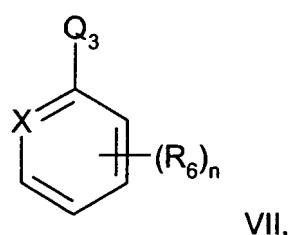
【化8】



(式中、R₁、R₂、R₅、A及びmは、式Ⅰで定義したとおりである。)が、場合によつては塩基触媒の存在下で、次式の化合物

【0063】

【化9】



(式中、R₆、X及びnは、式Ⅰで定義したとおりであり、Q₃は脱離基である。)と反応することを特徴とする、それぞれ遊離型又は塩型の式Ⅴの化合物の調製方法である。必要に応じて、それぞれ遊離型若しくは塩型の、本方法によって、若しくは別の方で得ることができる式Ⅴの化合物は、式Ⅴの別の化合物に転化することができ、本方法

50

によって得ることができる異性体混合物は分離され、単離された所望の異性体及び／又は本方法によって得ることができる式ⅤⅠの遊離化合物は塩に転化され、又は本方法によって得ることができる式ⅤⅠの化合物の塩は、式ⅤⅠの遊離化合物、若しくは別の塩に転化される。

【0064】

式ⅤⅠ及びⅤⅡの化合物は各々公知であり、又は当分野で公知の方法によって得ることができる。

【0065】

反応相手は、互いにそのまで、すなわち、溶媒又は希釈剤を添加せずに、例えば、溶融状態で反応し得る。しかし、ほとんどの場合、不活性溶媒若しくは希釈剤又はその混合物を添加することが有利である。かかる溶媒又は希釈剤の例は、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、テトラリン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、プロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン、テトラクロロエテンなどの芳香族、脂肪族及び脂環式炭化水素並びにハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメトキシジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンなどのケトン；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジエチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル；及びジメチルスルホキシドなどのスルホキシドである。

10

20

30

【0066】

反応の促進に適切な塩基は、例えば、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物、水素化物、アミド、アルカノラート、アセタート、カルボナート、ジアルキルアミド又はアルキルシリルアミド；アルキルアミン、アルキレンジアミン、N-アルキル化されてもよい、不飽和でもよい、シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム、並びに炭素環式アミンである。例として挙げることができる塩基は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメタノラート、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウム*tert*-ブタノラート、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1,5-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-5-エン(DBU)である。

30

【0067】

好ましい脱離基Q₃は、ハロゲン、特にフッ素及び塩素である。

40

【0068】

反応は、有利には、約0から約150、好ましくは約50から約120の温度範囲で起こる。

【0069】

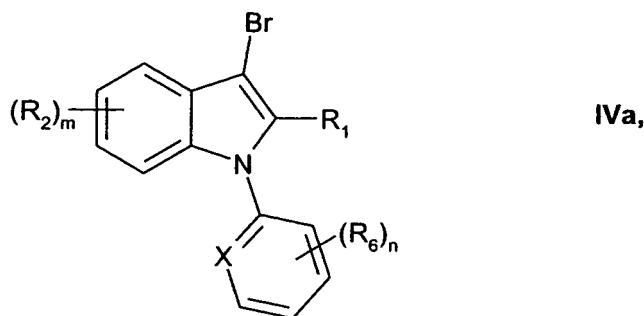
好ましい方法においては、式ⅤⅠの化合物は、アミド、好ましくはN,N-ジメチルホルムアミド中で、塩基、好ましくは炭酸カリウムの存在下で、式ⅤⅡの化合物と90で反応する。

【0070】

式ⅤⅡの化合物の代替製造方法は、次式の化合物

【0071】

【化10】



(式中、R₁、R₂、R₆、m及びnは上記のとおりである。)が、有機リチウム(1 lithium-organic)化合物、例えばn-ブチルリチウムと反応し、続いて生成した有機リチウム化合物が次式のケトンと反応することを特徴とする。

【0072】

【化11】



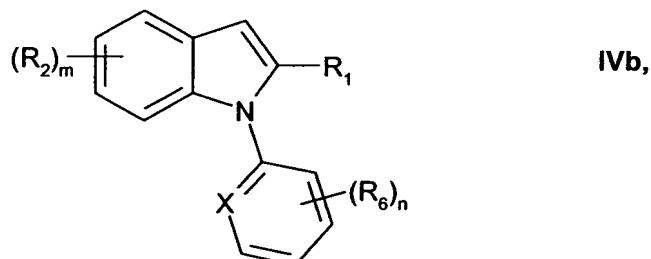
(式中、A、R₄及びR₅は上記のとおりである。)

【0073】

式IVaの化合物は、例えば、次式の化合物

【0074】

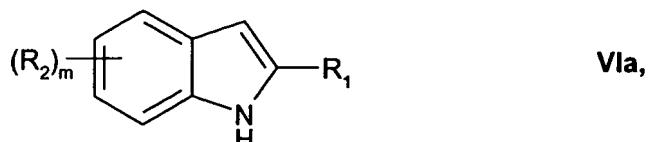
【化12】



(式中、R₁、R₂、R₆、m及びnは上記のとおりである。)を、臭素又はN-ブロモスクシンイミド(NBS)を用いて臭素化することによって得ることができる。式IVbの化合物は、次式の化合物

【0075】

【化13】



(式中、R₁、R₂及びmは上記のとおりである。)と上記式VIIの化合物との反応によって得ることができる。

【0076】

式IVbの化合物のハロゲン化反応、メタル化反応段階、及びケトンとの更なる反応は、有機化学の教科書からそれ自体公知である方法ですべて実施される。また、式VIIa及びVIIbの化合物は公知であり、又は当分野で公知の方法によって得ることができる。

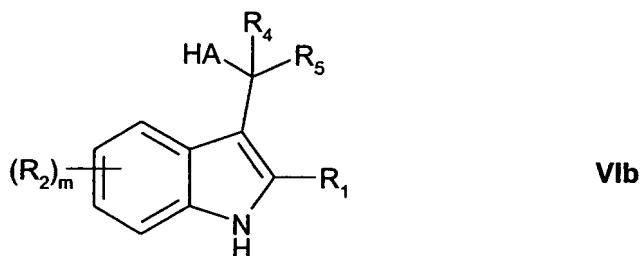
【0077】

式Iの化合物の更なる代替製造方法は、次式の化合物

50

【0078】

【化14】



(式中、A、R₁、R₂、R₄、R₅及びmは上記のとおりである。)が上記式VIIの化合物と反応して、上記式(II)の化合物を生成し、上記式(II)の化合物が上記式VIIの化合物と更に反応してもよいことを特徴とする。この一連の反応の反応条件は、上記のように適切に選択される。

【0079】

式VIbの化合物は、例えば塩化メチレン、クロロホルムなどの不活性非プロトン溶媒中で、室温で、又は室温と還流との間の高温で、場合によっては、適切な触媒の存在下で、上記式VIaの化合物と上記式VIIの化合物のフリーデル-クラフツ型反応によって得ることができる。

【0080】

式VIbの化合物の更なる合成経路は、上記式VIaの化合物が次式の化合物

【0081】

【化15】



(式中、A及びR₅は上述したとおりであり、Q₄は脱離基、例えばハロゲンである。)と反応して、上記式VIの化合物を生成し、次いで式VIの化合物が上記式Vの化合物と更に反応することを特徴とする。

【0082】

式VIaの化合物と式IXの化合物の反応は、典型的なフリーデル-クラフツアシル化反応であり、有機化学の教科書に記載のように、例えば、非プロトン性有機溶媒中で、適切な触媒の存在下で、実施される。生成した式VIの化合物と式Vの化合物の反応は、式IVとVの化合物間の反応において上述した条件下で実施される。

【0083】

化合物Iの塩は、公知の方法によって製造することができる。例えば、酸付加塩は、化合物Iから、適切な酸、又は適切なイオン交換試薬で処理することによって得ることができる。塩基との塩は、適切な塩基、又は適切なイオン交換試薬で処理することによって得ることができる。

【0084】

化合物Iの塩は、通常の手段によって、遊離化合物Iに転化することができる。例えば、酸付加塩は、適切な塩基組成物、又は適切なイオン交換試薬で処理することによって転化することができ、例えば、塩基との塩は、適切な酸、又は適切なイオン交換試薬で処理することによって転化することができる。

【0085】

化合物Iの塩は、公知の方法によって化合物Iの他の塩に転化することができる。例えば、酸付加塩は、例えば、塩酸塩などの無機酸の塩を、酸のナトリウム、バリウム、銀塩などの適切な金属塩、例えば、酢酸銀を用いて、適切な溶媒中で処理することによって、他の酸付加塩に転化することができる。生成した無機塩、例えば塩化銀は、不溶性であり、したがって反応混合物から沈殿する。

10

20

30

40

50

【0086】

方法及び／又は反応条件に応じて、塩形成性の化合物Ⅰを遊離型又は塩型として得ることができる。

【0087】

化合物Ⅰは、その水和物の形で得ることもでき、及び／又は例えば、必要に応じて、固体で存在する化合物の結晶化に用いられる他の溶媒を含むこともできる。

【0088】

化合物Ⅰ及びⅠⅠは、光学異性体及び／又は幾何異性体として、又はその混合物として、存在してもよい。本発明は、純粋な異性体と可能な全異性体混合物の両方に関係し、立体化学的な詳細を例ごとに具体的に記述しない場合でも、上記及び下記でそのように理解されたい。

10

【0089】

本方法又は別 の方法によって得ることができる、化合物Ⅰ及びⅠⅠのジアステレオ異性体混合物は、それらの成分の物理的・化学的差に基づいて、公知の方法によって、例えば、分別結晶、蒸留及び／又はクロマトグラフィーによって、純粋なジアステレオ異性体に分離することができる。

【0090】

それに応じて得ることができる鏡像異性体混合物は、公知の方法によって、例えば、光学活性溶媒からの再結晶によって、鏡像異性吸着剤を備えたクロマトグラフィー、例えば、酢酸セルロース上の高圧液体クロマトグラフィー（HPLC）によって、適切な微生物の助けを借りて、特異的固定化酵素を用いた切断によって、例えば鏡像異性クラウンエーテルを用いて包接化合物を形成し、それによって1種類の鏡像異性体のみを複合体することによって、純粋な異性体に分割することができる。

20

【0091】

本発明によれば、対応する異性体混合物の分離とは別に、一般に公知のジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成方法を適用して、例えば、それに対応して適切な立体化学を有する遊離体（educt）を用いて本発明の方法を実施することによって、純粋なジアステレオ異性体又は鏡像異性体を得ることもできる。

【0092】

個々の成分が、異なる生物学的効力を有することを前提に、生物学的により活性な異性体、例えば鏡像異性体を単離又は合成することが有利である。

30

【0093】

本発明の方法においては、用いる出発材料及び中間体は、好ましくは、特に有用であると最初に記述した化合物Ⅰをもたらす出発材料及び中間体である。

【0094】

本発明は、実施例に記載の調製方法に特に関係する。

【0095】

化合物Ⅰの調製のために本発明に用いられる新しい出発材料及び中間体、並びにその使用及びその調製方法も、同様に、本発明の一目的を形成する。

40

【0096】

本発明による化合物Ⅰは、その広い活性スペクトルが注目され、特に動物の内外寄生生物の防除を含めて、有害生物防除に貴重な活性成分であると同時に、温血動物、魚及び植物によって十分許容される。

【0097】

本発明においては、外寄生生物は、特に昆虫、ダニ類（ダニ及びマダニ）及び甲殻類（カイアシ（sea lice））であると理解される。外寄生生物としては、以下の順の昆虫が挙げられる：鱗し目、鞘し目、同じ目、半し目、異し類、双し目、網し目、総し目、直し目、シラミ目、ノミ目、ハジラミ目、総尾目、等し目、チャタテムシ目及び膜し目。しかし、特に挙げができる外寄生生物は、ヒト又は動物を悩まし、病原体を保有する外寄生生物、例えば、ムスカ ドメスチカ（Musca domestica）、ム

50

スカ ベツスチシマ (*Musca vetustissima*)、ムスカ オータムナリス (*Musca autumnalis*)、ファニア カニクラリス (*Fannia canicularis*)、サルコファガ カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、ルシリア クブリナ (*Lucilia cuprina*)、ルシリア セリカタ (*Lucilia sericata*)、ハイポデルマ ボビス (*Hypoderma bovis*)、ハイポデルマ リネアタム (*Hypoderma lineatum*)、クリソミア クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、デルマトビア ホミニス (*Dermatobia hominis*)、コクリオミイア ホミニボラクス (*Cochliomyia hominivorax*)、ガステロフィラス インテスチナリス (*Gasterophilus intestinalis*)、オエストラス オビス (*Oestrus ovis*)などのハエ、ヘマトビア イリタンス イリタンス (*Haematobia irritans irritans*)、ヘマトビア イリタンス エキシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ストモキシス カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、ヘマトポタ (*Haematopota*)種(例えば、ヘマトポタ プルビアリス (*Haematopota pluvialis*))及びタバヌス (*Tabanus*)種(例えば、タバヌス ニグロビッタタス (*Tabanus nigrovittatus*))などのアブ科の亜科を含むウマバエ(アブ)、クリソプス (*Chrysops*)種(例えば、クリソプス カエクチエンス (*Chrysops caecutiens*))などのメクラアブ (*Chrysopsinae*)；メロファガス オビヌス (*Melophagus ovinus*) (ヒツジシラミバエ)などのシラミバエ科；グロッшинニア (*Glossinina*)種などのツェツエバエなどのサシバエ；セラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) (ヌカカ)、シムリイダエ (*Simuliidae*) (ブユ)、サイコディダエ (*Psychodidae*) (スナバエ)などの小昆虫のような他の刺咬昆虫；さらに、吸血昆虫、例えば、ハマダラカ属、ヤブカ属、イエカ属などの蚊、クテノセファリデスフェリス (*Ctenocephalides felis*)及びクテノセファリデス カニス (*Ctenocephalides canis*) (ネコノミ及びイヌノミ)、ゼノプシラ ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)、プレクス イリタンス (*Pulex irritans*)、セラトフィルス ガリナエ (*Ceratophyllus gallinae*)、デルマトフィルス ペネトランス (*Dermatophyllus penetrans*)などのノミ、リノグナサス (*Linognathus*)種、ヘマトピナス (*Haematopinus*)種、ソレノポテス (*Solenopotes*)種、ペディキュラス ヒュマニス (*Pediculus humanis*)などの吸血シラミ(シラミ目)；さらに、ボビコーラ (*Bovicola*) (ダマリニア (*Damalina*))オビス (*ovis*)、ボビコーラ(ダマリニア)ボビス (*bovis*)、他のボビコーラ種などのハジラミ(ハジラミ目)である。外寄生生物は、ダニ(例えば、コリオプテス ボビス (*Chorioptes bovis*)、ケイレチエラ (*Cheyletiella*)種、デルマニサス ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デモデクス カニス (*Demodex canis*)、サルコプテス スカビエイ (*Sarcoptes scabiei*)、ブソロプテス オビス (*Psoroptes ovis*)及びブソラーガテス (*Psorergates*)種、マダニなどのダニ目のメンバーも含む。公知の代表的なマダニは、例えば、ウシマダニ属、キララマダニ属、アノセンター (*Anocentor*)属、カクマダニ属、チマダニ属、イボマダニ属、マダニ属、リピセンター (*Rhipicentor*)属、マルガロプス属、コイタマダニ属、ナガヒメダニ属、オトビウス属、カズキダニ属などである。これらは、好ましくは、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギなどの家畜、ニワトリ、シチメンチョウ、ホロホロチョウ、ガチョウなどの家禽、ミンク、キツネ、チンチラ、ウサギなどの毛皮動物、及びネコ、イヌなどの家庭内の動物、さらに、ヒトを含めて、温血動物に寄生する。

【0098】

式Iの化合物は、衛生有害生物 (hygiene pest)、特に、イエバエ科、ニ

10

20

30

40

50

クバエ科、アノフィリダエ (*Anophiliidae*) 科及びカ科の双し目、直し目、網し目(例えば、ブラテラ ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、ブラッタ オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ペリプランエタ アメリカナ (*Periplaneta americana*)などのゴキブリ科(ゴキブリ))、並びに膜し目(例えば、アリ科(アリ)及びスズメバチ科(スズメバチ))に対して使用することもできる。。

【0099】

化合物Iは、植物の寄生ダニ及び昆虫に対しても持続性のある効力を有する。ダニ目のハダニの場合には、化合物Iは、ハダニ科(ハダニ属及びパノニカス属)の卵、若虫及び成体に対して有効である。

10

【0100】

化合物Iは、同じ目の吸汁性昆虫(*sucking insect*)に対して、特に、アブラムシ科、ウンカ科、オオヨコバイ科、キジラミ科、ロシダエ科(*Locciidae*)、マルカイガラムシ科及びフシダニ科(*Eriophyidae*)(例えば、柑橘類果実上のサビダニ) ; 半し目、異し類及び総し目の有害生物に対して、並びに鱗し目、鞘し目、双し目及び直し目の草食昆虫に対して、高い活性を有する。

【0101】

化合物Iは、土壤中の有害生物に対する土壤殺虫剤として同様に適切である。

【0102】

したがって、式Iの化合物は、穀類、ワタ、コメ、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、野菜、果実、タバコ、ホップ、柑橘類、アボカドなどの作物上の吸汁性昆虫及び食性昆虫(*eating insect*)の成長の全段階に対して有効である。

20

【0103】

式Iの化合物は、キタネコブセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、ネグサレセンチュウ、クキセンチュウ、ネモグリセンチュウ、ネダニ(*Rizoglyphus*)などの種の植物の線虫に対して有効である。

【0104】

特に、式Iの化合物は、内部寄生性線虫及び吸虫が、ほ乳動物及び家禽、例えば、ヒツジ、ブタ、ヤギ、ウシ、ウマ、ロバ、イヌ、ネコ、モルモット及び外来のトリの重度疾患の原因になり得る、ゼン虫に対して有効である。この適応症の典型的な線虫は、捻転胃虫属、毛様線虫属、オステルタギア属、ネマトディルス属、クーペリア属、回虫属、ブノストヌム属、腸結節虫属(*Oesophagostomum*)、シャベルチア属(*Charberthia*)、鞭虫属、ストロンギルス属、トリコネマ属(*Trichonema*)、デクチオカウラス属、毛頭虫属、ヘテラキス属(*Heterakis*)、トキソカラ属、アスカリディア属、ギヨウチュウ属、鉤虫属、ウンシナリア属、トキサスカリス属及びウマカイチュウである。吸虫としては、肝吸虫、槍形吸虫属、棘口吸虫属、特に、蛭状吸虫科、特に肝蛭が挙げられる。式Iの化合物の特別な利点は、ベンゾイミダゾール系活性成分に対して耐性のある寄生生物に対するその効力である。

30

【0105】

ネマトディルス属、クーペリア属及び腸結節虫属のある種の有害生物は、宿主動物の腸管に寄生し、一方、捻転胃虫属及びオステルタギア属の他の有害生物は胃に寄生し、デクチオカウラス属の有害生物は肺組織に寄生する。フィラリア属(*Filariidae*)及びセタリア属(*Setariidae*)の寄生生物は、内部細胞組織及び器官、例えば、心臓、血管、リンパ管及び皮下組織に存在し得る。特に注目すべき寄生生物は、イヌ糸条虫のディロフィラリア イミチス(*Dirofilaria immitis*)である。式Iの化合物は、これらの寄生生物に対して極めて有効である。

40

【0106】

また、式Iの化合物は、ヒト病原性寄生生物の防除に適切である。そのうち、消化管に現れる典型的代表的寄生生物は、鉤虫属、アメリカ鉤虫属、回虫属、糞線虫属、旋毛虫属、毛頭虫属、鞭虫属及びぎょう虫属の寄生生物である。本発明の化合物は、血液、組織及

50

び種々の器官に現れるフィラリア属由来のブケレリア属、ブルギア属、オンコセルカ属及びロア糸状虫属の寄生生物に対して、また、ドラクンクルス属、並びに特に胃腸管に侵入する糞線虫属及び旋毛虫属の寄生生物に対しても有効である。

【0107】

本発明による式Iの化合物の良好な殺虫活性は、上記有害生物の少なくとも50-60%の死滅率に相当する。特に、式Iの化合物は、例外的に長い効力期間が注目される。

【0108】

式Iの化合物は、未改変形態で好ましくは使用され、又は製剤分野で従来使用されるアジュバントと一緒に好ましくは使用され、したがって公知の方法によって加工して、例えば、乳化可能な濃縮物、直接希釈可能な溶液、希薄乳濁液、可溶性粉末、顆粒、又は重合体物質中のマイクロカプセル化を得ることができる。組成物と同様に、適用方法は、所期の目的、及び一般的な状況に従って選択される。

10

【0109】

式Iの活性成分、又はこの活性成分と他の活性成分との組合せを含み、固体若しくは液体アジュバントを含んでいてもよい、製剤、すなわち薬剤、調製物又は組成物は、それ自体公知の方法によって、例えば、活性成分を延展組成物、例えば溶媒、固体担体、及び場合によっては表面活性化合物（界面活性剤）と十分混合及び/又は粉碎することによって、製造される。

【0110】

当該溶媒は、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール、プロピレンジコール、ジプロピレンジコールエーテル、エチレングリコール、エチレングリコールモノメチル又はエチルエーテルなどのグリコール並びにそのエーテル及びエステル、シクロヘキサン、イソホロン、ジアセタノール（diacetanol）アルコールなどのケトン、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミドなどの高極性溶媒、又は水、ナタネ油、ヒマシ油、ヤシ油、ダイズ油などの植物油、並びに適切であればシリコーンオイルであり得る。

20

【0111】

ゼン虫の防除において温血動物に使用される好ましい適用形態としては、溶液剤、乳濁液剤、懸濁液剤（水薬）、食品添加物、散剤、発泡錠剤を含めた錠剤、巨丸剤、カプセル剤、マイクロカプセル剤、ポアオン製剤などが挙げられ、それによって、調合賦形剤の生理学的適合性を考慮しなければならない。

30

【0112】

錠剤及び巨丸剤の結合剤は、デンプン、セルロース又はタンパク質誘導体（例えば、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルヒドロキシエチルセルロース、ゼイン、ゼラチンなどのタンパク質など）、及びポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドンなどの合成高分子など、水又はアルコールに可溶である化学修飾重合体天然物質であり得る。錠剤は、充填剤（例えば、デンプン、微結晶セルロース、糖、ラクトースなど）、流動化剤及び崩壊剤も含む。

【0113】

駆虫薬（anthelmintic）が飼料濃縮物の形で存在する場合、用いる担体は、例えば、パフォーマンス飼料（performance feed）、飼料用穀物又はタンパク質濃縮物である。かかる飼料濃縮物又は組成物は、活性成分とは別に、添加剤、ビタミン、抗生物質、化学療法剤又は他の殺虫剤、主に静菌剤、静真菌剤、抗コクシジウム剤、さらにはホルモン製剤、同化作用を有する物質、成長を促進する物質、食肉用動物の肉質に影響を及ぼす物質、又は生物に別の様式で有益である物質を含むことができる。組成物、又はその中に含まれる式Iの活性成分を飼料又は飲料桶に直接添加する場合、処方された飼料又は飲料は、好ましくは濃度0.0005から0.02重量%（5-200ppm）の活性成分を含む。

40

【0114】

本発明による式Iの化合物は、単独で、又は他の殺生物剤と組み合わせて、使用するこ

50

とができる。本発明による式Iの化合物は、例えば、活性を増大させるために、同じ活性領域(sphere of activity)を有する殺虫剤と組み合わせることができ、又は例えば、活性範囲(range of activity)を拡大するために、別の活性領域を有する物質と組み合わせることができる。いわゆる忌避剤を添加することも聰明であり得る。活性範囲を内部寄生生物に拡大すべき場合、例えば、駆虫剤(wormer)の場合には、式Iの化合物を、内部寄生性を有する物質と適切に組み合わせる。式Iの化合物を抗菌性組成物とも併用できることは言うまでもない。式Iの化合物は、成虫駆除剤であるので、すなわち、特に標的寄生生物の成虫期に対して有効であるので、寄生生物の幼若期を代わりに攻撃する殺虫剤の添加は極めて有利であり得る。このようにして、大きな経済的損害を与える寄生生物の最大部分を網羅する。さらに、この作用は、耐性の形成を回避するのに実質的に寄与する。多数の組合せは相乗効果ももたらし得る。すなわち、活性成分総量を削減することができ、生態学的観点から望ましい。組合せ相手の好ましい群、及び特に好ましい組合せ相手を以下に列挙する。それによって、組合せは、式Iの化合物に加えて、これらの相手の1種類以上を含み得る。

10

20

【0115】

混合物中の適切な相手は、殺生物剤、例えば、多様な活性機序を有する殺虫剤及びダニ駆除剤であり得る。これらを以下に列挙する。これらは、当業者に長年知られており、例えば、キチン合成阻害剤、成長調節物質；幼若ホルモンとして作用する活性成分；成虫駆除剤として作用する活性成分；広帯域(broad-band)殺虫剤、広帯域ダニ駆除剤及び殺線虫剤；並びに周知の駆虫薬、昆虫及び/又はダニ阻止物質、前記忌避剤又は分離剤(detacher)である。

【0116】

適切な殺虫剤及びダニ駆除剤の非限定的例：

【0117】

【表1】

1. アバメクチン	
2. AC303 630	
3. アセファット	
4. アクリナトリン	
5. アラニカルブ	
6. アルジカルブ	
7. α -シペルメトリン	
8. アルファメトリン	
9. アミトラズ	10
10. アベルメクチンB ₁	
11. AZ60541	
12. アジンホスA	
13. アジンホスM	
14. アジンホスメチル	
15. アゾシクロチン	
16. バシラス・サブチリス毒素	
17. ベンジオカルブ	
18. ベンフラカルブ	
19. ベンサルタップ	20
20. β -シフルトリン	
21. ビフェントリン	
22. BPMC	
23. プロフェンプロクス	
24. プロモホスA	
25. プフェンカルブ	
26. ププロフェジン	
27. プトカルボキシン	
28. プチルピリダベン	
29. カズサホス	30
30. カルバリル	
31. カルボフラン	
32. カルボフェンチオン	
33. カルタップ	
34. クロエトカルブ	
35. クロエトキシホス	
36. クロルフェナピル	
37. クロルフルアズロン	
38. クロルメホス	
39. クロルピリホス	
40. シスースメトリン	40
41. クロシトリン	
42. クロフェンテジン	
43. シアノホス	
44. シクロプロスリン	
45. シフルスリン	

4 6. シヘキサチン	
4 7. D 2 3 4 1	
4 8. デルタメトリン	
4 9. デメトンM	
5 0. デメトンS	
5 1. デメトン-S-メチル	
5 2. ジブチルアミノチオ	
5 3. ジクロフェンチオン	
5 4. ジクリホス	10
5 5. ジエチオン	
5 6. ジフルベンズロン	
5 7. ジメトアト	
5 8. ジメチルビンホス	
5 9. ジオキサチオン	
6 0. D P X-M P 0 6 2	
6 1. エジフェンホス	
6 2. エマメクチン	
6 3. エンドサルファン	
6 4. エスフェンバレラト	
6 5. エチオフェンカルブ	20
6 6. エチオン	
6 7. エトフェンプロックス	
6 8. エトプロホス	
6 9. エトリムホス	
7 0. フェナミホス	
7 1. フェナザキン	
7 2. フェンブタチノキシド	
7 3. フェニトロチオン	
7 4. フエノブカルブ	
7 5. フエノチオカルブ	
7 6. フエノキシカルブ	30
7 7. フェンプロパトリン	
7 8. フェンピラド	
7 9. フェンピロキシメート	
8 0. フエンチオン	
8 1. フエンバレラート	
8 2. フィプロニル	
8 3. フルアジナム	
8 4. フルアズロン	
8 5. フルシクロクスロン	
8 6. フルシスリナト	
8 7. フルフェノクスロン	40
8 8. フルフェノプロクス	
8 9. フオノフオス	
9 0. フォルモチオン	
9 1. フオスチアザト	

9 2. フブフェンプロクス	
9 3. HCH	
9 4. ヘプテノホス	
9 5. ヘキサフルムロン	
9 6. ヘキシチアゾックス	
9 7. ヒドロブレン	
9 8. イミダクロプリド	
9 9. 昆虫活性真菌	
1 0 0. 昆虫活性線虫	10
1 0 1. 昆虫活性ウイルス	
1 0 2. イプロエンホス	
1 0 3. イソフェンホス	
1 0 4. イソプロカルブ	
1 0 5. イソキサチオン	
1 0 6. イベルメクチン	
1 0 7. ルーシハロスリン	
1 0 8. ルフェヌロン	
1 0 9. マラチオン	
1 1 0. メカルバム	
1 1 1. メスルフェンホス	20
1 1 2. メタルデヒド	
1 1 3. メタミドホス	
1 1 4. メチオカルブ	
1 1 5. メトミル	
1 1 6. メトブレン	
1 1 7. メトルカルブ	
1 1 8. メビンホス	
1 1 9. ミルベメクチン	
1 2 0. モキシデクチン	
1 2 1. ナレド	
1 2 2. NC184	30
1 2 3. NI-25, アセトアミプリド	
1 2 4. ニテンピラム	
1 2 5. オメトアト	
1 2 6. オキサミル	
1 2 7. オキシデメトンM	
1 2 8. オキシデプロホス	
1 2 9. パラチオン	
1 3 0. パラチオン-メチル	
1 3 1. ペルメトリン	
1 3 2. フェントアート	40
1 3 3. フオラト	
1 3 4. フオサロン	
1 3 5. フオスメト	
1 3 6. フオキシム	
1 3 7. ピリミカルブ	

138.	ピリミホスA	
139.	ピリミホスM	
140.	プロメカルブ	
141.	プロパフオス	
142.	プロポクスル	
143.	プロチオホス	
144.	プロトアート	
145.	ピラクロホス	
146.	ピラダフェンチオン	10
147.	ピレスメトリン	
148.	ピレスラム	
149.	ピリダベン	
150.	ピリミジフェン	
151.	ピリプロキシフェン	
152.	RH5992	
153.	RH-2485	
154.	サリチオン	
155.	サブフォス	
156.	シラフルオフェン	
157.	スピノサド	20
158.	スルフォテプ	
159.	スルプロフォス	
160.	テブフェノジド	
161.	テブフェンピラド	
162.	テブピリムホス	
163.	テフルベンズロン	
164.	テフルトリン	
165.	テメホス	
166.	テルバム	
167.	テルブホス	
168.	テトラクロルビンホス	30
169.	チアフェノックス	
170.	チオジカルブ	
171.	チオファノックス	
172.	チオナジン	
173.	チューリングンシン	
174.	トラロメトリン	
175.	トリアルセン	
176.	トリアザメート	
177.	トリアゾホス	
178.	トリアズロン	
179.	トリクロルフオン	40
180.	トリフルムロン	
181.	トリメタカルブ	
182.	バミドチオン	
183.	XMC (3,5-キシリル-メチルカ	

ルバマート)
184. キシリルカルブ
185. YI5301/5302
186. ピ・シペルメトリン
187. ゼタメトリン

【0118】

適切な駆虫薬の非限定的例を以下に列挙する。少数の代表例は、駆虫活性に加えて、殺虫及び殺ダニ活性を有し、一部は上記リストに既に記載されている。

【0119】

10

(A1) プラジクアンテル = 2 - シクロヘキシカルボニル - 4 - オキソ - 1, 2, 3, 6, 7, 11b - ヘキサヒドロ - 4H - ピラジノ [2, 1 -] イソキノリン

(A2) クロサンテール = 3, 5 - ジヨード - N - [5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (a - シアノ - 4 - クロロベンジル) フェニル] サリチルアミド

(A3) トリクラベンダゾール = 5 - クロロ - 6 - (2, 3 - ジクロロフェノキシ) - 2 - メチルチオ - 1H - ベンゾイミダゾール

(A4) Levamisole = L - (-) - 2, 3, 5, 6 - テトラヒドロ - 6 - フェニルイミダゾ [2, 1b] チアゾール

(A5) メベンダゾール = (5 - ベンゾイル - 1H - ベンゾイミダゾル - 2 - イル) カルバミン酸 (carbamimic acid) メチルエステル

(A6) オムファロチン (Omphalotin) = 国際公開第97/20857号に記載の真菌オムファロタス オレアリウス (Omphalotus olearius) の大環状発酵産物

20

(A7) アバメクチン = アベルメクチン B1

(A8) イベルメクチン = 22, 23 - ジヒドロアベルメクチン B1

(A9) モキシデクチン = 5 - O - デメチル - 28 - デオキシ - 25 - (1, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル) - 6, 28 - エポキシ - 23 - (メトキシイミノ) - ミルベマイシン B

(A10) ドラメクチン = 25 - シクロヘキシル - 5 - O - デメチル - 25 - デ (1 - メチルプロピル) - アベルメクチン A1a

30

(A11) ミルベメクチン = ミルベマイシン A3 と ミルベマイシン A4 の混合物

(A12) ミルベマイシンオキシム = ミルベメクチンの 5 - オキシム

【0120】

適切な忌避剤及び脱離剤の非限定的例：

(R1) DEET (N, N - ジエチル - m - トルアミド)

(R2) KBR 3023 N - ブチル - 2 - オキシカルボニル - (2 - ヒドロキシ) - ピペリジン

(R3) シミアゾール = N, - 2, 3 - ジヒドロ - 3 - メチル - 1, 3 - チアゾル - 2 - イリデン - 2, 4 - キシリデン。

40

【0121】

混合物中の前記相手は、この分野の専門家に最もよく知られている。大部分は、種々の版の Pesticide Manual, The British Crop Protection Council, London に記載されており、他は、種々の版の The Merck Index, Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA 又は特許文献に記載されている。したがって、以下のリストは、例として見出すことができる少数の箇所に限られる。

【0122】

(I) 2 - メチル - 2 - (メチルチオ) プロピオンアルデヒド - O - メチルカルバモイ

ルオキシム (アルジカルブ)、The Pesticide Manual, 11th

Ed. (1997), The British Crop Protection

50

Council, London, 26ページ;

(II) S - (3, 4 - ジヒドロ - 4 - オキソベンゾ[d] - [1, 2, 3] - トリアジン - 3 - イルメチル)O, O - ジメチル - ホスホロジチオアート (アジンホスメチル)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 67ページ;

(III) エチル - N - [2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチルベンゾフラン - 7 - イルオキシカルボニル - (メチル)アミノチオール] - N - イソプロピル - - アラニナート (ベンフラカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 96ページ; 10

(IV) 2 - メチルビフェニル - 3 - イルメチル - (Z) - (1RS) - シス - 3 - (2 - クロロ - 3, 3, 3 - トリフルオロプロパ - 1 - エニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシラート (ビフェントリン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 118ページ;

(V) 2 - tert - ブチルイミノ - 3 - イソプロピル - 5 - フェニル - 1, 3, 5 - チアジアジアン (thiadiazian) - 4 - オン (ブロフェジン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 157 ページ; 20

(VI) 2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチルベンゾフラン - 7 - イル - メチルカルバマート (カルボフラン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 186ページ;

(VII) 2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチルベンゾフラン - 7 - イル - (ジブチルアミノチオ)メチルカルバマート (カルボスルファン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 188ページ;

(VIII) S, S' - (2 - ジメチルアミノトリメチレン) - ビス (チオカルバマート) (カルタップ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 193ページ; 30

(IX) 1 - [3, 5 - ジクロロ - 4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ)フェニル] - 3 - (2, 6 - ジフルオロベンゾイル) - ウレア (クロルフルアズロン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 213ページ;

(X) O, O - ジエチル - O - 3, 5, 6 - トリクロロ - 2 - ピリジル - ホスホロチオアート (クロルピリホス)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 235ページ; 40

(XI) (RS) - - シアノ - 4 - フルオロ - 3 - フェノキシベンジル - (1RS, 3RS; 1RS, 3RS) - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - 2, 2 - ジ - メチルシクロプロパンカルボキシラート (シフルトリン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 293ページ;

(XII) (S) - - シアノ - 3 - フェノキシベンジル - (Z) - (1R, 3R) - 3 - (2 - クロロ - 3, 3, 3 - トリフルオロプロペニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシラートと (R) - - シアノ - 3 - フェノキシベンジル - (Z) - (1 50

R, 3R) - 3 - (2-クロロ-3,3,3-トリフルオロプロペニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート(ラムダ-シハロトリン)の混合物、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 300ページ;

(XIII)(S) - - シアノ-3-フェノキシベンジル-(Z) - (1R, 3R) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラートと(R) - - シアノ-3-フェノキシベンジル-(1S, 3S) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート(アルファーシペルメトリン)からなるラセミ体、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 308ページ; 10

(XIV)(S) - - シアノ-3-フェノキシベンジル(1RS, 3RS, -1RS, 3RS) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート(ゼータ-シペルメトリン)の立体異性体混合物、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 314ページ;

(XV)(S) - - シアノ-3-フェノキシベンジル-(1R, 3R) - 3 - (2, 2-ジプロモビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート(デルタメトリン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 344ページ; 20

(XVI)(4-クロロフェニル) - 3 - (2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア(ジフルベンズロン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 395ページ;

(XVII)(1, 4, 5, 6, 7, 7-ヘキサクロロ-8, 9, 10-トリノルボルナ-5-エン-2, 3-イルエンビスマチレン) - サルファイト(エンドスルファン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 459ページ; 30

(XVIII) - エチルチオ-ο-トリル-メチルカルバマート(エチオフェンカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 479ページ;

(XIX)O, O-ジメチル-O-4-ニトロ-m-トリル-ホスホロチオアート(フェニトロチオン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 514ページ;

(XX)2-sec-ブチルフェニル-メチルカルバマート(フェノブカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 516ページ; 40

(XXI)(RS) - - シアノ-3-フェノキシベンジル-(RS) - 2 - (4-クロロフェニル) - 3 - メチルブチラート(フェンバレラート)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 539ページ;

(XXII)S - [ホルミル(メチル)カルバモイルメチル] - O, O-ジメチル-ホスホジチオアート(ホルモチオン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 540ページ; 50

on Council, London, 625ページ;
 (XXXIII) 4-メチルチオ-3, 5-キシリル-メチルカルバマート(メチオカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 813ページ;
 (XXXIV) 7-クロロビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2, 6-ジエン-6-イル-ジメチルホスファート(ヘプテノホス)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 670ページ; 10
 (XXXV) 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン(イミダクロブリド)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 706ページ;
 (XXXVI) 2-イソプロピルフェニル-メチルカルバマート(イソプロカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 729ページ;
 (XXXVII) O, S-ジメチル-ホスホルアミドチオアート(メタミドホス)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 808ページ; 20
 (XXXVIII) S-メチル-N-(メチルカルバモイルオキシ)チオアセトイミダート(メトミル)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 815ページ;
 (XXXIX) メチル-3-(ジメトキシホスフィノイルオキシ)ブタ-2-エノアート(メビンホス)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 844ページ;
 (XXX) O, O-ジエチル-O-4-ニトロフェニル-ホスホロチオアート(パラチオン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 926ページ; 30
 (XXXI) O, O-ジメチル-O-4-ニトロフェニル-ホスホロチオアート(パラチオンメチル)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 928ページ;
 (XXXII) S-6-クロロ-2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-1, 3-ベンゾオキサゾル-3-イルメチル-O, O-ジエチル-ホスホロジチオアート(ホサロン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 963ページ; 40
 (XXXIII) 2-ジメチルアミノ-5, 6-ジメチルピリミジン-4-イル-ジメチルカルバマート(ピリミカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 985ページ;
 (XXXIV) 2-イソプロポキシフェニル-メチルカルバマート(プロポキスル)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1036ページ; 50

(XXXV) 1 - (3, 5 - ジクロロ - 2, 4 - ジフルオロフェニル) - 3 - (2, 6 - ジフルオロベンゾイル) ウレア (テフルベンズロン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1158ページ;

(XXXVI) S-tert-ブチルチオメチル-O, O-ジメチル-ホスホロジチオアート (テルブホス)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1165ページ;

(XXXVII) エチル - (3-tert-ブチル - 1-ジメチルカルバモイル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾル - 5 - イル - チオ) - アセタート、(トリアザメート)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1224ページ;

(XXXVIII) アバメクチン、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 3ページ;

(XXXIX) 2-sec-ブチルフェニル - メチルカルバマート (フェノブカルブ)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 516ページ;

(XL) N-tert-ブチル - N' - (4 - エチルベンゾイル) - 3, 5 - ジメチルベンゾヒドラジド (テブフェノジド)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1147ページ;

(XLI) (±) - 5 - アミノ - 1 - (2, 6 - ジクロロ - , , - トリフルオロ - p - トリル) - 4 - トリフルオロメチル - スルフィニルピラゾル - 3 - カルボニトリル (フィプロニル)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 545ページ;

(XLII) (RS) - - シアノ - 4 - フルオロ - 3 - フェノキシベンジル (1RS, 3RS; 1RS, 3RS) - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシラート (ベータ - シフルトリン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 295ページ;

(XLIII) (4 - エトキシフェニル) - [3 - (4 - フルオロ - 3 - フェノキシフェニル) プロピル] (ジメチル) シラン (シラフルオフェン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1105ページ;

(XLIV) tert-ブチル (E) - - (1, 3 - ジメチル - 5 - フェノキシピラゾル - 4 - イル - メチレンアミノ - オキシ) - p - トルアート (フェンピロキシメート)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 530ページ;

(XLV) 2-tert-ブチル - 5 - (4-tert-ブチルベンジルチオ) - 4 - クロロピリダジン - 3 (2H) - オン (ピリダベン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1161ページ;

(XLVI) 4 - [[4 - (1, 1 - ジメチルフェニル) フェニル] エトキシ] - キナゾリン (フェナザキン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Cou

10

20

30

40

50

ncil, London, 507ページ;

(XLVII) 4-フェノキシフェニル-(RS)-2-(ピリジルオキシ)プロピル-エーテル(ピリプロキシフェン)、The Pesticide Manual, 1th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1073ページ;

(XLVIII) 5-クロロ-N-[2-[4-(2-エトキシエチル)-2,3-ジメチルフェノキシ]エチル]-6-エチルピリミジン-4-アミン(ピリミジフェン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1070ページ;

(XLIX) (E)-N-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-エチル-N'-メチル-2-ニトロビニリデンジアミン(ニテンピラム)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 880ページ;

(L) (E)-N¹-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-N²-シアノ-N¹-メチルアセトアミジン(NI-25、アセタミブリド)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 9ページ;

(LI) アベルメクチンB₁、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 3ページ;

(LII) 昆虫に活性な植物抽出物、特に(2R, 6aS, 12aS)-1, 2, 6, 6a, 12, 12a-ヘキサヒドロ(hexhydro)-2-イソプロペニル-8, 9-ジメトキシ-クロメノ[3, 4-b]フロ[2, 3-h]クロメン-6-オン(ロテノン)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1097ページ、及びインドセンダンからの抽出物、特にアザジラクチン、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 59ページ; 並びに

(LIII) 昆虫に活性な線虫を含む調製物、好ましくはヘテロラブディティス バクテリオフォラ(Heterorhabditis bacteriophora)及びヘテロラブディティス メギディス(Heterorhabditis megidisi)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 671ページ、スタイナー-ネマ フエルチエ(Steinerinema feltiae)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1115ページ、及びスタイナー-ネマ スカブテリシ(Steinerinema scapterisci)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1116ページ;

(LIV) バチルス サブチリス(Bacillus subtilis)から得ることができる調製物、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 72ページ; 又はGC91若しくはNCTC11821から単離される化合物を除いたバチルス チューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)系統から得ることができる調製物; The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 73ページ;

10

20

30

40

50

(LV) 昆虫に活性な真菌を含む調製物、好ましくはバーティシリウム レカニ (*Verticillium lecanii*)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1266ページ; ボーベリア ブロンニアティ (*Beauveria brogniartii*)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 85ページ、及びボーベリア バッシアナ (*Beauveria bassiana*)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 83ページ;

10

(LVI) 昆虫に活性なウイルスを含む調製物、好ましくはマツノキハバチ (*Neodipridion Sertifer*) NPV、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1342ページ; ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 759ページ、及びコドリンガ (*Cydia pomonella*) グラニュローシスウイルス、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 291ページ;

20

(CLXXXI) 7 - クロロ - 2 , 3 , 4a , 5 - テトラヒドロ - 2 - [メトキシカルボニル (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - カルバモイル] インドル [1 , 2e] オキサゾリン - 4a - カルボキシラート (DPX - MP062、インドキサカルブ (Indoxycarb)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 453ページ;

(CLXXXII) N' - tert - プチル - N' - (3 , 5 -ジメチルベンゾイル) - 3 - メトキシ - 2 - メチルベンゾヒドラジド (RH - 2485、メトキシフェノジド)、The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, 1094ページ; 並びに

30

(CLXXXIII) (N' - [4 - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル] - ヒドラジンカルボン酸イソプロピルエステル (D 2341)、Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487 - 493;

(R2) Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, August 25 - 29 (1996), AGRO - 020. Publisher: American Chemical Society, Washington, D.C. CONEN: 63B FAF.

40

【0123】
上記詳細の結果として、本発明の更に本質的な態様は、式Iの化合物に加えて、同じ又は異なる活性領域を有する少なくとも1種類の更なる活性成分と、少なくとも1種類の生理的に許容される担体とを含むことを特徴とする、温血動物の寄生生物を防除する組合せ調製物に関する。本発明は、2要素の (two - fold) 組合せに限定されない。

【0124】

概して、本発明による組成物は、式I、Iaの活性成分又はその混合物0.1から99重量%、特に0.1から95重量%、界面活性剤0から25重量%、特に0.1から25重量%を含めて、固体又は液体の混合物99.9から1重量%、特に99.8から5重量%を含む。

【0125】

50

処置すべき動物への本発明による組成物は、局所的、経口的、非経口的又は皮下に適用することができる。該組成物は、溶液剤、乳濁液剤、懸濁液剤、(水薬)、散剤、錠剤、巨丸剤、カプセル剤及びポアオン製剤である。

【0126】

ポアオン又はスポットオン法は、動物の皮膚又は外被 (coat) の特定の場所に、有利には頸部又は背骨に式Iの化合物を適用するものである。これは、例えば、ポアオン又はスポットオン製剤のスワップ又はスプレーを外被の比較的小さい領域に適用することによってなされる。その領域から、活性物質は、製剤中の成分の延展性のために、また、動物の動きに助けられて、毛皮の広い領域全体にほぼ自動的に分散する。

【0127】

ポアオン又はスポットオン製剤は、適切には担体を含む。担体は、皮膚表面全体にわたって、又は宿主動物の外被において、迅速な分散を促進し、一般に延展油 (spreading oil) と考えられる。適切な担体は、例えば、油状溶液；2-オクチルドデカノール溶液、オレイルアルコール溶液などのアルコール溶液及びイソプロパノール溶液；ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ラウリン酸シウ酸エステル (lauric acid oxalate)、オレイン酸オレイルエステル、オレイン酸デシルエステル、ラウリン酸ヘキシル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、鎖長C₁₂-C₁₈の飽和脂肪アルコールのカプリン酸エステルなどのモノカルボン酸エステル溶液；フタル酸ジブチル、イソフタル酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソプロピルエステル、アジピン酸ジ-n-ブチルなどのジカルボン酸エステル溶液、又は脂肪族酸、例えば、グリコールのエステル溶液である。医薬品業界又は化粧品業界で公知である分散剤などの分散剤が更に存在することが有利であり得る。例は、2-ピロリドン、2-(N-アルキル)ピロリドン、アセトン、ポリエチレングリコール並びにそのエーテル及びエステル、プロピレングリコール又は合成トリグリセリドである。

【0128】

油状溶液としては、例えば、オリーブ油、落花生油、ゴマ油、パイン油、亜麻仁油、ヒマシ油などの植物油が挙げられる。植物油は、エポキシ化油としても存在し得る。パラフィン及びシリコーンオイルも使用することができる。

【0129】

ポアオン又はスポットオン製剤は、一般に、式Iの化合物1から20重量%、分散剤0.1から50重量%、及び溶媒45から98.9重量%を含む。

【0130】

ポアオン又はスポットオン法は、動物全部を経口的に、又は注射によって、処置することが困難である、又は時間のかかる、ウシ、ウマ、ヒツジ、ブタなどの群れをなす動物に使用するのに特に有利である。この方法は、単純であるので、個々の家庭内動物、すなわちペットを含めて、他の動物全部に使用できることは言うまでもなく、獣医師の専門家なしでも実施できることが多いので、動物の飼育者に大いに好まれる。

【0131】

市販品を濃縮物として処方することが好ましいが、エンドユーザーは、通常、希薄製剤を使用する。

【0132】

かかる組成物は、特別な効果を得るために、安定剤、消泡剤、粘度調節剤、結合剤、粘着付与剤などの更なる添加剤、及び他の活性成分を含むこともできる。

【0133】

エンドユーザーによって使用されるこのタイプの組成物も、本発明の構成要素を同様に形成する。

【0134】

本発明による有害生物防除方法の各々において、又は本発明による有害生物防除組成物の各々において、式Iの活性成分は、その立体配置の全部で、又はその混合物として使用することができる。

10

20

30

40

50

【0135】

本発明は、式の活性成分、又はそれから調製される活性成分製剤を、飼料若しくは飲料への添加剤として、又は固体若しくは液体剤形で、経口的に、注射によって、若しくは非経口的に、動物に投与することを特徴とする、温血動物、特に生産用家畜、家庭内動物及びペットを寄生性有害生物から予防的に保護する方法も含む。本発明は、前記方法の一つに使用される本発明による式Iの化合物も含む。

【0136】

以下の例は、本発明を単に説明するものにすぎず、本発明を限定するものではない。活性成分という用語は、表Iに記載の物質である。

【0137】

特に、好ましい製剤は以下のように構成される。

【0138】

(% = 重量パーセント)

処方例

1. 粒状体

【0139】

【表2】

	a)	b)
活性成分	5%	10%
カオリン	94%	-
高分散ケイ酸	1%	-
アタパルジヤイト	-	90%

活性成分を塩化メチレンに溶解させ、担体上に噴霧し、続いて溶媒を減圧蒸発によって濃縮する。この種の粒状体は、動物飼料と混合することができる。

【0140】

2. 粒状体

【0141】

【表3】

活性成分	3%
ポリエチレングリコール (mw200)	3%
カオリン	94%

(mw=分子量)

微粉碎活性成分を、混合機中で、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均等に塗布する。このようにして、無塵被覆顆粒剤が得られる。

【0142】

3. 錠剤又は巨丸剤

【0143】

【表4】

I	活性成分	33.00%
	メチルセルロース	0.80%
	ケイ酸、高分散	0.80%
	コーンスターク	8.40%
II	ラクトース、結晶	22.50%
	コーンスターク	17.00%
	微結晶性セルロース	16.50%
	ステアリン酸マグネシウム	1.00%

I メチルセルロースを水中で攪拌する。材料が膨潤後、ケイ酸を攪拌し、混合物を均一に懸濁させる。活性成分とコーンスタークを混合する。水性懸濁液をこの混合物にまぜ合わせ、混練する。生成したかたまりを12Mふるいに通して顆粒化し、乾燥させる。

II 全4種類の賦形剤を十分混合する。

10

20

30

40

50

I I I I 及び I I によって得られた予備混合物を混合し、錠剤又は巨丸剤に加圧成形する。

【0144】

4. 注射剤

A. 油状ビヒクル(徐放性)

【0145】

【表5】

1.	活性成分	0.1-1.0g	
	落花生油	100mLになるように	
2.	活性成分	0.1-1.0g	10
	ゴマ油	100mLになるように	

調製：活性成分を、攪拌しながら、必要に応じて軽く加熱しながら、油の一部に溶解させ、次いで冷却後、所望の体積とし、孔径0.22mmの適切なメンブランフィルターに通して無菌ろ過する。

【0146】

B. 水混和性溶媒(均一放出(average rate of release))

【0147】

【表6】

活性成分	0.1-1.0g	
4-ヒドロキシメチル-1,3-ジオキソラン (グリセロールホルマール)	40g	20
1,2-プロパンジオール	100mLになるように	
活性成分	0.1-1.0g	
グリセロールジメチルケタール	40g	
1,2-プロパンジオール	100mLになるように	

調製：活性成分を、攪拌しながら、溶媒の一部に溶解させ、所望の体積とし、孔径0.22mmの適切なメンブランフィルターに通して無菌ろ過する。

【0148】

C. 水溶液可溶化剤(solubilisate)(急速放出)

【0149】

1. 活性成分	0.1-1.0g	
ポリエトキシル化されたヒマシ油(40エチレンオキシド単位)	10g	
1,2-プロパンジオール	20g	
ベンジルアルコール	1g	
注射用水	100mLになるよう に	
2. 活性成分	0.1-1.0g	
ポリエトキシル化されたソルビタンモノオレアート(20エチレ ンオキシド単位)	8g	40
1,2-プロパンジオール	20g	
ベンジルアルコール	1g	
注射用水	100mLになるよう に	

調製：活性成分を溶媒及び界面活性剤に溶解させ、水で所望の体積にする。孔径0.22mmの適切なメンブランフィルターに通して無菌ろ過。

【0150】

5. ポアオン

【0151】

【表8】

A.	活性成分 ミリスチン酸イソプロピル イソプロパノール	5g 10g 100mL になる ように	
B	活性成分 ラウリンヘキシル 中鎖トリグリセリド エタノール	2g 5g 15g 100mL になる ように	10
C.	活性成分 オレイン酸オレイル N-メチル-ピロリドン イソプロパノール	2g 5g 40g 100mL になる ように	

水系は、経口及び／又はルーメン内適用にも好ましく使用することができる。

【0152】

組成物は、特別な効果を得るために、安定剤、例えば、必要に応じてエポキシ化植物油（エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又はダイズ油）；消泡剤、例えば、シリコーンオイル、防腐剤、粘度調節剤、結合剤、粘着付与剤、肥料などの更なる添加剤、又は他の活性成分を含むこともできる。

20

【0153】

式Iの化合物に対して中性であり、処置すべき宿主動物に対して有害な効果を持たない、更なる生物活性物質又は添加剤、並びに無機塩又はビタミンを上記組成物に添加することもできる。

30

【0154】

以下の実施例は、本発明を説明するものであって、本発明を限定するものではない。文字「h」は時間を表す。

【0155】

調製実施例

【実施例1】

【0156】

2-[1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-1H-インドール-3-イル]-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オール

a) テトラヒドロフラン40m1で1H-インドール10gを溶解し、-60に冷却し、トリフルオロ酢酸無水物15.4m1で処理する。混合物を室温に加温すると、沈殿が形成される。結晶性固体をろ別し、水で洗浄し、減圧乾燥させて、2,2,2-トリフルオロ-1-(1H-インドール-3-イル)-エタノンを得る。これは、更に精製せずに使用することができる。

40

【0157】

b) 無水N,N-ジメチルホルムアミド150m1で2,2,2-トリフルオロ-1-(1H-インドール-3-イル)-エタノン16.8gを溶解させ、次いで無水炭酸カリウム12.7gを添加する。次いで、3,5-ジクロロ-4-フルオロベンゾトリフルオリド22gを一括添加する。生成した懸濁液を90で3時間攪拌する。溶媒を減圧除去後、生成した残渣をジエチルエーテル300m1に懸濁させ、懸濁液を水で洗浄し、水相をジエチルエーテルで2回抽出し、混合有機相を減圧蒸発させて、1-[1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドール-3-イル]-2,2,2-トリフルオロエタノンを得る。これは、更に精製せずに使用することができる。

50

【0158】

c) 無水ジエチルエーテル500m1で1-[1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドール-3-イル]-2,2,2-トリフルオロエタノン33.5gを溶解させる。反応温度を-10に維持しながら、臭化メチルマグネシウム溶液(3モル、ジエチルエーテル溶液)52.5m1を徐々に添加する。混合物を20まで加温し、2時間攪拌する。次いで、反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液で処理し、有機層を分離する。水相をジエチルエーテルで抽出し、混合有機相を硫酸マグネシウムを用いて脱水する。溶媒蒸発後、残渣をフラッシュクロマトグラフィーによって酢酸エチル/ヘキサン(1:9)を用いて精製する。

【0159】

d) 必要に応じて、上記化合物の2種類の鏡像異性体を、以下のHPLC手順によって分離することができる。ラセミ体の10mg/mLヘキサン/イソプロパノール(97:3)溶液をDaiice1 CHIRAL PACK(登録商標)AD-Hカラムに注入する。ヘキサン/イソプロパノール(97:3)で溶出させると、9分後に溶出する画分中に第1の濃縮鏡像異性体(ee=97%)が得られ、11分後に溶出する画分中に第2の純粹な鏡像異性体(ee>97%)が得られる。

【実施例2】

【0160】

2-[1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドール-3-イル]-1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロプロパン-2-オール

a) ヘキサフルオロアセトン1m1に1H-インドール100mgを懸濁させ、90に1時間加熱する。反応終了後、過剰の溶媒を減圧除去して、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-(1H-インドール-3-イル)-プロパン-2-オールを得る。これを更に精製せずに更に反応させる。

【0161】

b) N,N-ジメチルホルムアミド1m1に、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-(1H-インドール-3-イル)-プロパン-2-オール88.2mgを窒素雰囲気下で溶解させる。次いで、N,N-ジメチルホルムアミド1m1に溶解させた3,5-ジクロロ-4-フルオロベンゾトリフルオリド86.6mgを添加し、続いて炭酸カリウム50.9mgを添加する。混合物を90で2時間加熱する。室温に冷却後、水/ジクロロメタン(1:1)2m1を添加し、混合物を30分間攪拌し、次いでISOLUTE(登録商標)HM-Nを充填したフィルターカートリッジに注ぐ。カートリッジをジクロロメタン20m1で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18-ODS APカラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーにかけ、水/ギ酸(10,000:1)からアセトニトリル/ギ酸(10,000:1)の勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

【実施例3】

【0162】

2-[1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドール-3-イル]-1,1-ジフルオロ-1-クロロプロパン-2-オール

a) ジクロロメタン3m1に1H-インドール300mgを溶解させ、0に冷却する。次いで、塩化ジエチルアルミニウム(1.8Mトルエン溶液)2.82m1を添加し、混合物を0で30分間攪拌する。最後に、反応温度を0に維持しながら、ジクロロメタン4m1に溶解させたジフルオロクロロ酢酸塩化物705mgを徐々に添加する。混合物を0で2.5時間攪拌し、次いで同じ温度で水でクエンチし、最後に分離漏斗に移し、中和し、炭酸水素ナトリウム飽和溶液、水及び塩水で抽出する。有機相を硫酸ナトリウムを用いて脱水する。ろ過後、有機相を減圧濃縮し、中間生成物2,2-ジフルオロ-2-クロロ-1-(1H-インドール-3-イル)-エタノンを沈殿させる。溶媒除去後、2,2-ジフルオロ-2-クロロ-1-(1H-インドール-3-イル)-エタノンを単離し、更に精製せずに使用する。

10

20

30

40

50

【0163】

b) N, N-ジメチルホルムアミド 1 m l に 2, 2-ジフルオロ-2-クロロ-1-(1H-インドル-3-イル)-エタノン 200 mg を窒素雰囲気下で溶解させる。次いで、N, N-ジメチルホルムアミド 7 m l に溶解させた 3, 5-ジクロロ-4-フルオロベンゾトリフルオリド 287 mg を添加し、続いて炭酸カリウム 121 mg を添加する。混合物を 80 で 12 時間加熱する。室温に冷却後、水 / ジクロロメタン (1 : 1) 5 m l を添加し、混合物を 30 分間攪拌し、次いで ISOLUTE (登録商標) HM-N を充填したフィルター カートリッジに注ぐ。カートリッジをジクロロメタン 100 m l で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18-ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーにかけ、水 / ギ酸 (10, 000 : 1) からアセトニトリル / ギ酸 (10, 000 : 1) の勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して、中間生成物 1-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドル-3-イル]-2, 2-ジフルオロ-2-クロロエタノンを単離する。

10

【0164】

c) 無水ジエチルエーテル 2 m l に 1-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドル-3-イル]-2, 2-ジフルオロ-2-クロロエタノン 87.5 mg を溶解させる。次いで、反応温度を -10 に維持しながら、臭化メチルマグネシウム溶液 (3 M、ジエチルエーテル溶液) 132 μ l を徐々に添加する。混合物を攪拌しながら 20 に 0.5 時間加温し、次いで飽和塩化アンモニウム溶液で処理する。有機層を分離し、水相をジエチルエーテルで抽出し、最後に混合有機相を硫酸マグネシウムを用いて脱水する。溶媒除去後、残渣をカラムクロマトグラフィーにかけ、酢酸エチル / ヘキサン勾配によって精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

20

【実施例 4】

【0165】

酢酸 1-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドル-3-イル]-2, 2-トリフルオロ-1-メチル-エチルエステル

ジクロロメタン 2 m l に酢酸 27.2 mg を溶解させ、次いでジシクロヘキシルカルボジイミド 103.7 mg、及び触媒作用量の 4-ジメチルアミノピリジンを添加する。生成した懸濁液を 30 分間攪拌し、2-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-1H-インドル-3-イル]-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オール 100 mg の 1 m l ジクロロメタン溶液を添加し、混合物を 48 時間攪拌する。水及びジクロロメタンでクエンチ後、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM-N を含むカートリッジによって混合物をろ過する。ISOLUTE (登録商標) HM-N を含むカートリッジをジクロロメタン 45 m l で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18-ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーにかけ、水 / ギ酸 (10, 000 : 1) からアセトニトリル / ギ酸 (10, 000 : 1) の勾配で残渣を精製して、標記化合物を得る。

30

【実施例 5】

【0166】

ヘキサン酸 1-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドル-3-イル]-2, 2-トリフルオロ-1-メチル-エチルエステル

ジクロロメタン / N, N-ジメチルホルムアミド (2 : 1, v / v) の混合物 0.5 m l に、2-[1-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-1H-インドル-3-イル]-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オール 100 mg を溶解させ、水素化ナトリウム 5.7 mg で処理する。混合物を 15 分間反応させる。次いで、ジクロロメタン 0.5 m l に溶解させたヘキサン酸塩化物 37.7 mg、続いてジクロロメタン 0.5 m l を添加し、22 時間攪拌する。混合物を水及びジクロロメタンでクエンチし、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM-N を含むカートリッジによってろ過する。ISOLUTE (登録商標) HM-N を含むカートリッジをジクロロメタン 45 m l で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18-ODS AP カラムを備えた

40

50

分取逆相クロマトグラフィーによって水 / ギ酸 (10,000:1) からアセトニトリル / ギ酸 (10,000:1) の勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

【実施例 6】

【0167】

1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 3 - (2,2,2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - メチル - エチル) - 1 H - インドール

ジクロロメタン / N, N - ジメチルホルムアミド (2:1, v/v) の混合物 0.5 ml に、2 - [1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オール 100 mg を溶解させ、水素化ナトリウム 8.6 mg で処理し、30 分間攪拌する。次いで、ヨウ化メチル 2.1 μl を徐々に添加し、混合物を 1 時間攪拌する。反応混合物を水でクエンチし、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジによってろ過する。ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジをジクロロメタン 20 ml で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18 - ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーによって水 / ギ酸 (10,000:1) からアセトニトリル / ギ酸 (10,000:1) の勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

10

【実施例 7】

【0168】

4 - {1 - [1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エトキシメチル} - ベンゾニトリル

ジクロロメタン / N, N - ジメチルホルムアミド (2:1, v/v) の混合物 0.5 ml に、2 - [1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オール 80 mg を溶解させ、水素化ナトリウム 6.9 mg 及びヨウ化カリウム 30 mg で処理し、40 分間攪拌する。次いで、ジクロロメタン 0.5 ml に溶解させた 4 - シアノベンジルプロマイド 54.2 mg を徐々に添加し、混合物を室温で 3 時間攪拌し、続いて 36 h で 12 時間攪拌する。反応混合物を水でクエンチし、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジをジクロロメタン 60 ml で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18 - ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーによって水 / ギ酸 (10,000:1) からアセトニトリル / ギ酸 (10,000:1) の勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

20

30

【実施例 8】

【0169】

炭酸 1 - [1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - インドル - 3 - イル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エチルエステルイソプロピルエステル

N, N - ジメチルホルムアミド 1.5 ml に、2 - [1 - (2,6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - フルオロ - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1, 1, 1 - トリフルオロ - プロパン - 2 - オール 150 mg を溶解させ、固体水素化ナトリウム 8 mg を添加する。反応混合物を室温で 15 分間攪拌する。次いで、クロロギ酸イソプロピル (1 M トルエン溶液) 391 μl を添加し、生成した混合物を 16 時間攪拌する。その後、追加のクロロギ酸イソプロピル 391 μl を添加し、16 時間攪拌し続ける。最後に、反応混合物を水でクエンチし、ジクロロメタンで希釈する。混合物を、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジをジクロロメタン 20 ml で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18 - ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーにかけ、水からアセトニトリルの勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記

40

50

化合物を単離する。

【実施例 9】

【0170】

ヘキシリカルバミン酸 1 - [1 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エチルエステル

N , N - ジメチルホルムアミド 1 m l に 2 - [1 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オール 100 m g を溶解させ、反応物 (reaction) を室温に維持しながら、ヘキシリソシアナート 32.2 m g を添加する。反応物を 4 時間攪拌し、次いで塩化銅 (I) 2.5 m g を添加する。更に 18 時間攪拌後、反応混合物を 0 に冷却し、水でクエンチし、ジクロロメタンで希釈し、シリカゲル及び ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジによってろ過する。ISOLUTE (登録商標) HM - N を含むカートリッジをジクロロメタン 25 m l で洗浄する。溶媒を除去し、ヘキサンから再結晶させて、標記化合物を得る。

10

【実施例 10】

【0171】

2 - [1 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチルピリド - 2 - イル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オール

a) 無水ジエチルエーテル 50 m l に 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - (1 H - インドル - 3 - イル) - エタノン 5 g を溶解させる。反応温度を -10 に維持しながら、臭化メチルマグネシウム溶液 (3 モル、ジエチルエーテル溶液) 15.6 m l を徐々に添加する。混合物を 20 まで加温し、2 時間攪拌する。次いで、反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液で処理し、有機層を分離する。水相をジエチルエーテルで抽出し、混合有機相を硫酸マグネシウムを用いて脱水する。有機相を減圧蒸発させて、1 , 1 , 1 - トリフルオロ - 2 - (1 H - インドル - 3 - イル) - プロパン - 2 - オールを得る。これを更に精製せずに使用する。

20

【0172】

b) 無水 N , N - ジメチルホルムアミド 4 m l で 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - 2 - (1 H - インドル - 3 - イル) - プロパン - 2 - オール 160 m g を溶解させ、次いで無水炭酸カリウム 111 m g を添加する。次いで、2 , 3 - ジクロロ - 5 - トリフルオロメチルピリジン 174 m g を一括添加する。生成した懸濁液を 90 で 5 時間攪拌する。室温に冷却後、水 / ジクロロメタン (1 : 1) 5 m l を添加し、混合物を 30 分間攪拌し、次いで ISOLUTE (登録商標) HM - N を充填したフィルターカートリッジに注ぐ。カートリッジをジクロロメタン 50 m l で洗浄する。溶媒除去後、Daisogel C18 - ODS AP カラムを備えた分取逆相クロマトグラフィーにかけ、水からアセトニトリルの勾配で残渣を精製する。溶媒を除去して標記化合物を単離する。

30

【実施例 11】

【0173】

2 - [1 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - インドル - 3 - イル] - 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - ブタン - 2 - オール :

40

a) 無水 N , N - ジメチルホルムアミド 6 m l に インドール 500 m g を溶解させ、次いで無水炭酸カリウム 708 m g を添加する。次いで、3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロベンゾトリフルオリド 1.19 g を一括添加する。生成した懸濁液を 90 で 18 時間攪拌する。室温に冷却後、混合物を濃縮し、次いで水と酢酸エチルに分離する。有機相を脱水し、濃縮して、次の段階に使用するのに十分純粋な粗製 1 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - インドールを得る。

【0174】

b) -78 に冷却した 1 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - インドール 300 m g の 4 m l THF 溶液に、NBS 210 m g を添加す

50

る。反応混合物を -78 ℃ で 2 時間攪拌し、次いで室温に加温する。ヘキサン 3 mL 及びピリジン 0.05 mL を添加し、生成した懸濁液をろ過する。ろ液を濃縮し、カラムクロマトグラフィーにかけ、酢酸エチル/ヘキサン勾配によって精製し、溶媒除去後に 3-ブロモ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドールを得る。

【0175】

c) -78 ℃ に冷却した 3-ブロモ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-インドール 50 mg の 0.5 mL THF 溶液に、nBuLi 1.6 M ヘキサン溶液 0.18 mL を滴下する。溶液を -78 ℃ で 15 分間攪拌し、トリフルオロ(trifluoro)メチルエタノン 30 μL を添加する。混合物を -78 ℃ で更に 1 時間攪拌し、次いで徐々に室温に加温する。飽和(saturated) NH₄Cl 溶液を添加し、混合物をエーテルで抽出する。有機相を脱水し、濃縮する。残渣をカラムクロマトグラフィーにかけ、酢酸エチル/ヘキサン勾配によって精製して、標記化合物を得る。

10

【0176】

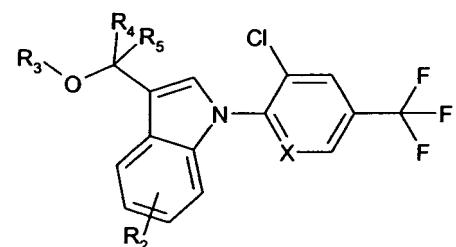
下表に列挙する物質も、上記方法と同様に調製することができる。融点の値は 単位である。「c-C₃H₅」という用語はシクロプロピル基を表す。

【0177】

表 1

【表 9】

20



番号	X	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	融点 [°C]
1.1	CCl	H	H	CH ₃	H	ワックス
1.2	CCl	H	H	CClF ₂	Me	油
1.3	CCl	H	H	CF ₂ CF ₃	Me	ワックス
1.4	CCl	H	C(O)-(2,6-Cl ₂ -Ph)	CF ₃	Me	66-68
1.5	CCl	H	C(O)-(4-CN-Ph)	CF ₃	Me	84-96
1.6	CCl	H	C(O)-2-チエニル	CF ₃	Me	油
1.7	CCl	H	C(O)-4-ビペロニル	CF ₃	Me	99-101
1.8	CCl	H	C(O)C(Me) ₂ OC(O) Me	CF ₃	Me	144-146
1.9	CCl	H	C(O)CH ₂ CH ₂ Ph	CF ₃	Me	ワックス
1.10	CCl	H	C(O)CH ₂ CH ₂ Me	CF ₃	Me	油
1.11	CCl	H	C(O)CMe ₃	CF ₃	Me	油
1.12	CCl	H	C(O)-シクロペンチル	CF ₃	Me	油
1.13	CCl	H	C(O)Me	CF ₃	Me	138-140
1.14	CCl	H	C(O)Me	CF ₃	Me	60-64
1.15	CCl	H	C(O)-n-C ₅ H ₁₁	CF ₃	Me	油
1.16	CCl	H	C(O)NH-(3,4-Cl ₂ -Ph)	CF ₃	Me	ワックス
1.17	CCl	H	C(O)NH-(4-Cl-Ph)	CF ₃	Me	144-156
1.18	CCl	H	C(O)NH-(4-F-Ph)	CF ₃	Me	ワックス
1.19	CCl	H	C(O)NH-(4-NMe ₂ -Ph)	CF ₃	Me	ワックス
1.20	CCl	H	C(O)NH-(4-OCF ₃ -Ph)	CF ₃	Me	147-153
1.21	CCl	H	C(O)NH-(4-OCH ₃ -Ph)	CF ₃	Me	ワックス
1.22	CCl	H	C(O)NHCHMe ₂	CF ₃	Me	123-131
1.23	CCl	H	C(O)NHCMe ₃	CF ₃	Me	60-70
1.24	CCl	H	C(O)NHEt	CF ₃	Me	165-170
1.25	CCl	H	C(O)NH-n-C ₆ H ₁₃	CF ₃	Me	130-134
1.26	CCl	H	C(O)OCH(CH ₃) ₂	CF ₃	Me	130-135
1.27	CCl	H	C(O)OCH=CCl ₂	CF ₃	Me	158-160
1.28	CCl	H	C(O)OCH ₂ C≡CH	CF ₃	Me	ワックス
1.29	CCl	H	C(O)OCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	Me	ワックス
1.30	CCl	H	C(O)OCH ₂ Ph	CF ₃	Me	ワックス
1.31	CCl	H	C(O)OCHMe ₂	CF ₃	Me	油
1.32	CCl	4-F	C(O)OEt	CF ₃	Me	油
1.33	CCl	H	C(O)OEt	CF ₃	Me	油
1.34	CCl	H	C(O)OEt	CF ₃	H	油
1.35	CCl	H	C(O)Ph	CF ₃	Me	136-138
1.36	CCl	H	C(S)NH=(4-CF ₃ -Ph))	CF ₃	Me	
1.37	CCl	H	C(S)NH-(4-F-Ph)	CF ₃	Me	
1.38	CCl	H	C(S)NHMe	CF ₃	Me	43-52
1.39	CCl	H	CH ₂ -(2-Cl-Ph)	CF ₃	Me	127-135
1.40	CCl	H	CH ₂ -(4-CF ₃ -Ph)	CF ₃	Me	油
1.41	CCl	H	CH ₂ -(4-CN-Ph)	CF ₃	Me	124-130
1.42	CCl	H	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	Me	油
1.43	CCl	H	CH ₂ -c-C ₃ H ₅	CF ₃	Me	油
1.44	CCl	4-F	CH ₂ OCH ₂ Ph	CF ₃	Me	油
1.45	CCl	4-F	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	Me	油

10

20

30

40

1.46	CCl	H	CH ₂ Ph	CF ₃	Me	131-138
1.47	CCl	H	H	CF ₃	2-イソブレニル	160-162
1.48	CCl	H	H	CF ₃	c≡CH	ワックス
1.49	CCl	H	H	CF ₃	CF ₃	126-128
1.50	N	H	H	CF ₃	CF ₃	油
1.51	CCl	4-F	H	CF ₃	CF ₃	128-130
1.52	CCl	H	H	CF ₃	CH(Me) ₂	109-111
1.53	CCl	H	H	CF ₃	CH=CH ₂	93-95
1.54	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ CHMe ₂	
1.55	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ Ph	ワックス
1.56	CCl	H	H	CF ₃	COOMe	油
1.57	CCl	H	H	CF ₃	シクロペンチル	
1.58	CCl	H	H	CF ₃	Et	ワックス
1.59	CCl	H	H	CF ₃	Me	113-116
1.60	N	H	H	CF ₃	Me	108-114
1.61	CCl	H	H	CF ₃	Me	ワックス
1.62	CH	7-Me	H	CF ₃	Me	ワックス
1.63	CCl	7-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.64	CCl	7-Cl	H	CF ₃	Me	ワックス
1.65	CCl	7-OMe	H	CF ₃	Me	ワックス
1.66	CCl	6-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.67	CCl	6-CF ₃	H	CF ₃	Me	ワックス
1.68	CCl	6-Cl	H	CF ₃	Me	54-56
1.69	CCl	6-OMe	H	CF ₃	Me	162-164
1.70	CCl	6-Me	H	CF ₃	Me	144-146
1.71	CCl	5-OMe	H	CF ₃	Me	135-137
1.72	CCl	5-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	140-142
1.73	CCl	5-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.74	CCl	5-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.75	CCl	5-COOMe	H	CF ₃	Me	95-98
1.76	CCl	5-Cl	H	CF ₃	Me	ワックス
1.77	CCl	5-CN	H	CF ₃	Me	75-78
1.78	CCl	5-Me	H	CF ₃	Me	ワックス
1.79	CCl	4-OMe	H	CF ₃	Me	128-130
1.80	CCl	4-Me	H	CF ₃	Me	ワックス
1.81	CCl	4-F	H	CF ₃	Me	92-94
1.82	CCl	4-Cl	H	CF ₃	Me	ワックス
1.83	CCl	4-Br	H	CF ₃	Me	ワックス
1.84	CCl	H	H	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇	
1.85	CCl	H	H	CF ₃	Ph	173-175
1.86	CCl	H	Me	CF ₃	Me	170-174
1.87	CCl	H	n-Bu	CF ₃	Me	油
1.88	CCl	H	n-Pr	CF ₃	Me	油
1.89	CCl	H	H	CHF ₂	Me	ワックス
1.90	CCl	H	H	CHCl ₂	Me	
1.91	CCl	H	H	CF ₃	4-ビペロニル	
1.92	CCl	H	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	145-147
1.93	CCl	H	H	CF ₃	CHPr ₂	ワックス
1.94	CCl	H	H	CF ₃	H	ワックス

10

20

30

40

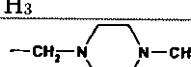
1.95	CCl	H	H	CF ₃	Me	油
1.96	CCl	H	H	CF ₃	Ph	
1.97	CCl	4-COOMe	H	CF ₃	Me	
1.98	CCl	6-COOMe	H	CF ₃	Me	193-195
1.99	CCl	7-COOMe	H	CF ₃	Me	ワックス
1.100	CCl	5-Br	H	CF ₃	Me	41-46
1.101	CCl	6-Br	H	CF ₃	Me	69-72
1.102	CCl	7-Br	H	CF ₃	Me	
1.103	CCl	5,6(-OCH ₂ O-)	H	CF ₃	Me	179-181
1.104	CCl	4-Me,5-OMe	H	CF ₃	Me	166-168
1.105	CCl	5-OCH ₂ Ph, 6-OMe	H	CF ₃	Me	160-162
1.106	CCl	4-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
1.107	CCl	6-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	ワックス
1.108	CCl	7-Et	H	CF ₃	Me	ワックス
1.109	CCl	6-CN	H	CF ₃	Me	207-209
1.110	CCl	4-CN	H	CF ₃	Me	187-189
1.111	CCl	5,6-ジ-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.112	CCl	4,6-ジ-F	H	CF ₃	Me	74-76
1.113	CCl	4,5,6,7-テトラ-F	H	CF ₃	Me	
1.114	CCl	H	H	CF ₃	CO ₂ H	43-45
1.115	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ OH	油
1.116	CCl	4-F	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃	Me	油
1.117	CCl	4-F	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CF ₃	Me	油
1.118	CCl	4-F	CH ₂ O(4-Cl-Ph)	CF ₃	Me	油
1.119	CCl	H	H	COOEt	COOEt	84-86
1.120	CCl	H	H	Me	H	ワックス
1.121	CCl	H	Et	Me	H	油
1.122	CCl	7-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.123	CCl	7-CN	H	CF ₃	Me	
1.124	CCl	6-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.125	CCl	7-OH	H	CF ₃	Me	
1.126	CCl	7-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.127	CCl	6-OH	H	CF ₃	Me	193-196
1.128	CCl	6-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.129	CCl	5-OH	H	CF ₃	Me	61-63
1.130	CCl	5-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.131	CCl	4-OH	H	CF ₃	Me	80-86
1.132	CCl	4-NH ₂	H	CF ₃	Me	ワックス
1.133	N	4-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.134	N	7-Me	H	CF ₃	Me	
1.135	N	7-F	H	CF ₃	Me	
1.136	N	7-Cl	H	CF ₃	Me	
1.137	N	7-OMe	H	CF ₃	Me	
1.138	N	6-F	H	CF ₃	Me	109-112
1.139	N	6-CF ₃	H	CF ₃	Me	
1.140	N	6-Cl	H	CF ₃	Me	
1.141	N	6-OMe	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

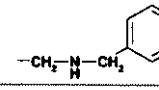
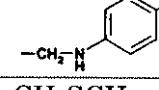
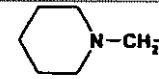
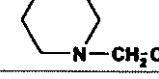
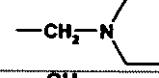
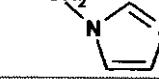
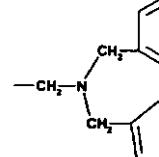
1.142	N	6-Me	H	CF ₃	Me	
1.143	N	5-OMe	H	CF ₃	Me	
1.144	N	5-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
1.145	N	5-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.146	N	5-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.147	N	5-COOMe	H	CF ₃	Me	
1.148	N	5-Cl	H	CF ₃	Me	
1.149	N	5-CN	H	CF ₃	Me	
1.150	N	5-Me	H	CF ₃	Me	
1.151	N	4-OMe	H	CF ₃	Me	
1.152	N	4-Me	H	CF ₃	Me	
1.153	N	4-F	H	CF ₃	Me	ワックス
1.154	N	4-Cl	H	CF ₃	Me	
1.155	N	4-Br	H	CF ₃	Me	
1.156	N	4-COOMe	H	CF ₃	Me	
1.157	N	6-COOMe	H	CF ₃	Me	
1.158	N	7-COOMe	H	CF ₃	Me	
1.159	N	5-Br	H	CF ₃	Me	
1.160	N	6-Br	H	CF ₃	Me	
1.161	N	7-Br	H	CF ₃	Me	
1.162	CH	5,6(·OCH ₂ O·) [·]	H	CF ₃	Me	
1.163	N	4-Me,5-OMe	H	CF ₃	Me	
1.164	N	5-OCH ₂ Ph, 6-OMe	H	CF ₃	Me	
1.165	N	4-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
1.166	N	6-OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
1.167	N	7-Et	H	CF ₃	Me	
1.168	N	6-CN	H	CF ₃	Me	
1.169	N	4-CN	H	CF ₃	Me	
1.170	N	5,6-ジ-F	H	CF ₃	Me	
1.171	N	4,6-ジ-F	H	CF ₃	Me	
1.172	N	4,5,6,7-テトラ-F	H	CF ₃	Me	
1.173	N	7-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.174	N	7-CN	H	CF ₃	Me	
1.175	N	6-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.176	N	7-OH	H	CF ₃	Me	
1.177	N	7-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.178	N	6-OH	H	CF ₃	Me	
1.179	N	6-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.180	N	5-OH	H	CF ₃	Me	
1.181	N	5-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.182	N	4-OH	H	CF ₃	Me	
1.183	N	4-NH ₂	H	CF ₃	Me	
1.184	N	4-NO ₂	H	CF ₃	Me	
1.185	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ NH(CH ₂) ₂ OC H ₃	油
1.186	CCl	H	H	CF ₃		149-152

10

20

30

40

1.187	CCl	H	H	CF ₃		油
1.188	CCl	4-CH ₂ OH	H	CF ₃	Me	油
1.189	CCl	H	H	CF ₃		油
1.190	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ SCH ₃	油
1.191	CCl	H	H	CF ₃	C(O)CH ₂ OCH ₂ COO _H	68-70
1.192	CCl	H	H	CF ₃		175-176
1.193	CCl	H	H	CF ₃		油
1.194	CCl	4-C(CH ₃) ₂ O _H	H	CF ₃	Me	157-161
1.195	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	120-122
1.196	CCl	H	H	CH(CH ₃) ₂	CN	123-125
1.197	CCl	H	H	CH ₃	CN	165-167
1.198	CCl	H	Si(CH ₃) ₃	CH ₃	CN	128-130
1.199	CCl	H	Si(CH ₃) ₃	CH(CH ₃) ₂	CN	127-129
1.200	CCl	H	Si(CH ₃) ₃	CF ₃	CN	138-140
1.201	CCl	H	H	CF ₃		154-156
1.202	CCl	H	H	CF ₃		248-250
1.203	CCl	H	H	CF ₃		160-162
1.204	CCl	5-F	H	CF ₃	CF ₃	117-118
1.205	CCl	7-F	H	CF ₃	CF ₃	80-92
1.206	CCl	6-F	H	CF ₃	CF ₃	124-126
1.207	CCl	6-F	H	CF ₃	CH=CH ₂	ワックス
1.208	CCl	H	H	Me	2-チアゾイル	143-145
1.209	CCl	H	Me	Me	CHMe ₂	84-86
1.210	CCl	H	H	CF ₃	CH ₂ Cl	ワックス
1.211	CCl	5,6-ジ-OMe	H	CF ₃	Me	178-180
1.212	CCl	5-F,6-Cl	H	CF ₃	Me	ワックス
1.213	CCl	5-Cl,6-OMe	H	CF ₃	Me	182-184
1.214	CCl	5,6-ジ-Cl	H	CF ₃	Me	62-65
1.215	CCl	5-OH,6-OMe	H	CF ₃	Me	149-151
1.216	CCl	4-F	H	CF ₃	CH=CH ₂	ワックス
1.217	CCl	5-F	H	CF ₃	CH=CH ₂	ワックス
1.218	CCl	7-Me	H	CF ₃	CH=CH ₂	ワックス
1.219	CCl	4-F	H	CF ₃	C≡CH	103-105

10

20

30

40

1.220	CCl	5-F	H	CF ₃	C≡CH	ワックス
1.221	CCl	6-F	H	CF ₃	C≡CH	139-141
1.222	CCl	7-Me	H	CHF ₂	C≡CH	135-137
1.223	N	H	H	CHF ₂	Me	100-102
1.224	N	H	H	CHF ₂	CH=CH ₂	油
1.225	N	H	H	CHF ₂	C≡CH	123-125
1.226	CCl	H	H	CHF ₂	CH=CH ₂	
1.227	CCl	H	H	CHF ₂	C≡CH	
1.228	CCl	4F7-Me	H	CF ₃	Me	ワックス
1.229	CCl	5F,7	H	H	Me	油
1.230	CCl	6F,7	H	H	Me	119-121
1.231	CCl	5-I	H	H	Me	油
1.232	CCl	4-NO ₂	H	H	CO ₂ Me	83-85
1.233	CCl	4-CO ₂ H	H	H	Me	177-179
1.234	CCl	H	H	H	シクロプロピル	油
1.235	CCl	H	H	H	2-チエニル	油
1.236	CCl	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OH	116-118
1.237	CCl	4,6-ジ-F	H	H	CH(OH)CH ₃	ワックス
1.238	CCl	4,6-ジ-F	H	H	CH=CH ₂	油
1.239	CCl	H	H	H	C≡CH	油
1.240	CCl	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	154-156
1.241	CCl	5-Cl,7-Me	H	H	4-CF ₃ -Ph	48-50
1.242	CCl	4,6-ジ-Cl	H	H	Me	159-160
1.243	CCl	H	H	H	Me	66-68
1.244	CNO ₂	H	H	H	Me	油
1.245	CCO ₂ Me	H	H	H	Me	ワックス
1.246	CCl	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	油
1.247	CNH ₂	H	H	H	Me	ワックス
1.248	CCO ₂ H	H	H	H	Me	ワックス
1.249	CCONH ₂	H	H	H	Me	ワックス
1.250	CCN	H	H	H	Me	ワックス
1.251	CCl	H	H	H	CH=CHMe	油
1.252	CCl	H	H	H	C≡CPh	油
1.253	CCl	H	H	H	C≡シクロプロピル	油
1.254	N	4-F	H	H	CH=CH ₂	ワックス
1.255	N	4-F	H	H	C≡CH	ワックス
1.256	N	6-F	H	H	CH=CH ₂	ワックス
1.257	N	6-F	H	H	C≡CH	140-144
1.258	N	5-F	H	H	CH-CH ₂	ワックス
1.259	N	5-F	H	H	C≡CH	128-133
1.260	CBr	H	H	H	Me	ワックス
1.261	Cl	H	H	H	Me	ワックス
1.262	CC≡CH	H	H	H	Me	ワックス

10

20

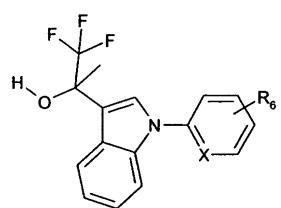
30

40

【 0 1 7 8 】

表 2

【表 10】



番号	X	R ₆	物理データ
2.1	CBr	4-OCF ₃	融点:138-140°C
2.2	CCF ₃	4-CN	
2.3	CCF ₃	6-CF ₃	ワックス
2.4	CCl	4-CF ₃	
2.5	CCl	4-CHO	融点:42-45°C
2.6	CCl	4-Cl	融点:77-79°C
2.7	CCl	4-CN	
2.8	CCl	4-COMe	
2.9	CCl	4-COOMe	
2.10	CCl	4-Me	
2.11	CCl	4-NMe ₂	
2.12	CCl	4-NO ₂	融点:79-84°C
2.13	CCl	4-Ph	
2.14	CCl	4-SO ₃ H	
2.15	CCl	6-Cl	ワックス
2.16	CCl	6-CN	
2.17	CCl	6-Me	
2.18	CCl	6-NO ₂	
2.19	CF	4-CF ₃	融点:77-81°C
2.20	CF	4-CF ₃ ;6-F	
2.21	CH	3,4-ジ-Cl	
2.22	CH	3,5-ジ-Cl	
2.23	CH	3,5-ジ-F	
2.24	CH	3-Br,4-CF ₃	融点:94-97°C
2.25	CH	3-Br,5-CF ₃	
2.26	CH	3-CF ₃ ,4-CN	
2.27	CH	3-CN,4-CF ₃	
2.28	CH	3-CN,5-CF ₃	
2.29	CH	3-Me,4-CF ₃	
2.30	CH	3-Me,5-CF ₃	
2.31	CH	3-NO ₂ ,4-CF ₃	
2.32	CH	3-NO ₂ ,5-CF ₃	
2.33	CH	3-Cl-4-F	
2.34	CNO ₂	4-CF ₃	
2.35	COMe	4-CN	融点:64-66°C
2.36	CH	3,5-ジ-Me	ワックス
2.37	CCl	4-SF ₅	
2.38	CCl	4-SF ₅ ,6-Cl	融点:123-129°C
2.39	N	4-SF ₃	融点:84-86°C
2.40	CCl	3,5-ジ-F,6-Cl	融点:138-144°C
2.41	CCl	3-CN,6-Cl	融点:62-68°C
2.42	CCl	3,5-ジ-F,4-CF ₃ ,6-Cl	油
2.43	CCl	3,4,5-トリ-F,6-Cl	融点:100-108°C
2.44	CCl	4-NO ₂ ,6-Cl	ワックス
2.45	CCl	3-F,6-Cl	油

10

20

30

40

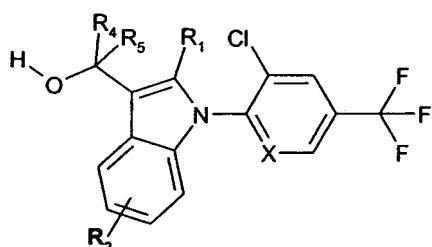
2.46	CH	4-OCF ₃ ,6-Cl	ワックス
2.47	CCl	4-OCF ₂ Cl,6-Cl	ワックス
2.48	CCl	4-1,6-Cl	ワックス
2.49	N	4-(4-CF ₃ -Ph),6-Cl	ワックス
2.50	CCl	4-Cl,6-Cl	ワックス
2.51	CCl	4-NH ₂ ,6-Cl	ワックス
2.52	CCl	4-NHCOMe,6-Cl	融点:210-212°C
2.53	CCl	4-Br,6-Cl	ワックス
2.54	CCl	4-C≡CH,6-Cl	ワックス
2.55	CCl	4-CN,6-Cl	ワックス

10

【0 1 7 9】

表 3

【表 1 1】



20

番号	X	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	融点 [°C]
3.1	CCl	Me	H	CH ₃	H	121-124
3.2	CCl	Et	H	CClF ₂	Me	
3.3	CCl	IPr	H	CF ₂ CF ₃	Me	
3.4	CCl	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.5	CCl	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.6	CCl	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.7	CCl	Ph	H	CF ₃	Me	130-132
3.8	CCl	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.9	CCl	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	97-100
3.10	CCl	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	81-83
3.11	CCl	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	172-174
3.12	CCl	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.13	CCl	2-ピリミジル	H	CF ₃	Me	
3.14	CCl	5-ピリミジル	H	CF ₃	Me	
3.15	CCl	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.16	CCl	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.17	CCl	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.18	CCl	OH	H	CF ₃	Me	
3.19	CCl	OMe	H	CF ₃	Me	
3.20	CCl	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.21	CCl	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.22	CCl	O-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.23	CCl	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.24	CCl	OPh	H	CF ₃	Me	
3.25	CCl	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.26	CCl	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.27	CCl	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.28	CCl	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.29	CCl	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.30	CCl	SH	H	CF ₃	Me	
3.31	CCl	SMe	H	CF ₃	Me	
3.32	CCl	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.33	CCl	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.34	CCl	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	H	
3.35	CCl	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.36	CCl	SPh	H	CF ₃	Me	
3.37	CCl	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.38	CCl	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.39	CCl	NHiPr	H	CF ₃	Me	
3.40	CCl	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.41	CCl	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.42	CCl	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.43	CCl	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.44	CCl	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.45	CCl	NH-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.46	CCl	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.47	CCl	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.48	CCl	NH-(2-フランル)	H	CF ₃	Me	
3.49	CCl	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.50	CCl	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.51	CCl	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.52	CCl	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.53	CCl	CH ₂ O-(2-フランル)	H	CF ₃	Me	
3.54	CCl	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.55	CCl	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.56	CCl	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.57	CCl	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.58	CCl	NHCH ₂ -(2-フランル)	H	CF ₃	Me	108-112
3.59	CCl	CHO	H	CF ₃	Me	
3.60	CCl	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.61	CCl	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.62	CH	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.63	CCl	C(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.64	CCl	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.65	CCl	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.66	CCl	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.67	CCl	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.68	CCl	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.69	CCl	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.70	CCl	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.71	CCl	C(O)-(2-フランル)	H	CF ₃	Me	
3.72	CCl	COOH	H	CF ₃	Me	113-118
3.73	CCl	COOMe	H	CF ₃	Me	130-132
3.74	CCl	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.75	CCl	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.76	CCl	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.77	CCl	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.78	CCl	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.79	CCl	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.80	CCl	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.81	CCl	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.82	CCl	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.83	CCl	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.84	CCl	COO-(2-フランル)	H	CF ₃	Me	
3.85	CCl	CONH ₂	H	CF ₃	Me	油
3.86	CCl	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.87	CCl	C(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.88	CCl	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.89	CCl	C(O)NHNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.90	CCl	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.91	CCl	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.92	CCl	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.93	CCl	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.94	CCl	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.95	CCl	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.96	CCl	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.97	CCl	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.98	CCl	NHC(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.99	CCl	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.100	CCl	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.101	CCl	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.102	CH	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.103	CCl	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.104	CCl	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.105	CCl	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.106	CCl	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.107	CCl	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.108	CCl	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.109	CCl	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.110	CCl	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.111	CCl	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.112	CCl	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	113-118
3.113	CCl	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	130-132
3.114	CCl	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.115	CCl	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.116	CCl	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.117	CCl	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.118	CCl	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.119	CCl	CN	H	CF ₃	Me	
3.120	CCl	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.121	CCl	Cl	H	CF ₃	Me	
3.122	CCl	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.123	CCl	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.124	CCl	Me	5-Cl	CF ₃	Me	152-155
3.125	CCl	Me	5-OMe	CF ₃	Me	176-178
3.126	CH	Me	H	CF ₃	Me	
3.127	CH	Et	H	CF ₃	Me	
3.128	CH	iPr	H	CF ₃	Me	
3.129	CH	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.130	CH	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.131	CH	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.132	CH	Ph	H	CF ₃	Me	
3.133	CH	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.134	CH	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.135	CH	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.136	CH	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.137	CH	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.138	CH	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.139	CH	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.140	CH	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.141	CH	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.142	CH	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.143	CH	OH	H	CF ₃	Me	
3.144	CH	OMe	H	CF ₃	Me	
3.145	CH	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.146	CH	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.147	CH	Oc-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.148	CH	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.149	CH	Oph	H	CF ₃	Me	
3.150	CH	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.151	CH	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.152	CH	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.153	CH	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.154	CH	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.155	CH	SH	H	CF ₃	Me	
3.156	CH	SMe	H	CF ₃	Me	
3.157	CH	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.158	CH	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.169	CH	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.160	CH	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.161	CH	SPh	H	CF ₃	Me	
3.162	CH	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.163	CH	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.164	CH	MhiPr	H	CF ₃	Me	
3.165	CH	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.166	CH	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.167	CH	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.168	CH	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.169	CH	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.170	CH	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.171	CH	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.172	CH	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.173	CH	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.174	CH	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.175	CH	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.176	CH	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.177	CH	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.178	CH	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.179	CH	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.180	CH	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.181	CH	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.182	CH	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.183	CH	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.184	CH	CHO	H	CF ₃	Me	
3.185	CH	C(O)Me	H	CF ₃	Me	油
3.186	CH	C(O)Et	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.187	CH	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.188	CH	C(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.189	CH	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.190	CH	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.191	CH	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.192	CH	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.193	CH	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.194	CH	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.195	CH	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.196	CH	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.197	CH	COOH	H	CF ₃	Me	
3.198	CH	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.199	CH	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.200	CH	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.201	CH	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.202	CH	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.203	CH	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.204	CH	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.205	CH	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.206	CH	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.207	CH	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.208	CH	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.209	CH	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.210	CH	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.211	CH	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.212	CH	C(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.213	CH	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.214	CH	C(O)NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.215	CH	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.216	CH	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.217	CH	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.218	CH	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.219	CH	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.220	CH	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.221	CH	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.222	CH	NHC(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.223	CH	NHC(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.224	CH	NHC(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.225	CH	NHC(O)NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.226	CH	NHC(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.227	CH	NHC(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.228	CH	NHC(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.229	CH	NHC(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.230	CH	NHC(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.231	CH	NHC(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.232	CH	NHC(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.233	CH	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.234	CH	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.235	CH	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.236	CH	NHCOO- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.237	CH	NHCOOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.238	CH	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.239	CH	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.240	CH	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.241	CH	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.242	CH	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.243	CH	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.244	CH	CN	H	CF ₃	Me	
3.245	CH	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.246	CH	Cl	H	CF ₃	Me	
3.247	CH	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.248	CH	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.249	CH	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.250	CH	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.251	CMe	Me	H	CF ₃	Me	
3.252	CMe	Et	H	CF ₃	Me	
3.253	CMe	Ipr	H	CF ₃	Me	
3.254	CMe	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.255	CMe	<i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.256	CMe	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.257	CMe	Ph	H	CF ₃	Me	
3.258	CMe	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.259	CMe	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.260	CMe	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.261	CMe	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.262	CMe	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.263	CMe	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.264	CMe	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.265	CMe	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.266	CMe	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.267	CMe	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.268	CMe	OH	H	CF ₃	Me	
3.269	CMe	OMe	H	CF ₃	Me	
3.270	CMe	O <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.271	CMe	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.272	CMe	O- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.273	CMe	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.274	CMe	OPh	H	CF ₃	Me	
3.275	CMe	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.276	CMe	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.277	CMe	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.278	CMe	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.279	CMe	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.280	CMe	SH	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.281	CMe	SMe	H	CF ₃	Me	
3.282	CMe	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.283	CMe	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.284	CMe	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.285	CMe	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.286	CMe	SPh	H	CF ₃	Me	
3.287	CMe	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.288	CMe	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.289	CMe	NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.290	CMe	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.291	CMe	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.292	CMe	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.293	CMe	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.294	CMe	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.295	CMe	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.296	CMe	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.297	CMe	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.298	CMe	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.299	CMe	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.300	CMe	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.301	CMe	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.302	CMe	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.303	CMe	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.304	CMe	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.305	CMe	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.306	CMe	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.307	CMe	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.308	CMe	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.309	CMe	CHO	H	CF ₃	Me	
3.310	CMe	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.311	CMe	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.312	CMe	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.313	CMe	C(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.314	CMe	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.315	CMe	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.316	CMe	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.317	CMe	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.318	CMe	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.319	CMe	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.320	CMe	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.321	CMe	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.322	CMe	COOH	H	CF ₃	Me	
3.323	CMe	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.324	CMe	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.325	CMe	COOiPr	H	CF ₃	Me	
3.326	CMe	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.327	CMe	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.328	CMe	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.329	CMe	COOPh	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.330	CMe	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.331	CMe	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.332	CMe	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.333	CMe	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.334	CMe	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.335	CMe	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.336	CMe	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.337	CMe	C(O)NHiPr	H	CF ₃	Me	
3.338	CMe	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.339	CMe	C(O)NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.340	CMe	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.341	CMe	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.342	CMe	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.343	CMe	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.344	CMe	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.345	CMe	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.346	CMe	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.347	CMe	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.348	CMe	NHC(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.349	CMe	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.350	CMe	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.351	CMe	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.352	CMe	NHC(OPh)	H	CF ₃	Me	
3.353	CMe	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.354	CMe	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.355	CMe	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.356	CMe	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.357	CMe	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.358	CMe	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.359	CMe	NHCOOiPr	H	CF ₃	Me	
3.360	CMe	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.361	CMe	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.362	CMe	NHCOOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.363	CMe	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.364	CMe	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.365	CMe	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.366	CMe	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.367	CMe	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.368	CMe	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.369	CMe	CN	H	CF ₃	Me	
3.370	CMe	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.371	CMe	Cl	H	CF ₃	Me	
3.372	CMe	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.373	CMe	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.374	CMe	Me	5-Cl	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.375	CMe	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.376	CF	Me	H	CF ₃	Me	
3.377	CF	Et	H	CF ₃	Me	
3.378	CF	iPr	H	CF ₃	Me	
3.379	CF	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.380	CF	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.381	CF	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.382	CF	Ph	H	CF ₃	Me	
3.383	CF	4-Cl-Pr	H	CF ₃	Me	
3.384	CF	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.385	CF	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.386	CF	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.387	CF	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.388	CF	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.389	CF	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.390	CF	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.391	CF	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.392	CF	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.393	CF	OH	H	CF ₃	Me	
3.394	CF	OMe	H	CF ₃	Me	
3.395	CF	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.396	CF	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.397	CF	O-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.398	CF	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.399	CF	OPh	H	CF ₃	Me	
3.440	CF	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.401	CF	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.402	CF	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.403	CF	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.404	CF	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.405	CF	SH	H	CF ₃	Me	
3.406	CF	SMe	H	CF ₃	Me	
3.407	CF	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.408	CF	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.409	CF	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.410	CF	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.411	CF	SPh	H	CF ₃	Me	
3.412	CF	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.413	CF	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.414	CF	NHiPr	H	CF ₃	Me	
3.415	CF	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.416	CF	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.417	CF	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.418	CF	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.419	CF	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.420	CF	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.421	CF	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.422	CF	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.423	CF	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.424	CF	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.425	CF	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.426	CF	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.427	CF	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.428	CF	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.429	CF	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.430	CF	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.431	CF	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.432	CF	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.433	CF	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.434	CF	CHO	H	CF ₃	Me	
3.435	CF	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.436	CF	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.437	CF	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.438	CF	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.439	CF	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.440	CF	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.441	CF	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.442	CF	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.443	CF	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.444	CF	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.445	CF	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.446	CF	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.447	CF	COOH	H	CF ₃	Me	
3.448	CF	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.449	CF	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.450	CF	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.451	CF	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.452	CF	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.453	CF	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.454	CF	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.455	CF	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.456	CF	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.457	CF	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.458	CF	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.459	CF	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.460	CF	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.461	CF	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.462	CF	C(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.463	CF	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.464	CF	C(O)NHNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.465	CF	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.466	CF	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.467	CF	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.468	CF	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.469	CF	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.470	CF	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.471	CF	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.472	CF	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.473	CF	NHC(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.474	CF	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.475	CF	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.476	CF	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.477	CF	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.478	CF	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.479	CF	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.480	CF	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.481	CF	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.482	CF	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.483	CF	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.484	CF	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.485	CF	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.486	CF	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.487	CF	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.488	CF	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.489	CF	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.490	CF	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.491	CF	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.492	CF	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.493	CF	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.494	CF	CN	H	CF ₃	Me	
3.495	CF	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.496	CF	Cl	H	CF ₃	Me	
3.497	CF	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.498	CF	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.499	CF	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.500	CF	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.501	CBr	Me	H	CF ₃	Me	
3.502	CBr	Et	H	CF ₃	Me	
3.503	CBr	iPr	H	CF ₃	Me	
3.504	CBr	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.505	CBr	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.506	CBr	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.507	CBr	Ph	H	CF ₃	Me	
3.508	CBr	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.509	CBr	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.510	CBr	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.511	CBr	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.512	CBr	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.513	CBr	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.514	CBr	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.515	CBr	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.516	CBr	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.517	CBr	2-フラニル	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.518	CBr	OH	H	CF ₃	Me	
3.519	CBr	OMe	H	CF ₃	Me	
3.520	CBr	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.521	CBr	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.522	CBr	Oc-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.523	CBr	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.524	CBr	Oph	H	CF ₃	Me	
3.525	CBr	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.526	CBr	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.527	CBr	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.528	CBr	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.529	CBr	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.530	CBr	SH	H	CF ₃	Me	
3.531	CBr	SMe	H	CF ₃	Me	
3.532	CBr	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.533	CBr	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.534	CBr	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.535	CBr	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.536	CBr	SPh	H	CF ₃	Me	
3.537	CBr	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.538	CBr	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.539	CBr	NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.540	CBr	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.541	CBr	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.542	CBr	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.543	CBr	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.544	CBr	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.545	CBr	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.546	CBr	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.547	CBr	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.548	CBr	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.549	CBr	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.550	CBr	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.551	CBr	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.552	CBr	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.553	CBr	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.554	CBr	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.555	CBr	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.556	CBr	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.557	CBr	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.558	CBr	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.559	CBr	CHO	H	CF ₃	Me	
3.560	CBr	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.561	CBr	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.562	CBr	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.563	CBr	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.564	CBr	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.565	CBr	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.566	CBr	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.567	CBr	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.568	CBr	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.569	CBr	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.570	CBr	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.571	CBr	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.572	CBr	COOH	H	CF ₃	Me	
3.573	CBr	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.574	CBr	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.575	CBr	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.576	CBr	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.577	CBr	COO- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.578	CBr	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.579	CBr	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.580	CBr	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.581	CBr	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.582	CBr	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.583	CBr	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.584	CBr	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.585	CBr	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.586	CBr	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.587	CBr	C(O)N <i>h</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.588	CBr	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.589	CBr	C(O)NHNH- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.590	CBr	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.591	CBr	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.592	CBr	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.593	CBr	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.594	CBr	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.595	CBr	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.596	CBr	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.597	CBr	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.598	CBr	NHC(O) <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.599	CBr	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.600	CBr	NHC(O)- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.601	CBr	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.602	CBr	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.603	CBr	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.604	CBr	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.605	CBr	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.606	CBr	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.607	CBr	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.608	CBr	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.609	CBr	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.610	CBr	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.611	CBr	NHCOO- <i>c</i> -C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.612	CBr	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.613	CBr	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.614	CBr	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.615	CBr	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.616	CBr	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.617	CBr	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.618	CBr	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.619	CBr	CN	H	CF ₃	Me	
3.620	CBr	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.621	CBr	Cl	H	CF ₃	Me	
3.622	CBr	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.623	CBr	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.624	CBr	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.625	CBr	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.626	CCN	Me	H	CF ₃	Me	
3.627	CCN	Et	H	CF ₃	Me	
3.628	CCN	IPr	H	CF ₃	Me	
3.629	CCN	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.630	CCN	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.631	CCN	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.632	CCN	Ph	H	CF ₃	Me	
3.633	CCN	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.634	CCN	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.635	CCN	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.636	CCN	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.637	CCN	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.638	CCN	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.639	CCN	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.640	CCN	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.641	CCN	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.642	CCN	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.643	CCN	OH	H	CF ₃	Me	
3.644	CCN	OMe	H	CF ₃	Me	
3.645	CCN	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.646	CCN	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.647	CCN	Oc-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.648	CCN	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.649	CCN	Oph	H	CF ₃	Me	
3.650	CCN	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.651	CCN	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.652	CCN	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.653	CCN	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.654	CCN	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.655	CCN	SH	H	CF ₃	Me	
3.656	CCN	SMe	H	CF ₃	Me	
3.657	CCN	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.658	CCN	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.659	CCN	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.660	CCN	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.661	CCN	SPh	H	CF ₃	Me	
3.662	CCN	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.663	CCN	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.664	CCN	NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.665	CCN	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.666	CCN	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.667	CCN	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.668	CCN	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.669	CCN	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.670	CCN	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.671	CCN	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.672	CCN	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.673	CCN	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.674	CCN	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.675	CCN	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.676	CCN	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.677	CCN	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.678	CCN	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.679	CCN	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.680	CCN	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.681	CCN	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.682	CCN	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.683	CCN	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.684	CCN	CHO	H	CF ₃	Me	
3.685	CCN	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.686	CCN	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.687	CCN	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.688	CCN	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.689	CCN	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.690	CCN	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.691	CCN	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.692	CCN	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.693	CCN	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.694	CCN	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.695	CCN	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.696	CCN	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.697	CCN	COOH	H	CF ₃	Me	
3.698	CCN	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.699	CCN	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.700	CCN	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.701	CCN	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.702	CCN	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.703	CCN	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.704	CCN	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.705	CCN	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.706	CCN	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.707	CCN	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.708	CCN	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.709	CCN	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.710	CCN	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.711	CCN	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.712	CCN	C(O)NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.713	CCN	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.714	CCN	C(O)NNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.715	CCN	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.716	CCN	C(O)NHPH	H	CF ₃	Me	
3.717	CCN	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.718	CCN	C(O)NH-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.719	CCN	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.720	CCN	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.721	CCN	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.722	CCN	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.723	CCN	NHC(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.724	CCN	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.725	CCN	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.726	CCN	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.727	CCN	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.728	CCN	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.729	CCN	NHC(O)-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.730	CCN	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.731	CCN	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.732	CCN	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.733	CCN	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.734	CCN	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.735	CCN	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.736	CCN	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.737	CCN	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.738	CCN	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.739	CCN	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.740	CCN	NHCOO-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.741	CCN	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.742	CCN	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.743	CCN	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.744	CCN	CN	H	CF ₃	Me	
3.745	CCN	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.746	CCN	Cl	H	CF ₃	Me	
3.747	CCN	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.748	CCN	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.749	CCN	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.750	CCN	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.751	CNO ₂	Me	H	CF ₃	Me	
3.752	CNO ₂	Et	H	CF ₃	Me	
3.753	CNO ₂	iPr	H	CF ₃	Me	
3.754	CNO ₂	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.755	CNO ₂	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.756	CNO ₂	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.757	CNO ₂	Ph	H	CF ₃	Me	
3.758	CNO ₂	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.759	CNO ₂	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.760	CNO ₂	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.761	CNO ₂	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.762	CNO ₂	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.763	CNO ₂	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.764	CNO ₂	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.765	CNO ₂	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.766	CNO ₂	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.767	CNO ₂	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.768	CNO ₂	OH	H	CF ₃	Me	
3.769	CNO ₂	OMe	H	CF ₃	Me	
3.770	CNO ₂	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.771	CNO ₂	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.772	CNO ₂	O-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.773	CNO ₂	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.774	CNO ₂	OPh	H	CF ₃	Me	
3.775	CNO ₂	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.776	CNO ₂	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.777	CNO ₂	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.778	CNO ₂	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.779	CNO ₂	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.780	CNO ₂	SH	H	CF ₃	Me	
3.781	CNO ₂	SMe	H	CF ₃	Me	
3.782	CNO ₂	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.783	CNO ₂	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.784	CNO ₂	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.785	CNO ₂	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.786	CNO ₂	SPh	H	CF ₃	Me	
3.787	CNO ₂	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.788	CNO ₂	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.789	CNO ₂	NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.790	CNO ₂	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.791	CNO ₂	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.792	CNO ₂	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.793	CNO ₂	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.794	CNO ₂	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.795	CNO ₂	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.796	CNO ₂	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.797	CNO ₂	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.798	CNO ₂	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.799	CNO ₂	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.800	CNO ₂	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.801	CNO ₂	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.802	CNO ₂	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.803	CNO ₂	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.804	CNO ₂	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.805	CNO ₂	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.806	CNO ₂	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.807	CNO ₂	NHCH ₂ (2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.808	CNO ₂	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.809	CNO ₂	CHO	H	CF ₃	Me	
3.810	CNO ₂	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.811	CNO ₂	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.812	CNO ₂	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.813	CNO ₂	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.814	CNO ₂	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.815	CNO ₂	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.816	CNO ₂	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.817	CNO ₂	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.818	CNO ₂	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.819	CNO ₂	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.820	CNO ₂	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.821	CNO ₂	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.822	CNO ₂	COOH	H	CF ₃	Me	
3.823	CNO ₂	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.824	CNO ₂	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.825	CNO ₂	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.826	CNO ₂	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.827	CNO ₂	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.828	CNO ₂	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.829	CNO ₂	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.830	CNO ₂	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.831	CNO ₂	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.832	CNO ₂	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.833	CNO ₂	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.834	CNO ₂	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.835	CNO ₂	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.836	CNO ₂	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.837	CNO ₂	C(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.838	CNO ₂	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.839	CNO ₂	C(O)NHNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.840	CNO ₂	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.841	CNO ₂	C(O)NHPPh	H	CF ₃	Me	
3.842	CNO ₂	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.843	CNO ₂	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.844	CNO ₂	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.845	CNO ₂	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.846	CNO ₂	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.847	CNO ₂	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.848	CNO ₂	NHC(O) <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.849	CNO ₂	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.850	CNO ₂	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.851	CNO ₂	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.852	CNO ₂	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.853	CNO ₂	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.854	CNO ₂	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.855	CNO ₂	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.856	CNO ₂	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.857	CNO ₂	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.858	CNO ₂	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.859	CNO ₂	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.860	CNO ₂	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.861	CNO ₂	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.862	CNO ₂	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.863	CNO ₂	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.864	CNO ₂	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.865	CNO ₂	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.866	CNO ₂	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.867	CNO ₂	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.868	CNO ₂	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.869	CNO ₂	CN	H	CF ₃	Me	
3.870	CNO ₂	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.871	CNO ₂	Cl	H	CF ₃	Me	
3.872	CNO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.873	CNO ₂	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.874	CNO ₂	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.875	CNO ₂	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.876	C-c-C ₃ H ₅	Me	H	CF ₃	Me	
3.877	C-c-C ₃ H ₅	Et	H	CF ₃	Me	
3.878	C-c-C ₃ H ₅	iPr	H	CF ₃	Me	
3.879	C-c-C ₃ H ₅	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.880	C-c-C ₃ H ₅	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.881	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.882	C-c-C ₃ H ₅	Ph	H	CF ₃	Me	
3.883	C-c-C ₃ H ₅	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.884	C-c-C ₃ H ₅	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.885	C-c-C ₃ H ₅	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.886	C-c-C ₃ H ₅	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.887	C-c-C ₃ H ₅	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.888	C-c-C ₃ H ₅	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.889	C-c-C ₃ H ₅	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.890	C-c-C ₃ H ₅	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.891	C-c-C ₃ H ₅	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.892	C-c-C ₃ H ₅	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.893	C-c-C ₃ H ₅	OH	H	CF ₃	Me	
3.894	C-c-C ₃ H ₅	OMe	H	CF ₃	Me	
3.895	C-c-C ₃ H ₅	O <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.896	C-c-C ₃ H ₅	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.897	C-c-C ₃ H ₅	O-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.898	C-c-C ₃ H ₅	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.899	C-c-C ₃ H ₅	OPh	H	CF ₃	Me	
3.900	C-c-C ₃ H ₅	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.901	C-c-C ₃ H ₅	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.902	C-c-C ₃ H ₅	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.903	C-c-C ₃ H ₅	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.904	C-c-C ₃ H ₅	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.905	C-c-C ₃ H ₅	SH	H	CF ₃	Me	
3.906	C-c-C ₃ H ₅	SMe	H	CF ₃	Me	
3.907	C-c-C ₃ H ₅	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.908	C-c-C ₃ H ₅	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.909	C-c-C ₃ H ₅	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.910	C-c-C ₃ H ₅	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.911	C-c-C ₃ H ₅	SPh	H	CF ₃	Me	
3.912	C-c-C ₃ H ₅	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.913	C-c-C ₃ H ₅	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.914	C-c-C ₃ H ₅	NHiPr	H	CF ₃	Me	
3.915	C-c-C ₃ H ₅	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.916	C-c-C ₃ H ₅	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.917	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.918	C-c-C ₃ H ₅	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.919	C-c-C ₃ H ₅	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.920	C-c-C ₃ H ₅	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.921	C-c-C ₃ H ₅	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.922	C-c-C ₃ H ₅	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.923	C-c-C ₃ H ₅	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.924	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.925	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.926	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.927	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.928	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.929	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.930	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.931	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.932	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.933	C-c-C ₃ H ₅	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.934	C-c-C ₃ H ₅	CHO	H	CF ₃	Me	
3.935	C-c-C ₃ H ₅	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.936	C-c-C ₃ H ₅	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.937	C-c-C ₃ H ₅	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.938	C-c-C ₃ H ₅	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.939	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.940	C-c-C ₃ H ₅	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.941	C-c-C ₃ H ₅	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.942	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.943	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.944	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.945	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.946	C-c-C ₃ H ₅	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.947	C-c-C ₃ H ₅	COOH	H	CF ₃	Me	
3.948	C-c-C ₃ H ₅	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.949	C-c-C ₃ H ₅	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.950	C-c-C ₃ H ₅	COO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.951	C-c-C ₃ H ₅	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.952	C-c-C ₃ H ₅	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.953	C-c-C ₃ H ₅	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.954	C-c-C ₃ H ₅	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.955	C-c-C ₃ H ₅	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.956	C-c-C ₃ H ₅	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.957	C-c-C ₃ H ₅	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.958	C-c-C ₃ H ₅	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.959	C-c-C ₃ H ₅	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.960	C-c-C ₃ H ₅	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.961	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.962	C-c-C ₃ H ₅	C(O)N <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.963	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.964	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NHNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.965	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.966	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NHPH	H	CF ₃	Me	
3.967	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.968	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.969	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.970	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.971	C-c-C ₃ H ₅	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.972	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.973	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O) <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.974	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.975	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.976	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.977	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.978	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.979	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.980	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.981	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.982	C-c-C ₃ H ₅	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.983	C-c-C ₃ H ₅	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.984	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.985	C-c-C ₃ H ₅	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.986	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.987	C-c-C ₃ H ₅	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.988	C-c-C ₃ H ₅	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.989	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.990	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.991	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.992	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.993	C-c-C ₃ H ₅	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.994	C-c-C ₃ H ₅	CN	H	CF ₃	Me	
3.995	C-c-C ₃ H ₅	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.996	C-c-C ₃ H ₅	Cl	H	CF ₃	Me	
3.997	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.998	C-c-C ₃ H ₅	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.999	C-c-C ₃ H ₅	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.1000	C-c-C ₃ H ₅	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.1001	N	Me	H	CF ₃	Me	
3.1002	N	Et	H	CF ₃	Me	
3.1003	N	iPr	H	CF ₃	Me	
3.1004	N	C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1005	N	c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1006	N	CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1007	N	Ph	H	CF ₃	Me	
3.1008	N	4-Cl-Ph	H	CF ₃	Me	
3.1009	N	2-ナフチル	H	CF ₃	Me	
3.1010	N	3-Cl-4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.1011	N	4-F-Ph	H	CF ₃	Me	
3.1012	N	2-ピリジル	H	CF ₃	Me	
3.1013	N	2-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.1014	N	5-ピリミジニル	H	CF ₃	Me	
3.1015	N	2-ピロリル	H	CF ₃	Me	
3.1016	N	2-イミダゾリル	H	CF ₃	Me	
3.1017	N	2-フラニル	H	CF ₃	Me	
3.1018	N	OH	H	CF ₃	Me	
3.1019	N	OMe	H	CF ₃	Me	
3.1020	N	OiPr	H	CF ₃	Me	
3.1021	N	OC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1022	N	O-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1023	N	OCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1024	N	OPh	H	CF ₃	Me	
3.1025	N	O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1026	N	O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1027	N	O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1028	N	O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1029	N	O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1030	N	SH	H	CF ₃	Me	
3.1031	N	SMe	H	CF ₃	Me	
3.1032	N	SiPr	H	CF ₃	Me	
3.1033	N	SC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1034	N	S-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1035	N	SCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1036	N	SPh	H	CF ₃	Me	
3.1037	N	NH ₂	H	CF ₃	Me	
3.1038	N	NHMe	H	CF ₃	Me	
3.1039	N	NHiPr	H	CF ₃	Me	
3.1040	N	NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

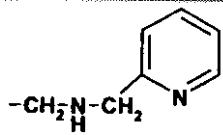
3.1041	N	NH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1042	N	NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1043	N	NHPh	H	CF ₃	Me	
3.1044	N	NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1045	N	NH-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1046	N	NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1047	N	NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1048	N	NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1049	N	CH ₂ O-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1050	N	CH ₂ O-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1051	N	CH ₂ O-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1052	N	CH ₂ O-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1053	N	CH ₂ O-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1054	N	NHCH ₂ -(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1055	N	NHCH ₂ -(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1056	N	NHCH ₂ -(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1057	N	NHCH ₂ -(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1058	N	NHCH ₂ -(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1059	N	CHO	H	CF ₃	Me	
3.1060	N	C(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.1061	N	C(O)Et	H	CF ₃	Me	
3.1062	N	C(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.1063	N	C(O) ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1064	N	C(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1065	N	C(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1066	N	C(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.1067	N	C(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1068	N	C(O)-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1069	N	C(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1070	N	C(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1071	N	C(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1072	N	COOH	H	CF ₃	Me	
3.1073	N	COOMe	H	CF ₃	Me	
3.1074	N	COOEt	H	CF ₃	Me	
3.1075	N	COOiPr	H	CF ₃	Me	
3.1076	N	COOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1077	N	COO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1078	N	COOCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1079	N	COOPh	H	CF ₃	Me	
3.1080	N	COO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1081	N	COO-(2-ピリミジニル)	H	CF ₃	Me	
3.1082	N	COO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1083	N	COO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1084	N	COO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1085	N	CONH ₂	H	CF ₃	Me	
3.1086	N	C(O)NHMe	H	CF ₃	Me	
3.1087	N	C(O)NhiPr	H	CF ₃	Me	
3.1088	N	C(O)NHC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1089	N	C(O)NHNH-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	

10

20

30

40

3.1090	N	C(O)NHCH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1091	N	C(O)NPh	H	CF ₃	Me	
3.1092	N	C(O)NH-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1093	N	C(O)NH-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.1094	N	C(O)NH-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1095	N	C(O)NH-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1096	N	C(O)NH-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1097	N	NHC(O)Me	H	CF ₃	Me	
3.1098	N	NHC(O)iPr	H	CF ₃	Me	
3.1099	N	NHC(O)C ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1100	N	NHC(O)-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1101	N	NHC(O)CH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1102	N	NHC(O)Ph	H	CF ₃	Me	
3.1103	N	NHC(O)-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1104	N	NHC(O)-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.1105	N	NHC(O)-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1106	N	NHC(O)-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1107	N	NHC(O)-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1108	N	NHCOOMe	H	CF ₃	Me	
3.1109	N	NHCOO <i>i</i> Pr	H	CF ₃	Me	
3.1110	N	NHCOOC ₆ H ₁₂	H	CF ₃	Me	
3.1111	N	NHCOO-c-C ₃ H ₅	H	CF ₃	Me	
3.1112	N	NHCOOH ₂ Ph	H	CF ₃	Me	
3.1113	N	NHCOOPh	H	CF ₃	Me	
3.1114	N	NHCOO-(2-ピリジル)	H	CF ₃	Me	
3.1115	N	NHCOO-(2-ピリミジル)	H	CF ₃	Me	
3.1116	N	NHCOO-(2-ピロリル)	H	CF ₃	Me	
3.1117	N	NHCOO-(2-イミダゾリル)	H	CF ₃	Me	
3.1118	N	NHCOO-(2-フラニル)	H	CF ₃	Me	
3.1119	N	CN	H	CF ₃	Me	
3.1120	N	NO ₂	H	CF ₃	Me	
3.1121	N	Cl	H	CF ₃	Me	
3.1122	N	CH ₂ CH=CH ₂	H	CF ₃	Me	
3.1123	N	CH ₂ C≡CH	H	CF ₃	Me	
3.1124	N	Me	5-Cl	CF ₃	Me	
3.1125	N	Me	5-OMe	CF ₃	Me	
3.1126	CCl	CH ₂ OH	H	CF ₃	Me	69-71
3.1127	CCl	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	CF ₃	Me	油
3.1128	CCl	CH ₂ CN	H	CF ₃	Me	69-72
3.1129	CCl	CH ₂ SCH ₃	H	CF ₃	Me	111-114
3.1130	CCl		H	CF ₃	Me	油

10

20

30

40

3.1131	CCl	CH ₂ NHCH ₃	H	CF ₃	Me	油
3.1132	CCl	CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CF ₃	Me	198-201
3.1133	CCl	CH ₂ Br	H	CF ₃	Me	151-153
3.1134	CCl	Me	H	CF ₃	CH=CH ₂	ワックス
3.1135	CCl	Me	H	CF ₃	C≡CH	ワックス
3.1136	CCl	CH ₂ Cl	H	CF ₃	Me	130-133
3.1137	CCl	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	Me	油

【0180】

生物学的実施例：

1. クリイロコイタマダニ(イヌダニ)に対するインビトロでの活性。

10

【0181】

駆虫活性を評価する試験物質を含む、適切に構成された96ウェルプレートに清浄な成体マダニ集団を蒔く。各化合物を、その最小有効量(MED)を決定するために、段階希釈によって試験する。マダニを試験化合物と10分間接触させ、次いで28及び相対湿度80%で7日間インキュベートし、その間に試験化合物の効果をモニターする。成体マダニが死滅した場合に、殺ダニ活性が確認される。

【0182】

この試験において、化合物番号1.1-1.4、1.6、1.8-1.10、1.12-1.15、1.26-1.34、1.38、1.44、1.45、1.47-1.53、1.56、1.58-1.60-1.64、1.66、1.68、1.70、1.74-1.76、1.80-1.83、1.86、1.89、1.99、1.110-1.112、1.116-1.117、1.121、1.132、1.138、1.146、1.153、1.185、1.194-1.196、1.200、1.204-1.207、1.209-1.210、1.212、1.214、1.216-1.222、1.224-1.230、1.234-1.239、1.242-1.244、1.246-1.247、1.250、1.251、1.253-1.262、2.4、2.19、2.20、2.34、2.38、2.42、2.44、2.46-2.48、3.1、3.10、3.59、3.73、3.1129-3.1131及び3.1133-3.1136は、640ppmで80%を超える効力を示した。

20

30

【0183】

2. クテノセファリデス フエリス(ネコノミ)に対するインビトロでの活性。

【0184】

ノミの混合成体集団を、適切に構成された96ウェルプレートに入れ、人工給餌システムを介して、処理した血液をノミが摂取できるようにする。各化合物を、そのMEDを決定するために、段階希釈によって試験する。処理した血液をノミが24時間摂取した後、化合物の効果を記録する。給餌システムによって記録された死滅したノミの数に基づいて、殺虫活性を求める。

【0185】

この試験では、表1.1-1.18、1.20-1.35、1.38-1.53、1.55、1.56、1.58-1.71、1.74-1.83、1.85-1.89、1.93-1.95、1.99-1.101、1.103、1.104、1.107-1.112、1.114-1.118、1.120、1.121、1.127、1.129、1.132、1.133、1.138、1.146、1.153、1.185-1.239、1.242-1.262、2.2、2.4、2.6、2.7、2.12、2.15、2.19、2.20、2.26、2.34、2.38-2.55、3.1、3.59、3.72、3.73、3.85、3.124、3.125及び3.1126-3.1136の化合物が100ppmで80%を超える効力を示した。

40

【0186】

3. ウサギのクリイロコイタマダニ(イヌダニ)に対するインビトロでの活性。

50

【0187】

第0日に、所与の用量の試験化合物を、ウサギの耳のみに噴霧することによって、ウサギを処理する。第+1日に、ウサギの耳に成体クリイロコイタマダニ（性比1:1）を寄生させる。ウサギから回収される死滅したマダニ、及び生きているマダニを数えることによって、寄生後24時間、48時間及び72時間で効力を評価する。効力をアボットの式によってプラセボ処置群と比較して表す。効力が低下するまで、寄生を週間隔で繰り返す。

【0188】

この試験では、化合物番号1.1、1.3、1.4、1.6、1.10、1.12-1.15、1.29、1.31、1.33、1.38、1.47-1.51、1.53、1.56、1.58-1.60、1.62、1.63、1.66、1.74、1.76、1.80-1.82、1.89、1.111、1.112、1.117、1.216-1.222、1.225、1.226、1.228-1.230、1.234、1.238、1.239、2.20、2.38、2.44、3.1、3.73、3.1133、3.1135及び3.1136が、最初の寄生で240mg/m²で80%を超える効力を示した。

【0189】

4. 捻転胃虫&毛様線虫コルブリフォルミス(*columbriformis*)（胃腸の線虫）に対するインビトロでの活性

新たに収集し、清浄化した線虫卵を、駆虫活性を評価する試験物質を含む、適切に構成された96ウェルプレートに蒔く。各化合物を、そのMEDを決定するために、段階希釈によって試験する。寒天を主体とした栄養培地に試験化合物を埋め込み、3齢の幼虫まで卵を十分に成長させる。プレートを25及び相対湿度(RH)60%で6日間インキュベートする。ふ化とそれに続く幼虫の成長を記録して、可能な殺線虫活性を確認する。効力は、ふ化の減少率、L3の成長抑制、又は全段階の幼虫の停滞&死で表される。

【0190】

この試験では、化合物番号1.1-1.3、1.28、1.48、1.50、1.53、1.58-1.1.60、1.63、1.64、1.66、1.68、1.74、1.77、1.81、1.108、1.111、1.115、1.138、1.146、1.153、1.192、1.193、1.207、1.217、1.220、1.224、1.225、1.229、1.234、1.237、1.244-1.246、1.250、1.254-1.260、2.4、2.6、2.7、2.12、2.15、2.19、2.20、2.26、2.34、2.36、2.39、2.43、2.44、3.59、3.85及び3.1131が、100ppmで80%を超える効力を示した。

10

20

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2006/010518

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D209/12 C07D401/04 A01N43/38

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N A61P

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
--

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data, WPI Data, BEILSTEIN Data
--

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT
--

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 957 094 A (PFIZER [US]; PFIZER LTD [GB]) 17 November 1999 (1999-11-17) the whole document	1-30
Y	EP 0 261 035 A (ROUSSEL-UCLAF) 23 March 1988 (1988-03-23) page 5 – page 6; claims	1-30
Y	EP 0 738 713 A1 (RHONE POULENC AGROCHIMIE [FR]) 23 October 1996 (1996-10-23) page 1, lines 5-6; page 4, figures (g) and (j)	1-30
Y	JP 2003 040866 A (NIPPON KAYAKU KK) 13 February 2003 (2003-02-13) abstract; examples; table 1	1-30
		-/-

<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.
--

<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
--

* Special categories of cited documents :

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

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

Date of mailing of the international search report
--

15 January 2007

02/02/2007

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentsean 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax. (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Freton, Didier

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2006/010518

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category ^a	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 08 311036 A (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES LTD) 26 November 1996 (1996-11-26) abstract; examples; table 1	1-30
A	WO 98/24767 A (PFIZER LTD [GB]; PFIZER [US]; BANKS BERNARD JOSEPH [GB]) 11 June 1998 (1998-06-11) abstract; example 11	1-30
A	PEARLSTEIN, ROBERT A. ET AL: "Characterization of HERG potassium channel inhibition using CoMSIA 3D QSAR and homology modeling approaches" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, vol. 13, no. 10, 2003, pages 1829-1835, XP002394962 examples 18,20,21	1-30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2006/010518

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0957094	A	17-11-1999	BR 9902084 A CA 2272014 A1 JP 3215385 B2 JP 2000026409 A US 6083965 A	11-04-2000 14-11-1999 02-10-2001 25-01-2000 04-07-2000
EP 0261035	A	23-03-1988	AU 606356 B2 AU 7861887 A CA 1282071 C DE 3777294 D1 DK 488487 A ES 2032461 T3 FR 2604173 A1 GR 3004844 T3 JP 63152358 A NZ 221844 A OA 8661 A US 4849443 A ZA 8706995 A	07-02-1991 24-03-1988 26-03-1991 16-04-1992 19-03-1988 16-02-1993 25-03-1988 28-04-1993 24-06-1988 26-07-1990 30-11-1988 18-07-1989 30-11-1988
EP 0738713	A1	23-10-1996	AT 189676 T CN 1330072 A CN 1182080 A DE 69606575 D1 DE 69606575 T2 HK 1042899 A1 JP 8319272 A US 5631381 A	15-02-2000 09-01-2002 20-05-1998 16-03-2000 14-09-2000 24-11-2006 03-12-1996 20-05-1997
JP 2003040866	A	13-02-2003	NONE	
JP 8311036	A	26-11-1996	NONE	
WO 9824767	A	11-06-1998	AT 233736 T AU 720705 B2 AU 5485998 A BG 64127 B1 BG 103454 A BR 9713565 A CA 2273951 A1 CN 1258282 A CZ 9901951 A3 DE 69719547 D1 DE 69719547 T2 DK 946515 T3 DZ 2360 A1 EA 2278 B1 EP 0946515 A1 ES 2191870 T3 HK 1029111 A1 HR 970663 A2 HU 0000544 A2 ID 21556 A IL 129866 A IS 5050 A JP 20000505812 T KR 20000057432 A MA 24414 A1	15-03-2003 08-06-2000 29-06-1998 30-01-2004 31-01-2000 14-03-2000 11-06-1998 28-06-2000 16-08-2000 10-04-2003 02-10-2003 14-07-2003 28-12-2002 28-02-2002 06-10-1999 16-09-2003 26-09-2003 31-10-1998 28-06-2000 24-06-1999 12-05-2004 11-05-1999 16-05-2000 15-09-2000 01-07-1998

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2006/010518

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9824767	A	NO 992732 A	05-08-1999
		NZ 335611 A	26-01-2001
		OA 11055 A	07-03-2002
		PL 333922 A1	31-01-2000
		PT 946515 T	30-06-2003
		SK 74099 A3	12-02-2001
		TW 524667 B	21-03-2003
		US 6075043 A	13-06-2000
		US 6268509 B1	31-07-2001

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 43/50 (2006.01)	A 0 1 N 43/50	A
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 N 47/02	
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	A
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 N 43/50	J
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 6 1 K 31/404 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 K 31/404	
C 0 7 D 401/04 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	C 0 7 D 401/04	
A 6 1 K 31/496 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/454 (2006.01)	A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)	A 6 1 K 31/454	
C 0 7 D 401/12 (2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 403/06 (2006.01)	A 6 1 K 31/4178	
C 0 7 D 417/06 (2006.01)	C 0 7 D 403/06	
A 6 1 K 31/427 (2006.01)	C 0 7 D 417/06	
C 0 7 D 409/06 (2006.01)	A 6 1 K 31/427	
C 0 7 D 403/04 (2006.01)	C 0 7 D 409/06	
A 6 1 K 31/506 (2006.01)	C 0 7 D 403/04	
C 0 7 D 405/04 (2006.01)	A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 405/12 (2006.01)	C 0 7 D 405/04	
C 0 7 D 403/12 (2006.01)	C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 401/14 (2006.01)	C 0 7 D 403/12	
C 0 7 D 405/14 (2006.01)	C 0 7 D 401/14	
C 0 7 D 209/34 (2006.01)	C 0 7 D 405/14	
C 0 7 D 209/40 (2006.01)	C 0 7 D 209/34	
C 0 7 D 209/30 (2006.01)	C 0 7 D 209/40	
C 0 7 D 209/42 (2006.01)	C 0 7 D 209/30	
	C 0 7 D 209/42	

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

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(72)発明者 フリユーヒテル, イエルク

ドイツ国、7 9 5 4 1 · レーラツハ、レビベルクシユトラーセ · 2 9

(72)発明者 ゴブリ, ノエル

フランス国、エフ - 6 8 6 8 0 · カン - ロエクル、リュ・デ・ビュイソン、8 · エフ

(72)発明者 シヨルドウレ・ウエベール, サンドラ

イスラエル国、ツエー・ハー - 2 0 0 0 · ヌーシヤテル、サブロン · 3 0

(72)発明者 ブービエ, ジヤツク

スイス国、ツエー・ハー - 2 0 0 0 ・ヌーシヤテル、リュ・デ・パルク・2

F ターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB01 BB02 BB04 BB08 BB09 CC06 CC12 CC25
CC31 CC62 CC75 CC81 CC92 DD04 DD06 EE01 EE03
4C086 AA01 AA02 AA03 BC13 BC17 BC21 BC38 BC42 BC50 BC73
BC82 MA01 MA04 NA14 ZB37 ZC61
4C204 BB01 BB02 BB09 CB03 DB15 DB24 DB25 DB26 DB27 DB28
DB29 DB30 DB31 EB02 EB03 FB14 FB15 FB16 FB17 FB19
FB23 FB25 GB01 GB03 GB11 GB21 GB24 GB25 GB32
4H011 AC01 AC04 BA02 BB09 BB10 BB11 BB13 BB16 DA13 DF04
4H049 VN01 VQ60 VR23 VR31 VU02