

(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2016-518369

(P2016-518369A)

(43) 公表日 平成28年6月23日 (2016.6.23)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 231/14 (2006.01)	C O 7 D 231/14	4 C O 6 3
C O 7 D 231/16 (2006.01)	C O 7 D 231/16 C S P	4 H O 1 1
C O 7 D 401/14 (2006.01)	C O 7 D 401/14	
C O 7 D 417/12 (2006.01)	C O 7 D 417/12	
C O 7 D 417/14 (2006.01)	C O 7 D 417/14	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 124 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2016-508974 (P2016-508974)
 (86) (22) 出願日 平成26年4月11日 (2014.4.11)
 (85) 翻訳文提出日 平成27年10月30日 (2015.10.30)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2014/033766
 (87) 国際公開番号 W02014/172191
 (87) 国際公開日 平成26年10月23日 (2014.10.23)
 (31) 優先権主張番号 61/811, 919
 (32) 優先日 平成25年4月15日 (2013.4.15)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

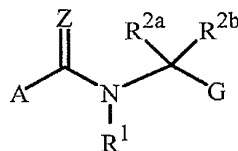
(71) 出願人 390023674
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
 アンド・カンパニー
 E. I. DU PONT DE NEMO
 URS AND COMPANY
 アメリカ合衆国デラウェア州19805.
 ウィルミントン、センターロード974.
 ピー・オー・ボックス2915、チェスナ
 ット・ラン・プラザ
 (74) 代理人 100127926
 弁理士 結田 純次
 (74) 代理人 100140132
 弁理士 竹林 則幸

最終頁に続く

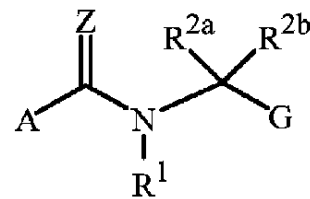
(54) 【発明の名称】 殺菌・殺カビ性アミド

(57) 【要約】

その立体異性体のすべて、N - オキシドおよび塩を含む、式1の化合物が開示されており、
 【化1】



1



1

式中、

Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される3つ以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニルであり；

ならびに、A、Z、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 およびQは本開示において定義されているとおりである。

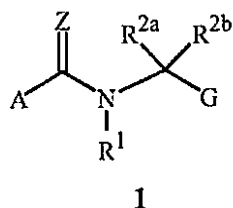
式1の化合物を含有する組成物、および、本発明の化合物または組成物を有効量で適用するステップを含む真

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1

【化 1】

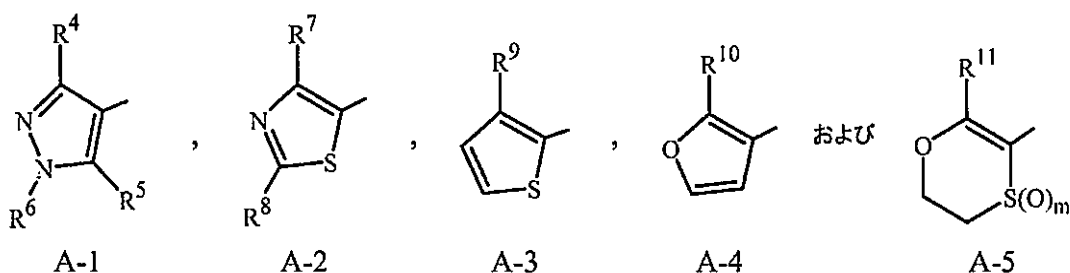


10

(式中、

A は、

【化 2】



20

からなる群から選択されるラジカルであり、

Z は O または S であり；

R¹ は、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員 ~ 6 員環であり；

R^{2 a} および R^{2 b} は、各々独立して、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルもしくは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；または

30

R^{2 a} および R^{2 b} は、一緒になって C₂ ~ C₅ アルカンジイルとされ；

G は、- C (R^{2 a}) R^{2 b} - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、R³ から選択される 3 つ以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニルであり；

R³ は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₅ シアノアルコキシ、C₂ ~ C₅ アルキニルオキシ、C₂ ~ C₅ アルケニル、C₁ ~ C₅ アルキル、C₁ ~ C₅ ハロアルキル、C₁ ~ C₅ アルコキシ、C₁ ~ C₅ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₅ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、C₂ ~ C₅ アルコキシカルボニルまたは C₃ ~ C₁₂ トリアルキルシリルであり；

R⁴ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

40

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R⁶ は C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R⁷ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R⁸ は、H、C₁ ~ C₂ アルキルまたは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；

R⁹ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R¹⁰ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R¹¹ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

m は 0、1 または 2 であり；

Q は、1 個以下の O 原子、1 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 4 個以下のヘテロ原子ならびに炭素原子から選択される環員を含有する 5 員不飽和

50

または部分飽和複素環であり、2個以下の炭素原子環員はC(=O)から独立して選択され、前記環は、任意選択により、芳香族複素環と前記式1の残部とを結合する環員から遠位の環員において1つの置換基で置換され、前記任意選択の置換基は、炭素原子環員上の R^{12c} および窒素原子環員上の R^{12n} から選択され、前記複素環はさらに、任意選択により、炭素原子環員上の R^{13c} および窒素原子環員上の R^{13n} から選択される置換基で置換され；

各 R^{12c} は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシもしくは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであり；または、 R^{14} から独立して選択される5個以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル環であり；または、炭素原子環員上の R^{15c} および窒素原子環員上の R^{15n} から独立して選択される4個以下の置換基で任意選択により置換される芳香族複素環であり；または

隣接する炭素原子に結合して2個の R^{12c} は、炭素原子環員と一緒にあって、5員または6員炭素環または部分芳香族環を形成し；

各 R^{12n} は、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；または、 R^{16} から独立して選択される5個以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル環であり；または、炭素原子環員上の R^{17c} および窒素原子環員上の R^{17n} から独立して選択される4個以下の置換基で任意選択により置換される芳香族複素環であり；

各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^{13n} は、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立してハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシであり；ならびに

各 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシである)

から選択される化合物、そのN-オキシドおよび塩。

【請求項2】

ZがOであり；

R^1 が、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであり；または、炭素原子、1個のO原子および1個のS原子から選択される環員を含有する4員～5員環であり；

R^{2a} が、H、 CH_3 、 CF_3 または CHF_2 であり；

R^{2b} がHもしくは CH_3 であり；または

R^{2a} および R^{2b} が、一緒にあって、 C_2 または C_3 アルカンジイルとされ；

Gが、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される2個以下の置換基で任意選択により置換されたフェニルまたはピリジニルであり；

R^3 ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル；

R^4 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^5 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^6 が CH_3 であり；

R^7 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^8 がHまたは CH_3 であり；

R^9 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^{10} が、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；

R^{11} が、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；

10

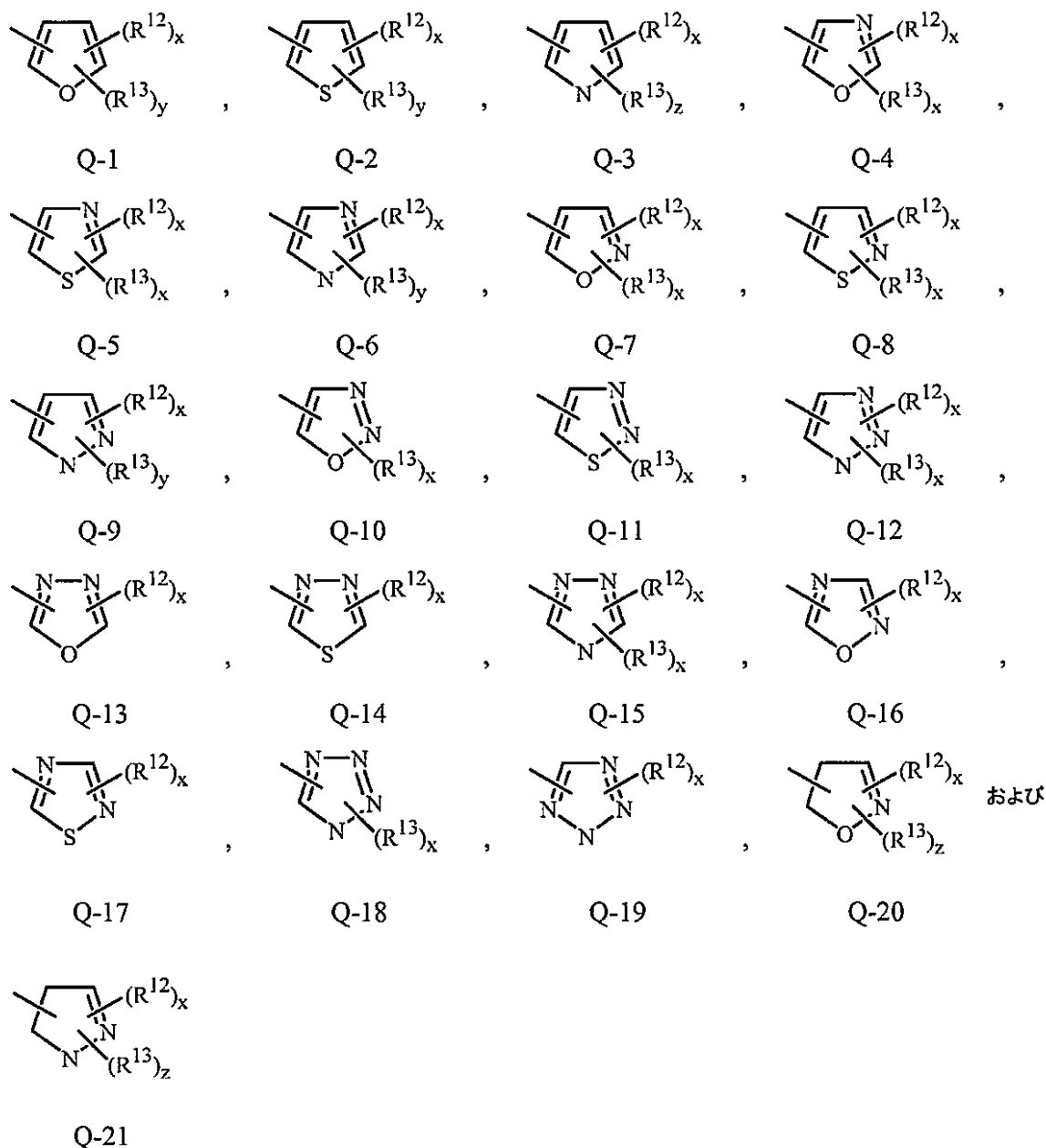
20

30

40

50

Q が、
【化 3】



10

20

30

から選択され；

各 R^{12c} が、独立してハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシであり；

各 R^{12n} が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

各 R^{13c} が、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシであり；

各 R^{13n} が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} が、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；ならびに

R^{15n} および R^{17n} が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

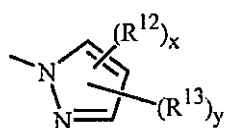
40

50

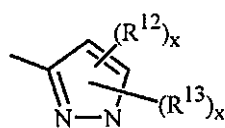
A が、A - 1、A - 2、A - 3 および A - 4 からなる群から選択され；
 R^1 が、シクロプロピルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員環であり；
 R^{2a} が、H、F または CH_3 であり；
 R^{2b} が H であり；または
 R^{2a} および R^{2b} が、一緒になって、 C_2 アルカンジイルとされ；
 G が、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたフェニルまたはピリジニルであり；
 R^3 が、ハロゲン、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 CH_2CH_2O 10
 CH_3 またはシクロプロピルであり；
 R^4 が、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^5 が、H、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 R^7 が、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^9 が、F、Cl、Br、 CHF_2 または CF_3 であり；
 Q が Q - 1 ~ Q - 19 から選択され；
 R^{12c} が、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^{12n} が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；
 各 R^{13c} が、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 各 R^{13n} が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり； 20
 各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} が、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；ならびに
 各 R^{15n} および R^{17n} が、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルである、
 請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

A が、A - 1、A - 2 および A - 3 からなる群から選択され；
 R^1 が、シクロプロピル、3 - オキセタニルまたは 3 - チエタニルであり；
 G が、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたフェニル 30
 であり；
 R^3 が、Cl、Br、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 またはシクロプロピルであり；
 R^4 が、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 R^5 が F または Cl であり；
 R^7 が、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 R^9 が、F、Cl、Br、 CHF_2 または CF_3 であり；
 Q が、
 【化 4】

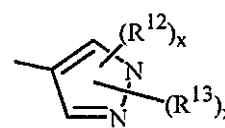


Q-9A



Q-9B

および



Q-9C

40

から選択され；

各 R^{12c} が、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 各 R^{12n} が CH_3 であり；
 各 R^{13c} が、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 各 R^{13n} が CH_3 であり；および 50

各 R^{15n} および R^{17n} が CH_3 である、
請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

A が、A - 1 および A - 2 からなる群から選択され；
 R^1 がシクロプロピルであり；
 G が、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてパラ位において Q で置換され、および、 R^3 で置換されていないフェニルであり；
 R^4 が CHF_2 であり；
 Q が、Q - 9 A および Q - 9 B から選択され；および
 R^{12c} が CF_3 である、
 請求項 2 に記載の化合物。

10

【請求項 6】

A が A - 1 であり；
 R^1 がシクロプロピルであり；
 G が、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたピリジニルであり；
 R^3 が Cl であり；
 R^4 が CHF_2 であり；
 Q が Q - 9 A であり；および
 R^{12c} が CF_3 である、
 請求項 3 に記載の化合物。

20

【請求項 7】

N - [[2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド；および
 N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [[3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド
 からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 8】

(a) 請求項 1 に記載の化合物と；(b) 少なくとも 1 種の他の殺菌・殺カビ剤とを含む殺菌・殺カビ組成物。

【請求項 9】

(a) 請求項 1 に記載の化合物と；(b) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加のコンポーネントとを含む殺菌・殺カビ組成物。

【請求項 10】

真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法であって、前記植物もしくはその一部または前記植物種子に、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物を適用するステップを含む方法。

40

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、一定の殺菌・殺カビ性アミド、その N - オキシド、塩および組成物、ならびに、殺菌・殺カビ剤としてのその使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害の防除は、高い作物効率を達成するためにきわめて重要である。観葉植物、野菜、農作物、穀類および果実作物に対する植物

50

病害による損害は生産性を著しく低下させ、これにより、消費者に対するコストが増加してしまう可能性がある。これらの目的のために多くの製品が市販されているが、より効果的であり、より安価であり、毒性が低く、環境に対して安全であり、または、異なる作用部位を有する新規化合物に対する要求が継続して存在している。

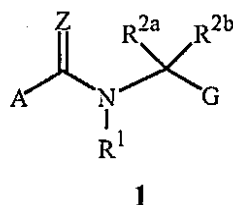
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明は、式1の化合物（すべての立体異性体を含む）、そのN - オキシドおよび塩、これらを含む農業組成物、ならびに、殺菌・殺カビ剤としてのこれらの使用に関し：

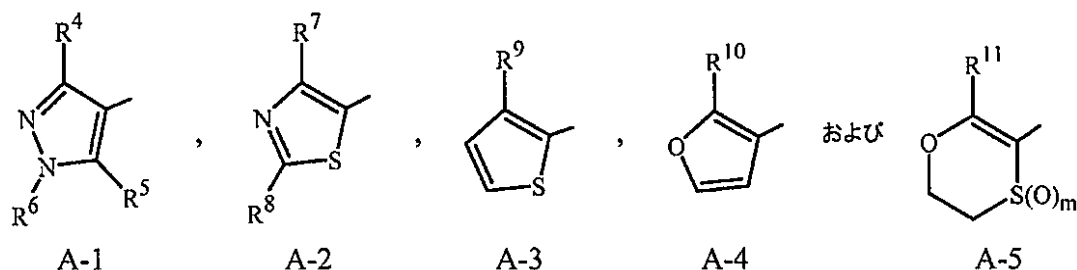
【化1】



式中、

A は、

【化2】



からなる群から選択されるラジカルであり、

【0004】

Z は O または S であり；

R¹ は、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含む 4 員 ~ 6 員環であり；

R^{2a} および R^{2b} は、各々独立して、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルもしくは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；または

R^{2a} および R^{2b} は、一緒になって C₂ ~ C₅ アルカンジイルとされ；

G は、- C (R^{2a}) R^{2b} - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、R³ から選択される 3 つ以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニルであり；

R³ は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₅ シアノアルコキシ、C₂ ~ C₅ アルキニルオキシ、C₂ ~ C₅ アルケニル、C₁ ~ C₅ アルキル、C₁ ~ C₅ ハロアルキル、C₁ ~ C₅ アルコキシ、C₁ ~ C₅ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₅ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、C₂ ~ C₅ アルコキシカルボニルまたは C₃ ~ C₁₂ トリアルキルシリルであり；

R⁴ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R⁵ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R⁶ は C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R⁷ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

R⁸ は、H、C₁ ~ C₂ アルキルまたは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；

R⁹ は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルであり；

10

20

30

40

50

R^{10} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

R^{11} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

m は 0、1 または 2 であり；

Q は、1 個以下の O 原子、1 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 4 個以下のヘテロ原子ならびに炭素原子から選択される環員を含有する 5 員不飽和または部分飽和複素環であり、2 個以下の炭素原子環員は $C(=O)$ から独立して選択され、環は、任意選択により、芳香族複素環と式 1 の残部とを結合する環員から遠位の環員において 1 つの置換基で置換され、前記任意選択の置換基は、炭素原子環員上の R^{12c} および窒素原子環員上の R^{12n} から選択され、複素環はさらに、任意選択により、炭素原子環員上の R^{13c} および窒素原子環員上の R^{13n} から選択される置換基で置換され；

各 R^{12c} は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシもしくは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニルであり；または、 R^{14} から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル環であり；または、炭素原子環員上の R^{15c} および窒素原子環員上の R^{15n} から独立して選択される 4 個以下の置換基で任意選択により置換される芳香族複素環であり；または

隣接する炭素原子に結合して 2 個の R^{12c} は、炭素原子環員と一緒にあって、5 員または 6 員炭素環または部分芳香族環を形成し；

各 R^{12n} は、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；または、 R^{16} から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル環であり；または、炭素原子環員上の R^{17c} および窒素原子環員上の R^{17n} から独立して選択される 4 個以下の置換基で任意選択により置換される芳香族複素環であり；

各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^{13n} は、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立してハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシであり；および

各 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシである。

【0005】

より具体的には、本発明は、式 1 の化合物（すべての立体異性体を含む）、その N - オキシドまたは塩に関する。

【0006】

本発明はまた、(a) 本発明の化合物（すなわち、殺菌・殺力比的に有効な量で）と；(b) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加のコンポーネントとを含む殺菌・殺力比組成物に関する。

【0007】

本発明はまた、(a) 本発明の化合物と；(b) 少なくとも 1 種の他の殺菌・殺力比剤（例えば、異なる作用部位を有する少なくとも 1 種の他の殺菌・殺力比剤）とを含む殺菌・殺力比組成物に関する。

【0008】

本発明は、植物もしくはその一部または植物種子に、殺菌・殺力比的に有効な量の本発明の化合物を（例えば、本明細書に記載の組成物として）適用するステップを含む、真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法にさらに関する。

【発明を実施するための形態】

【0009】

10

20

30

40

50

本明細書において用いられるところ、「を含む (comprises)」、「を含んでいる (comprising)」、「を含む (includes)」、「を含んでいる (including)」、「を有する」、「を有している」、「を含有する」、「を含有している」、「により特徴付けられる」という用語、または、そのいずれかの他の変化形は、明示的に示されている任意の限定を条件として、非排他的な包含をカバーすることが意図されている。例えば、要素の一覧を含む組成物、混合物、プロセス、方法、物品または装置は、必ずしもこれらの要素にのみ限定されることはなく、明示的に列挙されていないか、または、このような組成物、混合物、プロセス、方法、物品もしくは装置に固有とされる他の要素が包含されていてもよい。

【0010】

10

「からなる (consisting of)」という移行句は、特定されていない任意の要素、ステップまたは成分を除外する。特許請求の範囲中にある場合、このような句は、特許請求の範囲を、通常関連する不純物類を除き、言及されたもの以外の材料の包含を限定するであろう。「からなる (consisting of)」という句が、プリアンブルの直後ではなく特許請求の範囲の本文の一文節中にある場合、これは、その文節中に規定されている要素のみを限定し；他の要素は、特許請求の範囲からは、全体としては除外されない。

【0011】

20

「基本的にかからなる (consisting essentially of)」という移行句は、文字通り開示されているものに追加して、材料、ステップ、機構、コンポーネントまたは要素を含む組成物、方法または装置を定義するために用いられているが、ただし、これらの追加の材料、ステップ、機構、コンポーネントまたは要素は、特許請求された発明の基本的および新規特徴に実質的に影響をおよぼさない。「基本的にかからなる (consisting essentially of)」という用語は、「を含んでいる (comprising)」と、「からなる (consisting of)」との間の中間点を構成する。

【0012】

30

出願人らが、「を含んでいる (comprising)」などのオープンエンド形式の用語で発明またはその一部分を定義している場合、その記載は（別段の定めがある場合を除き）、「基本的にかからなる (consisting essentially of)」または「からなる (consisting of)」という用語を用いてこのような発明を記載しているとも解釈されるべきであると、直ちに理解されるべきである。

【0013】

さらに、反する記載が明白にされていない限り、「あるいは、または、もしくは」は包含的論理和を指し、そして排他的論理和を指さない。例えば、条件AまたはBは、以下のいずれか1つによって満たされる：Aが真であり（または存在する）、そしてBが偽である（または存在しない）；Aが偽であり（または存在しない）、そしてBが真である（または存在する）；ならびに、AおよびBの両方が真である（または存在する）。

【0014】

40

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、要素または成分の事例（すなわち、存在）の数に関して比制限的であることが意図される。従って、「a」または「an」は、1つまたは少なくとも1つ、を含むと読解されるべきであり、要素または成分の単数形の語形は、その数が明らかに単数を意味しない限りにおいては複数をも包含する。

【0015】

本開示および特許請求の範囲において言及されるとおり、「植物」とは、幼植物（例えば、実生に成長する発芽種子）および成熟した生殖成長期（例えば、花および種子をもたらす植物）を含むすべてのライフステージにおける、植物界の構成員、特に種子植物（種子植物目 (Spermatopsida)）を含む。植物の一部分は、典型的には成長培地（例えば、土壌）の表面下で成長する、根、塊茎、鱗茎および球茎などの屈地性の構成

50

員、ならびに、成長培地上で成長する、群葉（茎および葉を含む）、花、果実および種子などの構成員をも含む。本明細書において言及されるとおり、単独または複合語で用いられる「実生」という用語は、種子の胚芽から成長する幼植物を意味する。本開示の文脈において、植物病害防除とは、病原体により引き起こされる病害から植物を予防的および／または治療的に保護することを指す。この開示において言及されているとおり、「真菌性病原体」および「真菌性植物病原体」という用語は、観賞植物、芝生、野菜、圃場、穀類および果実作物に影響を与える、経済的に重要である広範囲の植物病害の病因である、子囊菌門、担子菌門および接合菌門、ならびに、真菌様卵菌門における病原体を含む。この開示の文脈において、「病害からの植物の保護」または「植物病害の防除」は、予防的作用（感染の真菌性サイクル、コロニー形成、病徴発現および胞子形成の妨害）および／または治療的作用（植物宿主組織のコロニー形成の阻害）を含む。

10

【0016】

この開示において言及されているとおり、作用機構（MOA）という用語は、Fungicide Resistance Action Committee（FRAC）によって広く定義されており、殺菌・殺カビ剤グループを、植物病原体の生合成経路における生化学的作用機構に従って区別するために用いられる。これらのFRACにより定義されているMOAは、（A）核酸合成、（B）有糸分裂および細胞分裂、（C）呼吸、（D）アミノ酸およびタンパク質合成、（E）シグナル伝達、（F）脂質合成および膜統合性、（G）膜におけるステロール生合成、（H）膜における細胞壁生合成、（I）細胞壁におけるメラニン合成、（P）宿主植物の抵抗性誘導、多部位接触活性、ならびに、不明な作用形態である。各MOAクラスは、個別の有効な標的作用部位に基づいて、または、正確な標的部位が不明である場合には、グループにおける交差耐性プロファイル、もしくは、他のグループとの関連に基づいて1つ以上のグループを構成する。FRACにより定義されたMOAにおけるこれらのグループ化の各々は、標的部位が既知であるか不明であるかに関わらず、FRACコードによって指定されている。標的部位およびFRACコードに対する追加の情報は、例えば、FRACによって管理されている公開データベースから入手可能である。

20

【0017】

この開示において言及されているとおり、「交差耐性」という用語は、病原体が、1種の殺菌・殺カビ剤に対する耐性を得、これに加えて、他の殺菌・殺カビ剤に対する耐性を獲得する現象を指す。これらの追加の殺菌・殺カビ剤は、常にではないが、典型的には、同一の化学的クラスにあり、同一の作用標的部位を有し、または、同一のメカニズムにより解毒可能である。

30

【0018】

上記の言及において、「アルキル」という用語は、単独または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」などの複合語で用いられて、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたは異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体などの直鎖または分岐アルキルを含む。「アルケニル」としては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、ならびに、異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体などの直鎖もしくは分岐アルケンが挙げられる。「アルケニル」としてはまた、1, 2-プロパジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンが挙げられる。「アルキニル」としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、ならびに、異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシル異性体などの直鎖または分岐アルキンが挙げられる。「アルキニル」としてはまた、2, 5-ヘキサジイニルなどの複数の三重結合を含む部分が挙げられる。「アルカンジイル」は直鎖または分岐アルキレンを表す。「アルカンジイル」の例としては、 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ および異なるブチレン異性体が挙げられる。「トリアルキルシリル」としては、トリメチルシリル、トリエチルシリルおよびt-ブチルジメチルシリルなどのケイ素原子を介して結合してリンクされている3つの分岐および／または直鎖アルキルラジカルが挙げられる。「アルコキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ

40

50

および異なるプトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が挙げられる。「アルコキシアルキル」は、アルキルにおけるアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシにおけるアルコキシ置換を表す。「アルケニルオキシ」としては、直鎖または分岐アルケニルオキシ部分が挙げられる。「アルケニルオキシ」の例としては、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「アルキニルオキシ」としては、直鎖または分岐アルキニルオキシ部分が挙げられる。「アルキニルオキシ」の例としては、 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ および $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「アルキルチオ」としては、メチルチオ、エチルチオおよび異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体などの分岐または直鎖アルキルチオ部分が挙げられる。「アルキルスルフィニル」としては、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが挙げられる。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ および異なるブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 、および、異なるブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキルにおけるアルキルチオ置換を表す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルチオアルコキシ」は、アルコキシにおけるアルキルチオ置換を表す。「アルキルジチオ」は、分岐または直鎖アルキルジチオ部分を表す。「アルキルジチオ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{SS}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SS}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SS}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHSS}-$ および異なるブチルジチオおよびペンチルジチオ異性体が挙げられる。「シアノアルキル」は、1個のシアノ基で置換されたアルキル基を表す。「シアノアルキル」の例としては、 NCCH_2 、 NCCH_2CH_2 および $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$ が挙げられる。「シアノアルコキシ」、「ジアルキルアミノ」、「アルケニルチオ」、「アルケニルスルフィニル」、「アルケニルスルホニル」、「アルキニルチオ」、「アルキニルスルフィニル」、「アルキニルスルホニル」等は、上記の例と同様に定義される。「シアノアルコキシ」の例としては、 CNCH_2O および $\text{CNCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。

10

20

30

40

50

【0019】

「シクロアルキル」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分におけるアルキル置換を表し、例えば、エチルシクロプロピル、*i*-プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分におけるシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および、直鎖または分岐アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルコキシ」という用語は、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシなどの酸素原子を介して結合されたシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に結合した酸素原子を介して結合されたシクロアルキルアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」の例としては、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシ、および、直鎖または分岐アルコキシ基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。

【0020】

単独で、または、「ハロアルキル」などの複合語で、「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。「ハロアルコキシ」は、用語「ハロアルキル」と同

様に定義される。

【0021】

置換基中の炭素原子の総数は、接頭辞「 $C_i \sim C_j$ 」によって示され、ここで、 i および j は 1 ~ 5 の数字である。例えば、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシは、 CH_3O- 、 CH_3CH_2O- 、 $CH_3CH_2CH_2O-$ および $(CH_3)_2CHO-$ を表す。

【0022】

「芳香族」は、環原子の各々が基本的に同一の面内にあり、環面に垂直な p - 軌道を有しており、ヒュッケルの法則に従うよう $(4n + 2)$ 個の電子 (n は正の整数である) が環に付随していることを表している。完全不飽和炭素環がヒュッケルの法則を満たす場合、前記環もまた「芳香族環」と呼ばれる。完全不飽和炭素環がヒュッケルの法則を満たす場合、前記環もまた「芳香族複素環」と呼ばれる。「非芳香族複素環」という用語は、環系中の環が芳香族ではない複素環系を表す。

10

【0023】

複素環に関連して「置換されていてもよい」という用語は、無置換であるか、または、無置換の類似体が有する生物学的活性を消失させない少なくとも 1 つの非水素置換基を有する基を指す。本明細書において用いられるところ、別段の定めがある場合を除き、以下の定義が適用される。「置換されていてもよい」という用語は、句「置換または無置換である」または用語「(無)置換である」と同義的に用いられる。別段の定めがある場合を除き、置換されていてもよい基は、その基の置換可能な位置の各々に置換基を有し得、置換の各々は相互に独立している。

20

【0024】

前記置換基の数が 1 を超えることが可能であることを示す下付文字を有する置換基で化合物が置換される場合、前記置換基は (1 を超える場合)、例えば、 $(R^3)_n$ といった定義されている置換基の群から独立して選択され、 n は、0、1、2 または 3 である。例えば R^{2a} といった、基が水素であることが可能である置換基を含有する場合、この置換基が水素とされる場合、これは前記基が無置換であることと同等であると認識される。例えば $(R^3)_n$ (式中、 n は 0 であり得る) といった可変である基が任意選択により 1 つの位置に結合していると示されている場合、この可変である基の定義において言及されていなくても、この位置には水素が存在していてもよい。ある基の 1 つ以上の位置が「置換されていない」または「無置換である」と記載されている場合、自由原子価をすべて埋めるために水素原子が結合している。

30

【0025】

本開示および特許請求の範囲によって言及されているところ、「不飽和複素環」は、少なくとも 2 個の環員原子が二重結合によって一緒に結合している複素環である。別段の定めがある場合を除き、「不飽和または部分飽和複素環」(例えば、置換基 Q) は、部分飽和または完全不飽和であり得る。「完全不飽和複素環」という表記は、環における炭素および/または窒素原子間の結合が原子価結合理論に従って単結合または二重結合であり、さらに、環における炭素および/または窒素原子間の結合が連続する二重結合を伴うことなく (すなわち、 $C = C = C$ 、 $N = C = C$ 等を含まない) 可能な限り多数の二重結合を含む原子の複素環を意味する。「部分飽和複素環」という用語は、二重結合を介して隣接する環員に結合する少なくとも 1 個の環員を含む複素環を表し、これは、概念的には、潜在的に、存在する二重結合の数 (すなわち、部分飽和形態) を超える多数の非集積二重結合を隣接する環員間に含んでいる (すなわち、完全不飽和カウンターパート形態)。発明の概要において、 R^1 は、とりわけ、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員 ~ 6 員環であることが可能である。この環は、炭素環であると理解され、1 個の O 原子または 1 個の S 原子から選択される非炭素環員を含む。炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員環の例としては、オキセタン環 (すなわち、2 - オキセタニルまたは 3 - オキセタニル) またはチエタン環 (すなわち、2 - チエタニルまたは 3 - チエタニル) が挙げられる。炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 5 員環の例としては、テトラヒド

40

50

ロフランまたはテトラヒドロチオフェンの種々の位置異性体が挙げられる。炭素原子、1個のO原子および1個のS原子から選択される環員を含有する6員環の例としては、ピランおよびチオピランの種々の位置異性体が挙げられる。これらの環の式1の残部に対する結合点は、いずれかの利用可能な自由原子価を有する炭素原子を介することが可能であることに注目すべきである。

【0026】

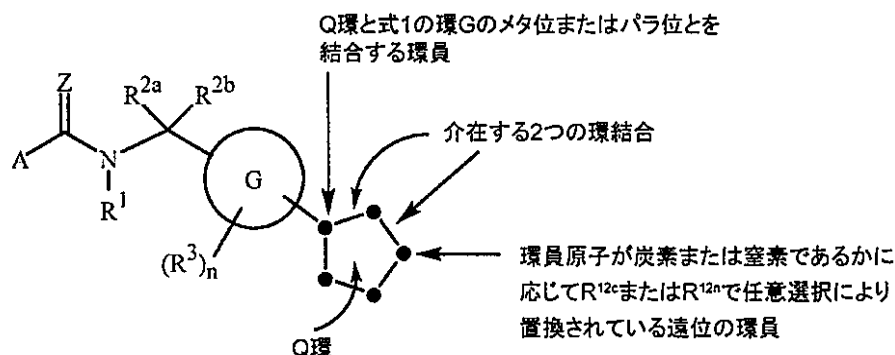
発明の概要において、Qの不飽和複素環は1個以下のO原子、1個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される4個以下のヘテロ原子ならびに炭素原子から選択される環員（式中、2個以下の炭素原子はC(=O)から独立して選択される）を伴う5員であると特定されている。複素環は、芳香族複素環と式1の残部とを結合する環員に対して遠位にある1個の環員における1個の置換基で任意選択により置換される。明細表1に記載されているとおり、Qの5員複素環において、環と式1の残部とを結合する環員に対して遠位にある環員は、結合している環員に対する2つの環結合を介して結合されている。Qの複素環はさらに、炭素原子環員上の R^{12c} および窒素原子環員上の R^{12n} から選択される置換基で任意選択により置換される。

【0027】

【化3】

明細表1

式1のQ環における任意選択の R^{12c} 置換



【0028】

Qを形成する一定の複素環は、置換に供されることが可能である2個の遠位の環員を有していてもよい。この状況においては、遠位の環員の一方のみが R^{12c} または R^{12n} で置換され得；他方の遠位の環員は、 R^{13c} または R^{13n} で置換され得る。Qを形成する複素環の遠位の環員のいずれもが置換に供されることが可能ではない場合、複素環におけるいずれかの追加の置換基が R^{13c} または R^{13n} 選択される。遠位の環員が2個の置換基を有することが可能である場合、一方の置換基は R^{12c} または R^{12n} から選択され得、他方の置換基は、 R^{13c} または R^{13n} から選択され得る。換言すると、Q環は、1個の R^{12c} または R^{12n} 置換基に限定され、この置換基は遠位の環員に結合していなければならない；そうでなければ、Q環は、いずれかの利用可能な環員において、 R^{13c} または R^{13n} でさらに置換されることが可能である。

【0029】

基（例えば環）における結合点が浮いて図示されている場合（例えば、明細表3において5員不飽和または部分飽和複素環Q-1～Q-21により例示されているとおり）、この基は、水素原子の置換により、その基いずれかの利用可能な炭素または窒素を介して式1の残部に結合可能である。基（例えば環）における置換基の結合点が浮いて図示されている場合（例えば、実施形態54の明細表3において、5員不飽和複素環Q-1～Q-21における R^{12} および R^{13} について例示されているとおり）、この置換基は、水素原子を置換することによりいずれかの利用可能な炭素または窒素原子に結合可能である。

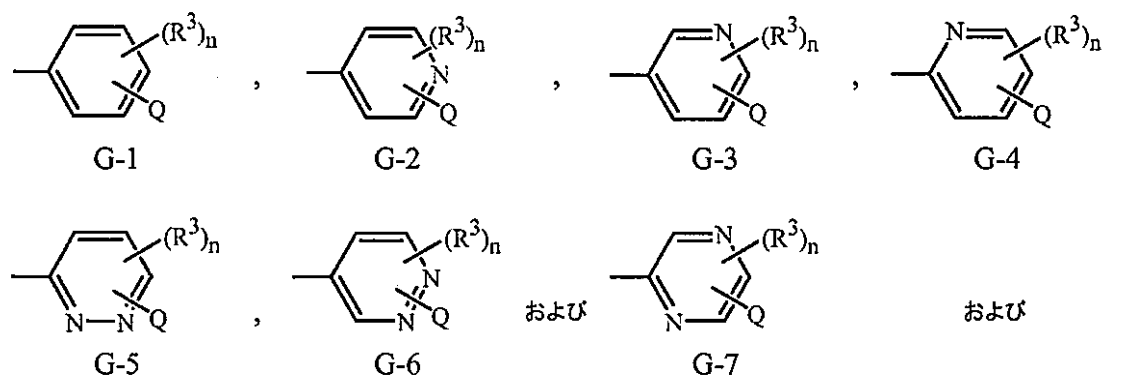
【0030】

発明の概要において、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される3個以下の置換基で任意選択により置換されるフェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニルであることが可能である。フェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニルの例が明細表2に示されている。

【0031】

【化4】

明細表2



$n=0, 1, 2$ または3である。

【0032】

芳香族および非芳香族複素環および環系の調製を実現する広く多様な合成方法が技術分野において公知である；広範な概説については、全8巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984、および、全12巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996を参照のこと。

【0033】

本発明の化合物は、1種以上の立体異性体として存在していることが可能である。立体異性体は、同等の構成ではあるが、空間における原子の配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス-トランス異性体（幾何異性体としても公知である）およびアストロブ異性体を含む。アトロブ異性体は、単結合に係る回転が制限され、この回転に係る障壁が異性体種の単離が可能となるほどに高い場合にもたらされる。当業者は、1種の立体異性体が、他の立体異性体と相対的に富化された場合、または、他の立体異性体から分離された場合に、より効果的であり得、および/または、有益な効果を発揮し得ることを認めるであろう。また、前記立体異性体をどのように分離し、富化し、および/または選択的に調製するかは当業者に公知である。立体異性のすべての態様に係る包括的な考察については、Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994を参照のこと。

【0034】

本発明は、すべての立体異性体、配座異性体およびすべての割合におけるこれらの混合物、ならびに、重水素化合物などの同位体形態を含む。

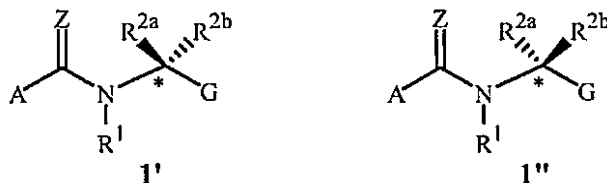
【0035】

本発明の化合物は、立体異性体の混合物、または、個別の立体異性体として存在し得る。例えば、 R^{2a} および R^{2b} が同一ではない場合、式1は、 R^{2a} および R^{2b} が結合する炭素原子にキラル中心を有する。2種のエナンチオマーが式1'および式1''として

図示されており、キラル中心がアスタリスク（*）で示されている。

【 0 0 3 6 】

【 化 5 】



10

【 0 0 3 7 】

明細書において描かれている分子の描写は立体化学の描写に係る標準的な慣例に従っている。立体構造を示すために、図面の紙面から上方に見ている者に向かって結合は黒塗りのくさびによって示されており、ここでは、くさびの幅広い側が見ている者に向かって図面の紙面の上方にある原子に結合している。図面の紙面の下方に向かって見ている者から離れていく結合は破線のかきによって示されており、ここでは、くさびの狭い側が見ている者からさらに離れている原子に結合している。一定幅の線は、黒塗りまたは破線のかきで示されている結合に対して、反対の方向またはどちらでもない方向の結合を示し；一定幅の線はまた、特定の立体構造を示すことが意図されていない分子または分子の一部における結合を示す。

20

【 0 0 3 8 】

本発明は、例えば、式 1' および 1'' のエナンチオマーが等量であるラセミ混合物を含む。加えて、本発明は、ラセミ混合物と比して式 1 のエナンチオマーで富化されている化合物を含む。また、例えば、式 1' および式 1'' といった式 1 の化合物の実質的に純粋なエナンチオマーが含まれる。

【 0 0 3 9 】

鏡像異性体的に富化されている場合、1 種のエナンチオマーは他のエナンチオマーよりも多量に存在しており、富化の程度は、 $(2x - 1) \cdot 100\%$ と定義される鏡像異性体過剰率（「ee」）の表記により定義されることが可能であり、式中、x は混合物中の主たるエナンチオマーのモル分率である（例えば、20% の ee は、エナンチオマーの 60 : 40 の比に相当する）。

30

【 0 0 4 0 】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体に関して、少なくとも 50% 鏡像異性体過剰率；より好ましくは少なくとも 75% の鏡像異性体過剰率を有し；さらにより好ましくは少なくとも 90% の鏡像異性体過剰率を有し；および、最も好ましくは少なくとも 94% の鏡像異性体過剰率を有する。特に注目すべきは、より活性な異性体の鏡像異性体的に純粋な実施形態である。

【 0 0 4 1 】

式 1 の化合物は追加のキラル中心を有していることが可能である。例えば、R¹ などの置換基および他の分子成分は、それら自身がキラル中心を含有するものであってもよい。本発明は、これらの追加のキラル中心に関して、ラセミ混合物、ならびに、富加された実質的に純粋な立体構造を含む。

40

【 0 0 4 2 】

本発明の化合物は、式 1 におけるアミド結合（例えば、AC(=Z)-N）に係る回転の制限により 1 種以上の配座異性体として存在することが可能である。本発明は、配座異性体の混合物を含む。加えて、本発明は、一方の配座異性体が他方と比して富加された化合物を含む。

【 0 0 4 3 】

当業者は、窒素は酸化物への酸化のために利用可能な孤立電子対を必要とするため、すべての窒素含有複素環が N - オキシドを形成可能ではないことを認めるであろう；当業者

50

は、N - オキシドを形成可能である窒素含有複素環を認識するであろう。当業者はまた、第三級アミンはN - オキシドを形成可能であることを認識するであろう。複素環のN - オキシドおよび第三級アミンの調製に係る合成方法は当業者によりきわめて周知であり、過酢酸およびm - クロロ安息香酸 (MCPBA) などのペルオキシ酸、過酸化水素、t - ブチルヒドロ過酸化物などのアルキルヒドロ過酸化物、過ホウ酸ナトリウム、ならびに、ジメチルジオキシランなどのジオキシランによる複素環および第三級アミンの酸化が含まれる。N - オキシドの調製に係るこれらの方法は、文献中において広範に記載および概説されており、例えば：T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748 - 750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18 - 20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149 - 161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285 - 291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; および、G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390 - 392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press. を参照のこと。

10

20

30

40

50

【0044】

当業者は、環境において、および、生理的条件下では、化学化合物の塩は対応する非塩形態と平衡状態にあるため、塩は、非塩形態の生物学的実用性を共有することを認識している。それ故、式1の化合物の広く多様な塩が、真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害の防除に有用である（すなわち、農学的に好適である）。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4 - トルエンスルホン酸または吉草酸などの無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がカルボン酸またはフェノールなどの酸性部分を含有する場合、塩としてはまた、ピリジン、トリエチルアミンもしくはアンモニアなどの有機もしくは無機塩基と形成されるもの、または、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムもしくはバリウムのアミド、水素化物、水酸化物もしくは炭酸塩が挙げられる。従って、本発明は、式1から選択される化合物、そのN - オキシドおよび農学的に好適な塩を含む。

【0045】

式1、その立体異性体、互変異性体、N - オキシドおよび塩から選択される化合物は、典型的には、2つ以上の形態で存在し、式1は、それ故、式1が表す化合物のすべての結晶形態および非結晶形態を含む。非結晶形態は、ワックスおよびガムなどの固形分である実施形態、ならびに、溶液および熔融物などの液体である実施形態を含む。結晶形態は、基本的に単結晶タイプを表す実施形態、および、異形体の混合物を表す実施形態（すなわち、異なる結晶性タイプ）を含む。「異形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化可能である化学化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異なる配置および/または配座を有する。異形体は同一の化学的組成を有していることが可能であるが、これらはまた、格子中に弱くまたは強固に結合していることが可能である共結晶化水または他の分子の存在または不在により組成が異なっていることが可能である。異形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸垂性、溶解速度および生物学的利用可能性と同様にこのような化学的、物理的および生物学的特性が異なっていることが可能である。当業者は、式1によって表される化合物の異形体は、式1によ

って表される同一の化合物の他の異形体または異形体の混合物と比して、有益な効果（例えば、有用な配合物の調製に対する適合性、向上した生物学的性能）を示す可能性があることを認めるであろう。式1によって表される化合物の特定の異形体の調製および単離は、例えば、選択された溶剤および温度を用いる結晶化を含む当業者に公知の方法により達成されることが可能である。多形に関する包括的な考察については、R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006を参照のこと。

【0046】

発明の概要に記載の本発明の実施形態は以下を含む（以下の実施形態において用いられる式1がそのN-オキシドおよび塩を含む場合）。

10

【0047】

実施形態1．式1の化合物であって、式中、Aは、A-1、A-2、A-3およびA-4からなる群から選択される。

【0048】

実施形態2．式1または実施形態1の化合物であって、式中、Aは、A-1、A-2およびA-3からなる群から選択される。

【0049】

実施形態3．式1または実施形態1および2のいずれか1つの化合物であって、式中、Aは、A-1およびA-2からなる群から選択される。

20

【0050】

実施形態4．式1または実施形態1～3のいずれか1つの化合物であって、式中、AはA-2である。

【0051】

実施形態5．式1または実施形態1～3のいずれか1つの化合物であって、式中、AはA-1である。

【0052】

実施形態6．式1または実施形態1～5のいずれか1つの化合物であって、式中、ZはOである。

【0053】

実施形態7．式1または実施形態1～6のいずれか1つの化合物であって、式中、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される2個以下の置換基で任意選択により置換されたフェニルまたはピリジニルである。

30

【0054】

実施形態8．実施形態7の化合物であって、式中、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される1つの置換基で任意選択により置換されたフェニルまたはピリジニルである。

【0055】

実施形態9．実施形態8の化合物であって、式中、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、 R^3 から選択される1つの置換基で任意選択により置換されたフェニルである。

40

【0056】

実施形態10．実施形態9の化合物であって、式中、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてパラ位においてQで置換されたフェニルである（すなわち、 R^3 で置換されていない）。

【0057】

実施形態10a．実施形態9の化合物であって、式中、Gは、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ -ラジカルを基準としてパラ位においてQで置換され、および、 R^3 で置換されていないフェニルである。

【0058】

50

実施形態 11 . 実施形態 8 の化合物であって、式中、G は、 $-C(R^{2a})R^{2b}-$ ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたピリジニルである。

【0059】

実施形態 12 . 実施形態 11 の化合物であって、式中、G は、 $-C(R^{2a})R^{2b}-$ ラジカルを基準としてパラ位において Q で置換されたピリジニルである（すなわち、 R^3 で置換されていない）。

【0060】

実施形態 13 . 式 1 または実施形態 1 ~ 12 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^1 は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員 ~ 5 員環である。

10

【0061】

実施形態 14 . 実施形態 13 の化合物であって、式中、 R^1 はシクロプロピルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員環である。

【0062】

実施形態 15 . 実施形態 14 の化合物であって、式中、 R^1 は、シクロプロピル、3 - オキセタニルまたは 3 - チエタニルである。

【0063】

実施形態 16 . 実施形態 15 の化合物であって、式中、 R^1 はシクロプロピルである。

20

【0064】

実施形態 17 . 式 1 または実施形態 1 ~ 16 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^{2a} は、H、 CH_3 、 CF_3 または CHF_2 である。

【0065】

実施形態 18 . 実施形態 17 の化合物であって、式中、 R^{2a} は、H、F または CH_3 である。

【0066】

実施形態 19 . 実施形態 18 の化合物であって、式中、 R^{2a} は H である。

【0067】

実施形態 20 . 実施形態 18 の化合物であって、式中、 R^{2a} は F である。

30

【0068】

実施形態 21 . 実施形態 18 の化合物であって、式中、 R^{2a} は CH_3 である。

【0069】

実施形態 22 . 式 1 または実施形態 1 ~ 21 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^{2b} は、H または CH_3 である。

【0070】

実施形態 23 . 実施形態 22 の化合物であって、式中、 R^{2b} は H である。

【0071】

実施形態 24 . 式 1 または実施形態 1 ~ 16 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^{2a} および R^{2b} が一緒とされる場合、これらは、一緒になって、 C_2 または C_3 アルカンジイルとされる。

40

【0072】

実施形態 25 . 実施形態 24 の化合物であって、式中、 R^{2a} および R^{2b} は、一緒になって、 C_2 アルカンジイルとされる（すなわち、 R^{2a} および R^{2b} は、これらが結合している炭素と共に一緒になってシクロプロピル環を形成する）。

【0073】

実施形態 26 . 式 1 または実施形態 1 ~ 9、11 もしくは 13 ~ 25 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルである。

50

【 0 0 7 4 】

実施形態 27 . 実施形態 26 の化合物であって、式中、 R^3 は、ハロゲン、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ またはシクロプロピルである。

【 0 0 7 5 】

実施形態 28 . 実施形態 27 の化合物であって、式中、 R^3 は、 Cl 、 Br 、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 またはシクロプロピルである。

【 0 0 7 6 】

実施形態 29 . 実施形態 28 の化合物であって、式中、 R^3 は Cl である。

【 0 0 7 7 】

実施形態 30 . 式 1 または実施形態 1 ~ 3 もしくは 5 ~ 29 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^4 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

10

【 0 0 7 8 】

実施形態 31 . 実施形態 30 の化合物であって、式中、 R^4 は、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【 0 0 7 9 】

実施形態 32 . 実施形態 31 の化合物であって、式中、 R^4 は、 F 、 Cl 、 Br 、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

20

【 0 0 8 0 】

実施形態 33 . 実施形態 32 の化合物であって、式中、 R^4 は CHF_2 である。

【 0 0 8 1 】

実施形態 34 . 式 1 または実施形態 1 ~ 3 もしくは 5 ~ 33 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^5 は、 H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

【 0 0 8 2 】

実施形態 35 . 実施形態 34 の化合物であって、式中、 R^5 は、 H 、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【 0 0 8 3 】

実施形態 36 . 実施形態 35 の化合物であって、式中、 R^5 は、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

30

【 0 0 8 4 】

実施形態 37 . 実施形態 36 の化合物であって、式中、 R^5 は、 F または Cl である。

【 0 0 8 5 】

実施形態 38 . 式 1 または実施形態 1 ~ 3 もしくは 5 ~ 37 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^6 は CH_3 である。

【 0 0 8 6 】

実施形態 39 . 式 1 または実施形態 1 ~ 4 もしくは 6 ~ 29 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^7 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

40

【 0 0 8 7 】

実施形態 40 . 実施形態 39 の化合物であって、式中、 R^7 は、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【 0 0 8 8 】

実施形態 41 . 実施形態 40 の化合物であって、式中、 R^7 は、 F 、 Cl 、 Br 、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【 0 0 8 9 】

実施形態 42 . 式 1 または実施形態 1 ~ 4 もしくは 6 ~ 29 もしくは 39 ~ 41 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^8 は、 H または CH_3 である。

【 0 0 9 0 】

50

実施形態 43 . 式 1 または実施形態 1、2 もしくは 6 ~ 29 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

【0091】

実施形態 44 . 実施形態 43 の化合物であって、式中、 R^9 は、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【0092】

実施形態 45 . 実施形態 44 の化合物であって、式中、 R^9 は、F、Cl、Br、 CHF_2 または CF_3 である。

【0093】

実施形態 46 . 式 1 または実施形態 1 の化合物であって、式中、 R^{10} は、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0094】

実施形態 47 . 式 1 の化合物であって、式中、 R^{11} は、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0095】

実施形態 48 . 式 1 または実施形態 47 の化合物であって、式中、 m は 0 または 2 である。

【0096】

実施形態 49 . 式 1 または実施形態 1 ~ 48 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、複素環 Q は少なくとも 1 つの窒素原子環員を含有する。

【0097】

実施形態 50 . 実施形態 49 の化合物であって、式中、複素環 Q は 2 つの窒素原子環員を含有する。

【0098】

実施形態 51 . 式 1 または実施形態 1 ~ 50 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、複素環 Q は完全不飽和である（すなわち芳香族複素環式である）。

【0099】

実施形態 52 . 式 1 または実施形態 1 ~ 51 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、複素環 Q は、フラン、チオフェン、ピロール、オキサゾール、チアゾール、イミダゾール、イソオキサゾール、イソチアゾール、ピラゾール、1, 2, 4 - オキサジアゾール、1, 2, 5 - オキサジアゾール、1, 3, 4 - オキサジアゾール、1, 2, 4 - チアジアゾール、1, 2, 5 - チアジアゾール、1, 3, 4 - チアジアゾール、1, 2, 3 - トリアゾール、1, 2, 4 - トリアゾール、テトラゾール、4, 5 - ジヒドロイソキサゾールおよび 4, 5 - ジヒドロピラゾールから選択される。

【0100】

実施形態 53 . 実施形態 52 の化合物であって、式中、複素環 Q は、ピラゾールから選択される。

【0101】

実施形態 54 . 実施形態 51 の化合物であって、式中、Q は、明細表 3 に示されている Q - 1 ~ Q - 21 から選択される。

【0102】

10

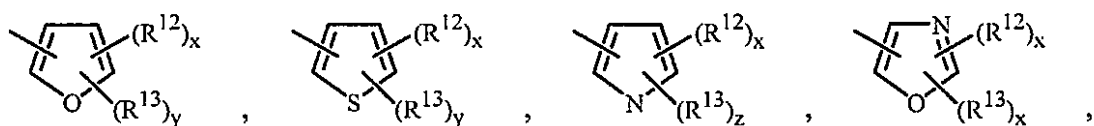
20

30

40

【化 6】

明細表3



Q-1

Q-2

Q-3

Q-4



Q-5

Q-6

Q-7

Q-8

10

【 0 1 0 3】

【化 7】



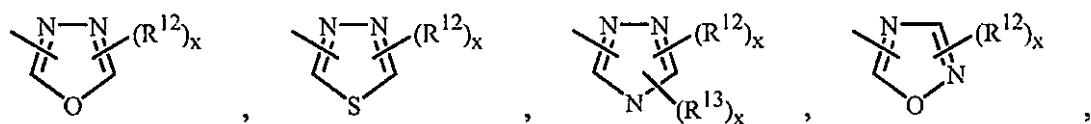
Q-9

Q-10

Q-11

Q-12

20

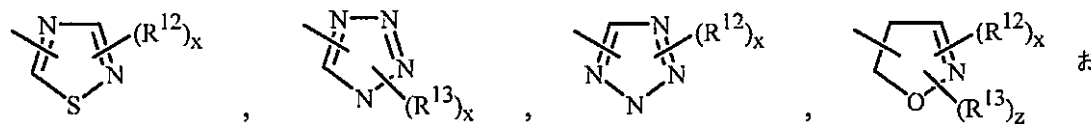


Q-13

Q-14

Q-15

Q-16



Q-17

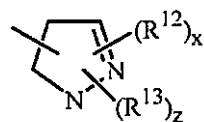
Q-18

Q-19

Q-20

および

30



Q-21

40

(式中、

R^{12} は、Q 環と式 1 の残部とを結合する環員を基準として遠位の環員に結合されており、炭素原子環員上の R^{12c} および窒素原子環員上の R^{12n} から独立して選択され；
各 R^{13} は、炭素原子環員上の R^{13c} および窒素原子環員上の R^{13n} から独立して選択され；

各 x は、独立して、0 または 1 であり；

各 y は、独立して、0、1 または 2 であり；および

各 z は、独立して、0、1、2 または 3 である。）

【 0 1 0 4】

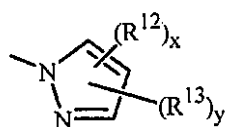
実施形態 55、実施形態 54 の化合物であって、式中、Q は、Q - 1 ~ Q - 19 から選択される。

50

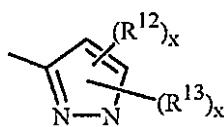
【 0 1 0 5 】

実施形態 5 6 . 実施形態 5 5 の化合物であって、式中、Q は、

【 化 8 】

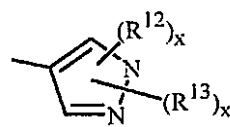


Q-9A



Q-9B

および



Q-9C

から選択される。

10

【 0 1 0 6 】

実施形態 5 7 . 実施形態 5 6 の化合物であって、式中、Q は、Q - 9 A および Q - 9 B から選択される。

【 0 1 0 7 】

実施形態 5 8 . 実施形態 5 7 の化合物であって、式中、Q は Q - 9 A である。

【 0 1 0 8 】

実施形態 5 9 . 実施形態 5 6 ~ 5 8 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、y は 0 または 1 である。

【 0 1 0 9 】

実施形態 6 0 . 式 1 または実施形態 1 ~ 5 9 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{12c} は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシである。

20

【 0 1 1 0 】

実施形態 6 1 . 実施形態 6 0 の化合物であって、式中、各 R^{12c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【 0 1 1 1 】

実施形態 6 2 . 実施形態 6 1 の化合物であって、式中、各 R^{12c} は、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【 0 1 1 2 】

実施形態 6 3 . 実施形態 6 2 の化合物であって、式中、各 R^{12c} は、独立して、 CF_3 である。

30

【 0 1 1 3 】

実施形態 6 4 . 式 1 または実施形態 1 ~ 6 3 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{12n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

【 0 1 1 4 】

実施形態 6 5 . 実施形態 6 4 の化合物であって、式中、各 R^{12n} は $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【 0 1 1 5 】

実施形態 6 6 . 実施形態 6 5 の化合物であって、式中、各 R^{12n} は CH_3 である。

【 0 1 1 6 】

実施形態 6 7 . 式 1 または実施形態 1 ~ 6 6 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシである。

40

【 0 1 1 7 】

実施形態 6 8 . 実施形態 6 7 の化合物であって、式中、各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【 0 1 1 8 】

実施形態 6 9 . 実施形態 6 8 の化合物であって、式中、各 R^{13c} は、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【 0 1 1 9 】

50

実施形態 70 . 式 1 または実施形態 1 ~ 69 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{13n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

【0120】

実施形態 71 . 実施形態 70 の化合物であって、式中、各 R^{13n} は $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【0121】

実施形態 72 . 実施形態 71 の化合物であって、式中、各 R^{13n} は CH_3 である。

【0122】

実施形態 73 . 式 1 または実施形態 1 ~ 72 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシである。

10

【0123】

実施形態 74 . 実施形態 73 の化合物であって、式中、各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルである。

【0124】

実施形態 75 . 実施形態 74 の化合物であって、式中、各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0125】

実施形態 76 . 式 1 または実施形態 1 ~ 75 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである。

20

【0126】

実施形態 77 . 実施形態 76 の化合物であって、式中、各 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【0127】

実施形態 78 . 実施形態 77 の化合物であって、式中、各 R^{15n} および R^{17n} は CH_3 である。

【0128】

上記の実施形態 1 ~ 78 を含む本発明の実施形態、ならびに、本明細書に記載のいずれかの他の実施形態はいずれかの様式で組み合わせることが可能であり、実施形態における可変要素の記載は、式 1 の化合物だけではなく、式 1 の化合物の調製に有用な出発化合物および中間体化合物にも関する。加えて、上記の実施形態 1 - 78 を含む本発明の実施形態、ならびに、本明細書に記載のいずれかの他の実施形態、ならびに、いずれかのこれらの組み合わせは、本発明の組成物および方法に関する。

30

【0129】

実施形態 1 ~ 78 の組み合わせが以下に例示されている。

実施形態 A . 式 1 の化合物であって、式中、

Z は O であり；

R^1 は、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員 ~ 5 員環であり；

40

R^{2a} は、H、 CH_3 、 CF_3 または CHF_2 であり；

R^{2b} は H もしくは CH_3 であり；または

R^{2a} および R^{2b} は、一緒になって、 C_2 または C_3 アルカンジイルとされ；

G は、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で置換され、および、 R^3 から選択される 2 個以下の置換基で任意選択により置換されたフェニルまたはピリジニルであり；

R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり；

R^4 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

50

R^5 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；
 R^6 は CH_3 であり；
 R^7 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；
 R^8 は H または CH_3 であり；
 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；
 R^{10} は、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 R^{11} は、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
Q は、Q - 1 ~ Q - 21 から選択され（実施形態 54 に記載のとおり）；
各 R^{12c} は、独立してハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアル
キル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシであり；
各 R^{12n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；
各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルま
たは $C_1 \sim C_2$ アルコキシであり；
各 R^{13n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；
各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C
₁ ハロアルキルであり；および
 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアル
キルである。

10

20

【0130】

実施形態 B . 実施形態 A の化合物であって、式中、
A は、A - 1、A - 2、A - 3 および A - 4 からなる群から選択され；
 R^1 は、シクロプロピルであり；または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子
から選択される環員を含有する 4 員環であり；
 R^{2a} は、H、F または CH_3 であり；
 R^{2b} は H であり；または
 R^{2a} および R^{2b} は、一緒になって、 C_2 アルカンジイルとされ；
G は、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で
置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたフェニ
ルまたはピリジニルであり；
 R^3 は、ハロゲン、 CH_3 、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 OCF_3 、 CH_2CH_2O
 CH_3 またはシクロプロピルであり；
 R^4 は、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^5 は、H、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 または CF_3 であり；
 R^7 は、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^9 は、F、Cl、Br、 CHF_2 または CF_3 であり；
Q は Q - 1 ~ Q - 19 から選択され；
 R^{12c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
 R^{12n} は $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；
各 R^{13c} は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または C_1 ハロアルキルであり；
各 R^{13n} は $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；
各 R^{14} 、 R^{15c} 、 R^{16} および R^{17c} は、独立して、F、Cl、Br、 CH_3 、
 CHF_2 または CF_3 であり；および
各 R^{15n} および R^{17n} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

30

40

【0131】

実施形態 C . 実施形態 B の化合物であって、式中、
A は、A - 1、A - 2 および A - 3 からなる群から選択され；
 R^1 は、シクロプロピル、3 - オキセタニルまたは 3 - チエタニルであり；
G は、 $-C(R^{2a})R^{2b}$ - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位において Q で
置換され、および、 R^3 から選択される 1 つの置換基で任意選択により置換されたフェニ
ルであり；

50

R³ は、Cl、Br、CH₃、CF₃、CHF₂、OCH₃ またはシクロプロピルであり；

R⁴ は、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂ またはCF₃ であり；

R⁵ はFまたはClであり；

R⁷ は、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂ またはCF₃ であり；

R⁹ は、F、Cl、Br、CHF₂ またはCF₃ であり；

Qは、Q - 9 A、Q - 9 BおよびQ - 9 Cから選択され（実施形態56に記載のとおり）；

各R^{1 2 c}は、独立して、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂ またはCF₃ であり；

各R^{1 2 n}はCH₃であり；

各R^{1 3 c}は、独立して、F、Cl、Br、CH₃、CHF₂ またはCF₃ であり；

各R^{1 3 n}はCH₃であり；および

各R^{1 5 n}およびR^{1 7 n}はCH₃である。

10

【0132】

実施形態D．実施形態Aの化合物であって、式中、

Aは、A - 1およびA - 2からなる群から選択され；

R¹はシクロプロピルであり；

Gは、-C(R^{2 a})R^{2 b}-ラジカルを基準としてパラ位においてQで置換され、および、R³で置換されていないフェニルであり；

R⁴はCHF₂であり；

Qは、Q - 9 AおよびQ - 9 Bから選択され；および

R^{1 2 c}はCF₃である。

20

【0133】

実施形態E．実施形態Bの化合物であって、式中、

AはA - 1であり；

R¹はシクロプロピルであり；

Gは、-C(R^{2 a})R^{2 b}-ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位においてQで置換され、および、R³から選択される1つの置換基で任意選択により置換されたピリジニルであり；

R³はClであり；

R⁴はCHF₂であり；

QはQ - 9 Aであり；および

R^{1 2 c}はCF₃である。

30

【0134】

特定の実施形態は、以下からなる群から選択される式1の化合物を含む。

N - [[2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物12) ；および

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [[3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物3) 。

40

【0135】

本発明はまた、R³がハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₅アルキル、C₁ ~ C₅ハロアルキル、C₁ ~ C₅アルコキシ、C₁ ~ C₅ハロアルコキシ、C₂ ~ C₅アルコシアルキル、C₃ ~ C₅シクロアルキル、C₂ ~ C₅アルコシカルボニルまたはC₃ ~ C_{1 2}トリアルキルシリルである式1の化合物を含む。本発明は、式1の化合物（すべての立体異性体、そのN - オキシドおよび塩を含む）と、少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ剤とを含む殺菌・殺カビ組成物を提供する。このような組成物の実施形態として注目すべきは、上記の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を含む組成物である。

【0136】

50

本発明は、式 1 の化合物（すべての立体異性体、その N - オキシドおよび塩を含む）（すなわち、殺菌・殺力比的に有効な量で）と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加のコンポーネントを含む殺菌・殺力比組成物を提供する。このような組成物の実施形態として注目すべきは、上記の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を含む組成物である。

【0137】

本発明は、植物もしくはその一部または植物種子に、殺菌・殺力比的に有効な量の式 1 の化合物（すべての立体異性体、その N - オキシドおよび塩を含む）を適用するステップを含む真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法を提供する。このような方法の実施形態として注目すべきは、上記の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を殺菌・殺力比的に有効な量で適用するステップを含む方法である。特に注目すべきは、化合物が本発明の組成物として適用される実施形態である。

10

【0138】

スキーム 1 ~ 11 に記載の以下の方法および変形の 1 つ以上を用いて、式 1 の化合物を調製することが可能である。以下の式 1 ~ 21 の化合物における、A、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、G、Q、および Z の定義は、別段の定めがある場合を除き、発明の概要において上記に定義されているとおりである。式 1a ~ 1c の化合物は式 1 の化合物の種々のサブセットであり、式 1a ~ 1c に係るすべての置換基は、式 1 の化合物について上記に定義されているとおりである。式 2a ~ 2b の化合物は式 2 の化合物の種々のサブセットであり、式 2a ~ 2b に係るすべての置換基は、式 2 の化合物について本明細書において定義されているとおりである。式 7a ~ 7c の化合物は式 7 の化合物の種々のサブセットであり、式 7a ~ 7c に係るすべての置換基は、式 7 の化合物について本明細書において定義されているとおりである。式 9a ~ 9b の化合物は式 9 の化合物の種々のサブセットであり、式 9a ~ 9b に係るすべての置換基は式 9 の化合物について本明細書において定義されているとおりである。

20

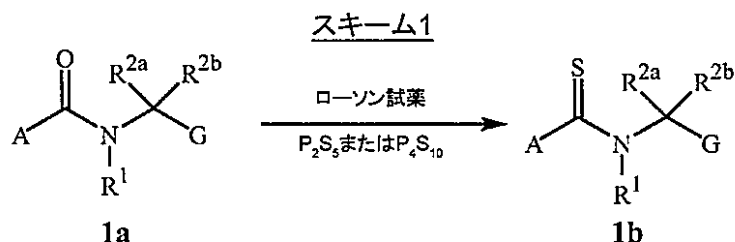
【0139】

スキーム 1 に示されているとおり、式 1b の化合物（すなわち、Z が硫黄である式 1）は、式 1a の化合物（すなわち、Z が酸素である式 1）から、ローソン試薬、 P_2S_5 または P_4S_{10} による処理によって調製され得る。この種のチオアミド形成反応は、典型的には、トルエンまたは p - ジオキサンなどの非プロトン性溶剤中に、40 ~ 溶剤の沸点の高温で実施される。この種の反応は、文献において周知である；例えば、March and Smith, March's Advanced Organic Chemistry, 5th ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 2001, Chapter 16 を参照のこと。

30

【0140】

【化 9】



40

【0141】

スキーム 2 に示されているとおり、式 1c の化合物（すなわち、Z が酸素であり；および、Q が、G 環における - C (R^{2a}) R^{2b} - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位に位置される Q^N によって表される窒素結合複素環である、式 1 の化合物）は、式 2a の化合物（すなわち、L が、フェニル、ピリジニル、ピリダジニルまたはピラジニル基である式 2 の化合物）と水素原子が環窒素に結合している式 3 の複素環との反応による求核

50

性芳香族置換によって調製され得る。これらの置換反応は、典型的には、N, N - ジメチルホルムアミドまたはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶剤中において、カリウムまたは炭酸セシウムなどの無機塩基の存在下で、周囲温度～溶剤の沸点の温度で実施される。これらのタイプの反応は、文献中において多く記載されている（例えば、March and Smith, March's Advanced Organic Chemistry, 5th ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 2001, Chapter 13を参照のこと）。式3の複素環は、市販されているか、または、技術分野において周知である方法によって調製され得る。

【0142】

スキーム2においても示されているとおり、式1cの化合物は、環窒素が水素原子に結合している式3の複素環を伴う式2bの化合物の銅触媒ブッフバルトーハートウィッグカップリングによって調製され得る。これらのカップリング反応は、典型的には、p - ジオキサン、1, 2 - ジエトキシエタンまたはトルエンなどの非プロトン性溶剤中において、好適なりガンド、CuIまたはCuBrなどの銅(I)塩、および、ナトリウムまたは炭酸カリウムなどの塩基の存在下で実施される。典型的なりガンドは、トランス - N, N' - ジメチル - 1, 2 - ジアミノシクロヘキサンおよびフェナントロリンであり、典型的な反応温度は、周囲温度～還流温度の範囲である。この反応に係る条件は、文献において周知である（Chemical Science 2010, 1, 13 - 31, Chemical Reviews 2008, 108(8), 3054 - 3131、および、その中で引用されている文献を参照のこと）。

10

20

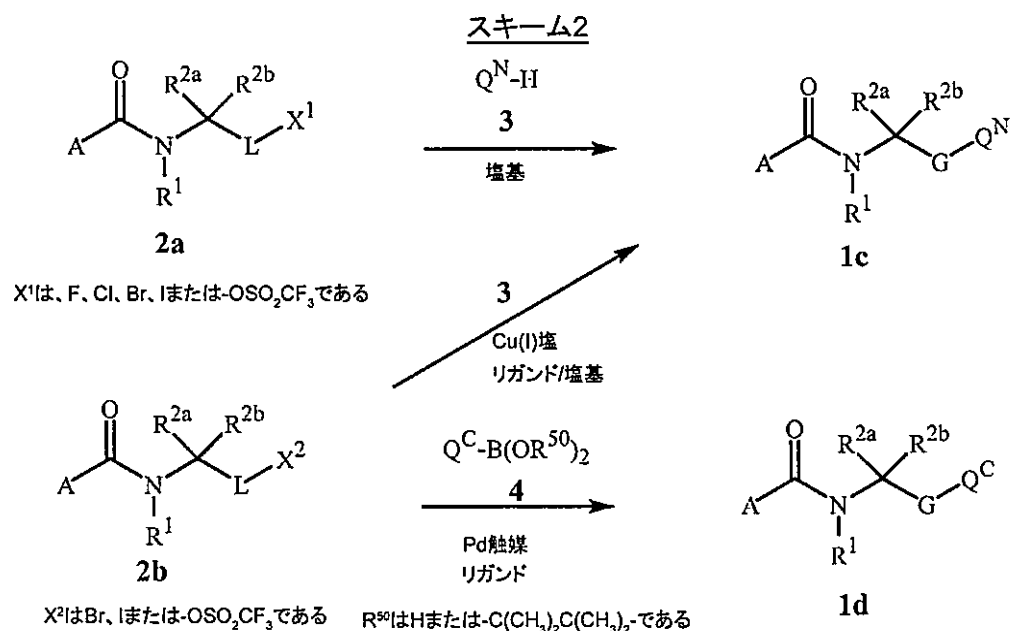
【0143】

スキーム2においても示されているとおり、式1dの化合物（すなわち、Zが酸素であり；および、Qが、G環における - C(R^{2a})R^{2b} - ラジカルを基準としてメタもしくはパラ位に位置されたQ^cによって表される炭素結合複素環である式1）は、スズキカップリング反応によって調製可能である。式2bの化合物（すなわち、Lが、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、またはピラジニル基である式2の化合物）は、Pd(0)またはPd(II)塩、好適なりガンドおよび塩基の存在下に、環炭素がホウ素に結合している式4のボロン酸またはエステルとカップリングされ得る。この変換に好適な塩基は、炭酸カリウムまたは炭酸セシウムである。Pd(OAc)₂またはPdCl₂などのPd(II)塩が、トリフェニルホスフィンまたは1, 1' - ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン(dppf)などのリガンドと併用される。スズキカップリングに係る条件は、文献中において多く記載されている（例えば、Angewandte Chemie, Int. Ed. 2006, 45, 3484を参照のこと）。式4のボロン酸またはエステルは、市販されているか、または、対応するハライドまたはトリフルオロメタンスルホン酸から、文献において公知の方法によって調製され得る（例えば、J. Org. Chem. 1995, 60, 7508を参照のこと）。

30

【0144】

【化 1 0】



10

【 0 1 4 5】

20

あるいは、スキーム3に示されているとおり、式1cの化合物は、式5のホウ素中間体から、Cu(II)塩、酸素および塩基の存在下に、周囲温度～溶剤の還流温度の範囲の温度で、式3の窒素複素環を伴うカップリングによるチャン・ラム条件を用いて調製され得る。用いられ得るCu(II)塩の例は、Cu(OAc)₂、CuBr₂、およびCuI₂である。この反応タイプに好適な塩基としては、ピリジン、キノロンおよびトリエチルアミンが挙げられ、また、好適な溶剤としては、ジクロロメタン、クロロホルム、ジエチルエーテルおよびテトラヒドロフランが挙げられる。代表的な条件に関しては、Tetrahedron Letters 1998, 39, 2941, Angewandte Chemie, Int. Ed. 2003, 42, 5400、および、引用されている文献を参照のこと。

30

【 0 1 4 6】

スキーム3においても示されているとおり、式1dの化合物は、式5のボロン酸またはエステルとX²が環炭素に結合している式6の複素環とのカップリングによるスズキ反応を介して調製され得る。このようなカップリングを行うための条件は、スキーム2に記載のスズキ条件と同様である。式6の化合物は市販されているか、または、文献に記載の方法により容易に調製され得る。

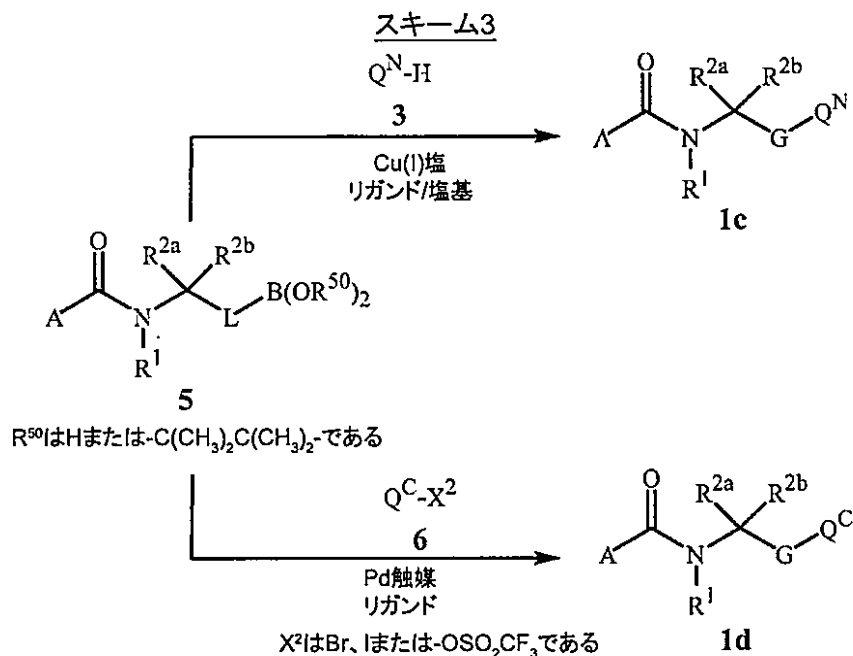
【 0 1 4 7】

式5の化合物は、スキーム2における式4の化合物の調製において言及されている方法を用いて、式2bの化合物から調製され得る。

【 0 1 4 8】

40

【化 1 1】



10

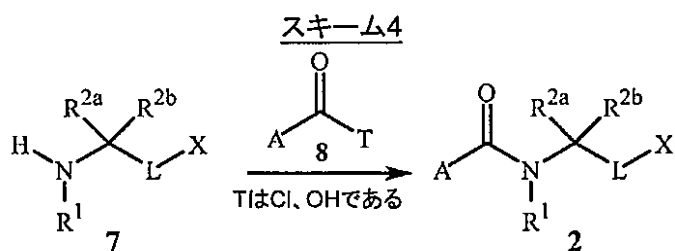
20

【0 1 4 9】

スキーム 4 に示されているとおり、式 2 の化合物は、式 8 の化合物による式 7 の化合物のアミン誘導体アシル化によって調製され得る。これらのタイプのアシル化は、文献中において多く記載されている（例えば、March and Smith, March's Advanced Organic Chemistry, 5th ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 2001, Chapter 10 を参照のこと）。

【0 1 5 0】

【化 1 2】



30

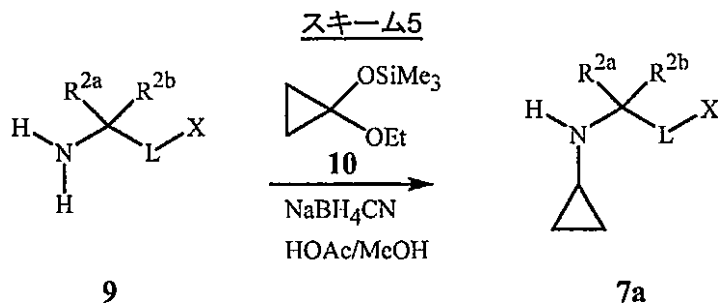
【0 1 5 1】

スキーム 5 に示されているとおり、式 7 a の化合物（すなわち、 R^1 がシクロプロピルである式 7 の化合物）は、式 9 の第一級アミン誘導体と市販されているシクロプロパノンエチルトリメチルシリルアセタール 10 との、酢酸 / メタノール中における、シアノ水素化ホウ素ナトリウムの存在下での反応により調製され得る（例えば、国際公開第 2012 / 22265 号パンフレットを参照のこと）。式 9 の化合物は、市販されているか、または、文献に記載の方法により容易に調製され得る。

40

【0 1 5 2】

【化 1 3】



10

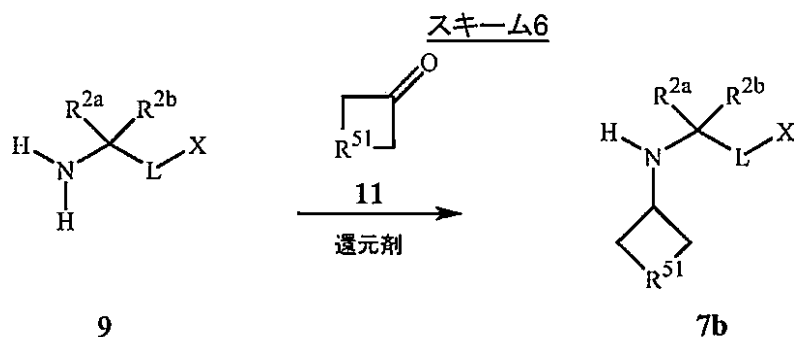
【0 1 5 3】

スキーム 6 に示されているとおり、式 7 b の化合物（すなわち、 R^1 がシクロブチル、シクロペンチル、または、炭素原子、1 個の O 原子および 1 個の S 原子から選択される環員を含有する 4 員～6 員環である式 7 の化合物）は、式 9 の第一級アミンの式 1 1 のケトンによる縮合、これに続く、ナトリウムボロハイドライド、シアノ水素化ホウ素ナトリウムまたはトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムなどの還元剤による処理により調製され得る。代表的な条件に関しては、J. Med. Chem. 2005, 48 (4), 1169 および国際公開第 2012/66070 号パンフレットを参照のこと。

【0 1 5 4】

20

【化 1 4】



30

R^{51} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキレン、O、S、 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ または $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ である

【0 1 5 5】

スキーム 7 に示されているとおり、式 7 または式 7 c のアミン（すなわち、 R^{2b} が H である式 7 の化合物）は、式 1 2 のケトンから調製され得る。式 1 3 のアミンの式 1 2 のケトンによる縮合は式 1 4 のイミンの形成をもたらす。この種の縮合反応は文献において周知である (March and Smith, March's Advanced Organic Chemistry, 5th ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 2001, Chapter 16 を参照のこと)。式 1 4 のイミンを還元剤で処理することにより式 7 c のアミンがもたらされる。これらの反応において用いられる典型的な還元剤としては、ナトリウムボロハイドライド、シアノ水素化ホウ素ナトリウムおよびトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムが挙げられ、また、典型的な溶剤は、メタノール、エタノール、アセトニトリルまたはテトラヒドロフランである。式 1 2 の化合物の式 7 c の化合物への変換は、度々、単一の反応ポット中で行われる。代表的な条件に関しては、米国特許出願公開第 2005/58301 号明細書および米国特許出願公開第 2008/275085 号明細書を参照のこと。式 7 のジアルキル化またはハロアルキル化化合物は、式 1 4 のイミンを、式 1 5 のアルキル - またはハロア

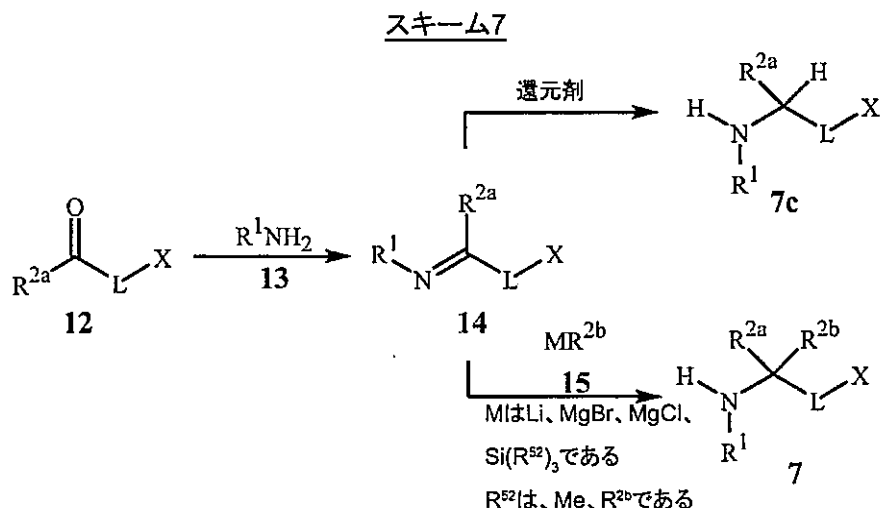
40

50

ルキル - 金属種で処理することにより得られ得る。このアルキル化反応に係る典型的な反応温度は、78 ~ 60 の範囲であり、典型的な溶剤としては、テトラヒドロフラン、アセトニトリルおよびジエチルエーテルが挙げられる。代表的な条件に関しては、米国特許出願公開第2012/59162号明細書および Tetrahedron 2011, 67(14), 2670を参照のこと。式12のケトン、式13のアミンおよび式15の金属試薬は、市販されているか、または、文献に記載の方法により容易に調製され得る。

【0156】

【化15】



10

20

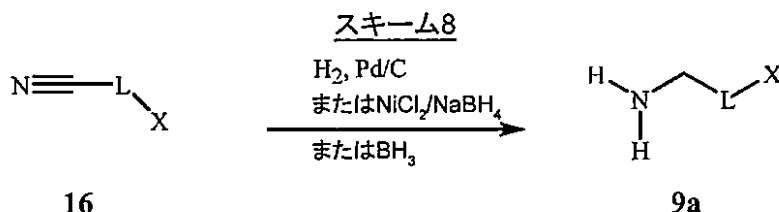
【0157】

スキーム8に示されているとおり、式9aの化合物（すなわち、R^{2a}およびR^{2b}が共にHである式9の化合物）は、式16の対応するニトリル化合物の還元により調製され得る。ニトリル還元は、水素/パラジウム炭素、塩化ニッケル(II)/ナトリウムボロハイドライドまたはボランの使用を含む多数の方法を介して行われ得、これらは、文献中において多く記載されている。例えば、Smith, M. B., Organic Synthesis, 2nd ed., McGraw-Hill Companies, Inc., 2002, Chapter 4、および、その中で引用されている文献を参照のこと。式16の化合物は、市販されているか、または、文献に記載の方法により容易に調製され得る。

30

【0158】

【化16】



40

【0159】

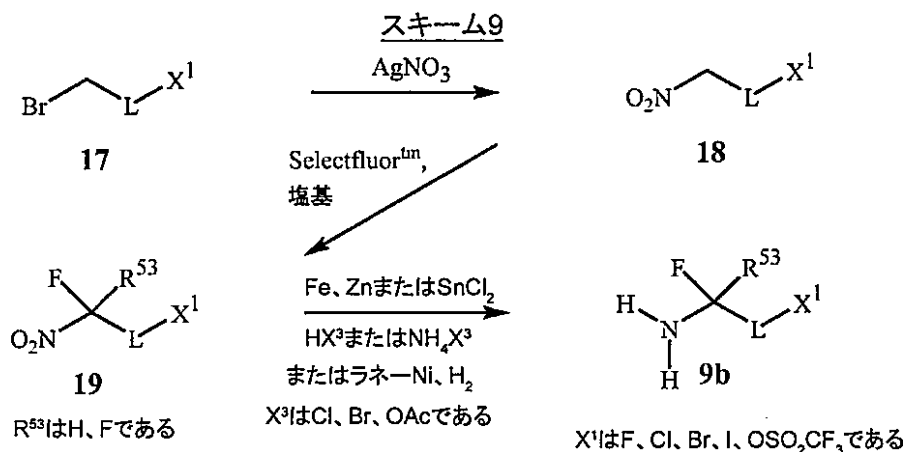
式9bの化合物（すなわち、R^{2a}がFであり、および、R^{2b}がFまたはHである式9の化合物）は、スキーム9に示されているとおり調製され得る。式17の臭化物をジエチルエーテルなどの溶剤中において亜硝酸銀で、約0 ~ 周囲温度の温度で処理することにより、式18のニトロ化合物が得られ得る。代表的な条件に関しては、米国特許出願公開第2012/165343号明細書を参照のこと。式19の化合物は、式18の化合物の、水酸化カリウム、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド、水素化ナトリウムまたは酢酸アンモニウムなどの塩基、および、Selectfluor（商標）（1-クロロメ

50

チル - 4 - フルオロ - 1 , 4 - ジアゾニアビシクロ - [2 . 2 . 2] オクタンビス (テトラフルオロボレート)) などの求電子性フッ素化試薬による、N , N - ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、ジクロロメタンまたはメタノールなどの溶剤中における約 0 ~ 周囲温度の温度での処理によって調製され得る。当業者は、これらの条件は、モノフッ素化生成物 (すなわち、 R^{53} が H である式 19 の化合物) またはジフッ素化生成物 (すなわち、 R^{53} が F である式 19 の化合物) を得るために調整し得ることを認識するであろう。生成物混合物が生成される場合においては、所望される生成物は、技術分野において周知である分離技術を用いて単離され得る。代表的な条件に関しては、Tetrahedron Letters 2005, 46, 4905 および Tetrahedron Letters 2006, 47, 4519 を参照のこと。式 9 b のアミノ化合物は、Fe、Zn、または塩化錫 (II) の、水性酸性媒体中において、周囲温度 ~ 還流の範囲の温度で用いる式 19 のニトロ化合物の還元を介して調製され得る。メタノール、エタノールおよびイソプロパノールなどのアルコール共溶剤もまた利用され得る。塩酸、臭化水素酸および酢酸などの酸、または、塩化アンモニウムが典型的に利用される。このような還元に係る条件は、1 Med. Chem. 2012, 55 (3), 1021 に見いだされ得る。あるいは、水素雰囲気下でのラネーニッケルの使用などの水素化条件が式 9 b の化合物を調製するために利用され得る。この種の水素化は、典型的には、エタノールなどの溶剤中で実施される。代表的な条件に関しては、米国特許出願公開第 2012 / 259111 号明細書を参照のこと。式 17 の化合物は、市販されているか、または、文献に記載の方法により容易に調製され得る。

【 0160 】

【 化 17 】

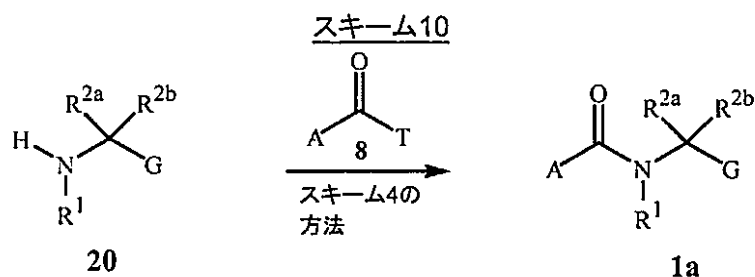


【 0161 】

スキーム 10 に示されているとおり、式 1 a の化合物は、スキーム 4 における式 2 の化合物の調製に記載の方法に従い、式 20 のアミンの式 8 の酸誘導体によるカップリングによって調製可能である。

【 0162 】

【 化 18 】



10

20

30

40

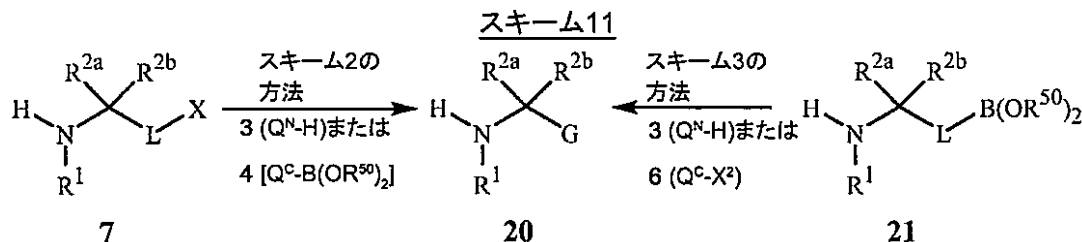
50

【 0 1 6 3 】

スキーム 11 に示されているとおり、式 20 の化合物は、式 3 もしくは 4 の化合物の試薬を伴うスキーム 2 に記載のカップリング方法を用いて式 7 の化合物から、または、式 3 もしくは 6 の化合物を伴うスキーム 3 に記載のカップリング方法を用いて式 21 のホウ素誘導体から調製され得る。式 21 の化合物は、スキーム 2 における 4 の調製に記載の方法を用いて式 7 の化合物から調製可能である。

【 0 1 6 4 】

【 化 1 9 】



10

【 0 1 6 5 】

式 1 の化合物の調製について記載されている幾つかの試薬および反応条件は、中間体に存在する一定の官能基には適合しない場合があることが認識される。これらの事例においては、保護 / 脱保護手順または官能基相互変換を合成に組み込むことにより、所望の生成物の入手が促進されることとなる。保護基の使用および選択は化学合成における当業者には明らかであろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991 を参照のこと）。当業者は、いくつかの場合において、個々のスキームのいずれかにおいて示されている通り所与の試薬を導入した後、式 1 の化合物の合成を完了させるために、詳細には説明されていない追加の日常的な合成ステップを実施する必要性があり得ることを認識するであろう。当業者はまた、式 1 の化合物を調製するために、提示されている特定のシーケンスによって示唆されるものを除く、上記スキームに例示されているステップの組み合わせを実施する必要性があり得ることを認識するであろう。

20

30

【 0 1 6 6 】

当業者はまた、本明細書に記載の式 1 の化合物および中間体は、種々の求電子性、求核性、ラジカル、有機金属、酸化および還元反応に供されて、置換基が付加されるか、または、既存の置換基が変性されることが可能であることを認識するであろう。

【 0 1 6 7 】

さらなる詳細を伴わずに、上記の記載を利用する当業者は本発明を最大限に利用することが可能であると考えられている。以下の実施例は、従って、単なる例示であって、本開示を如何様にも全く限定しないと解釈されるべきである。以下の実施例におけるステップは、合成形質転換全体における各ステップについての手法を例示しており、各ステップについての出発材料は、必ずしも、手法が他の実施例またはステップにおいて記載されている特定の調製実験によって調製されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグラフ溶媒混合物、または、他に記載のある場合を除き、重量基準である。クロマトグラフ溶媒混合物に対する部およびパーセンテージは、他に示されていない限りにおいて体積基準である。¹H NMR スペクトルは、別段の定めがある場合を除き、CDCl₃ 中のテトラメチルシランの低磁場側に ppm で報告されており；「s」は一重項を意味し、「d」は二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「dd」は二重項の二重項を意味し、「dt」は三重項の二重項を意味し、「br s」は幅広の一重項を意味する。

40

【 0 1 6 8 】

実施例 1

50

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1 - [6 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 - ピリジニル] エチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 1) の調製

ステップ A : 6 - クロロ - N - シクロプロピル - - メチル - 3 - ピリジンメタンアミンの調製

シクロプロピルアミン (2 . 1 g、37 . 0 mmol) および 2 分子ふるい (2 . 0 g) のメタノール (25 mL) 中の攪拌混合物を 0 に冷却し、氷酢酸 (2 . 75 mL) および 1 - (6 - クロロ - 3 - ピリジニル) エタノン (2 . 88 g、18 . 5 mmol) で順次に処理した。外部の冷却を外し、混合物を還流で 3 時間加熱し、次いで、周囲温度に冷却させた。シアノ水素化ホウ素ナトリウム (1 . 73 g、46 . 3 mmol) のメタノール (5 mL) 中の溶液を滴下し、反応混合物をさらに 3 時間還流で加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で濃縮し、ヘキサン中の 20 ~ 50 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィにより得られた残渣を精製して、表題の化合物を得た (1 . 61 g)。

¹ H NMR 8 . 32 (m , 1 H) , 7 . 65 (m , 1 H) , 7 . 28 (d , 1 H) , 3 . 91 (m , 1 H) , 1 . 96 (m , 1 H) , 1 . 74 (br s , 1 H) , 1 . 36 (d , 3 H) , 0 . 38 (m , 3 H) , 0 . 20 (m , 1 H) .

【 0169 】

ステップ B : N - [1 - (6 - クロロ - 3 - ピリジニル) エチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製

3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (0 . 25 g、1 . 42 mmol) および塩化チオニル (5 mL) の混合物を 1 時間還流で加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた残渣をトルエンで 2 回希釈し、減圧下で濃縮した。残存 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - 塩化カルボニルをジクロロメタン (5 mL) 中にとり、室温で、6 - クロロ - N - シクロプロピル - - メチル - 3 - ピリジンメタンアミン (すなわち、ステップ A の生成物、0 . 23 g、1 . 18 mmol) およびトリエチルアミン (0 . 12 g、1 . 18 mmol) のジクロロメタン中の混合物を滴下して処理した。反応混合物を周囲温度で一晩攪拌し、次いで、1 N 塩酸とジクロロメタンとの間に分割した。有機相を分離し、水性相をジクロロメタンで再度抽出した。組み合わせた有機相を乾燥させ (Mg SO₄)、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘキサン中の 30 ~ 100 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルによるクロマトグラフィにかけて、表題の化合物を得た (0 . 27 g)。

¹ H NMR 8 . 39 (m , 1 H) , 7 . 65 (m , 2 H) , 7 . 28 (d , 1 H) , 7 . 01 (t , 1 H) , 5 . 68 (m , 1 H) , 3 . 96 (s , 3 H) , 2 . 62 (m , 1 H) , 1 . 79 (d , 3 H) , 0 . 64 (m , 2 H) , 0 . 52 (m , 1 H) , 0 . 35 (m , 1 H) .

【 0170 】

ステップ C : N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1 - [6 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 - ピリジニル] エチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製

N - [1 - (6 - クロロ - 3 - ピリジニル) エチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (すなわち、ステップ B の生成物、0 . 08 g、0 . 23 mmol)、3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール (0 . 02 g、0 . 15 mmol)、トランス - N , N' - ジメチル - 1 , 2 - ジアミノシクロヘキサン (0 . 01 g、0 . 07 mmol)、ヨウ化銅 (I) (0 . 01 g、0 . 05 mmol) および炭酸カリウム (0 . 07 g、0 . 51 mmol) のジオキサン (2 mL) 中の混合物を、20 分間、マイクロ波反応器中で 200 に加熱した。室温に冷却して、アリコート液体クロマトグラフィー / 質量分光測定 (LCMS) により分析したところ、所望の生成物が含有されていることが分かった。N - [1 - (6

10

20

30

40

50

- クロロ - 3 - ピリジニル) エチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル)
 - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (0 . 1 2 g 、 0 . 3 3 m m o l)
) の第 2 の分量を上記のとおり反応に供し、両方の粗反応混合物を組み合わせ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルをヘキサン中の 8 0 ~ 1 0 0 % 酢酸エチルで溶出するクロマトグラフィにかけて、本発明の化合物である表題の化合物 (0 . 2 3 g) を茶色の油として得た。

^1H NMR 8 . 6 1 (m , 1 H) , 8 . 4 3 (m , 1 H) , 8 . 0 0 (m , 1 H) , 7 . 8 5 (m , 1 H) , 7 . 6 4 (s , 1 H) , 7 . 0 3 (t , 1 H) , 7 . 7 2 (m , 1 H) , 5 . 7 9 (m , 1 H) , 3 . 9 6 (s , 3 H) , 2 . 6 3 (m , 1 H) , 1 . 8 3 (d , 3 H) , 0 . 6 5 (m , 2 H) , 0 . 5 5 (m , 1 H) , 0 . 3 5 (m , 1 H) .

【 0 1 7 1 】

実施例 2

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [[3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 9) の調製

ステップ A : 3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンズアルデヒドの調製

3 - プロモベンズアルデヒド (1 . 0 g 、 5 . 4 m m o l 、 1 . 0 当量) 、 3 - (トリフルオロメチル) - ピラゾール (7 3 0 m g 、 1 . 0 当量) 、 ヨウ化 Cu (I) (2 1 0 m g 、 0 . 2 0 当量) 、 および炭酸セシウム (3 . 5 g 、 2 . 0 当量) を反応バイアル中に入れた。バイアルを窒素でパージし、N , N - ジメチルホルムアミド (1 0 m L) を添加した。反応を 1 2 0 で一晩加熱し、次いで、周囲温度に冷却した。得られた固形分をろ過により除去し、ジエチルエーテルで洗浄した。水をろ液に添加し、これらの層を分離し、水性相をジエチルエーテルで 2 回抽出した。組み合わせた有機抽出物を水 (4 x) 、塩水で洗浄し、乾燥させ (M g S O ₄) 、減圧下で濃縮した。得られた残渣を、ヘキサン中の 1 0 ~ 4 0 % の酢酸エチルで溶出するシリカゲルによる中圧液体クロマトグラフィにより精製した、表題の化合物 (2 0 0 m g) を白色の固体として得た。

^1H NMR 1 0 . 1 0 (s , 1 H) , 8 . 1 9 ~ 8 . 2 4 (m , 1 H) , 8 . 0 3 ~ 8 . 0 9 (m , 2 H) , 7 . 8 9 (d t , 1 H) , 7 . 6 9 (t , 1 H) , 6 . 7 8 (d , 1 H) .

【 0 1 7 2 】

ステップ B : N - シクロプロピル - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンゼンメタンアミンの調製

3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンズアルデヒド (すなわち、ステップ A の生成物、2 0 0 m g) のメタノール (5 m L) 中の溶液にシクロピロピルアミン (1 m L) を添加し、得られた混合物を周囲温度で 1 時間撹拌した。次いで、過剰量のナトリウムボロハイドライドを添加し、反応混合物を室温で 1 時間撹拌した。反応を水を添加することにより失活させた。これらの層を分離し、水性層をジクロロメタンで抽出した (4 x) 。組み合わせた有機層を乾燥させ (M g S O ₄) 、減圧下で濃縮した。得られた残渣を、ヘキサン中の 1 0 ~ 6 0 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルによる中圧液体クロマトグラフィにより精製して、表題の化合物を得た (1 0 0 m g) 。

^1H NMR 7 . 9 5 (d d , 1 H) , 7 . 6 9 (t , 1 H) , 7 . 5 4 ~ 7 . 5 9 (m , 1 H) , 7 . 4 3 (t , 1 H) , 7 . 3 2 (d , 1 H) , 6 . 7 1 (d , 1 H) , 3 . 9 2 (s , 2 H) , 2 . 1 0 ~ 2 . 2 5 (m , 1 H) , 0 . 4 2 ~ 0 . 4 8 (m , 2 H) , 0 . 3 8 ~ 0 . 4 2 (m , 2 H) .

【 0 1 7 3 】

ステップ C : N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [[3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製

3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (30 mg、0.17 mmol、1 当量) を塩化チオニル (1 mL) 中に溶解させ、得られた溶液を 3 時間還流で加熱した。反応混合物を室温に冷却させ、次いで、減圧下で濃縮した。この素材に、N - シクロプロピル - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンゼンメタンアミン (すなわち、ステップ B の生成物、46 mg、1.0 当量) およびトリエチルアミン (3.5 当量) のジクロロメタン (4 mL) 中の溶液を添加した。反応混合物を、周囲温度で一晩撹拌した。次いで、反応を水で失活させ、ジクロロメタンで抽出した。有機相を乾燥させ (MgSO₄)、減圧下で濃縮した。得られた残渣を、ヘキサン中の 20 ~ 80 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルによる中圧液体クロマトグラフィにより精製し、続いて、クロロホルム中の 1 ~ 10 % アセトンで溶出するシリカゲルによる中圧液体クロマトグラフィにより二回目の精製を行って、本発明の化合物である表題の化合物 (35 mg) を無色の油として得た。

¹H NMR 7.95 (dd, 1H), 7.67 (d, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.43 ~ 7.47 (m, 1H), 7.28 ~ 7.33 (m, 1H), 6.92 ~ 7.20 (m, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.69 ~ 2.79 (m, 1H), 0.67 ~ 0.80 (m, 4H).

【0174】

実施例 3

N - [[2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 12) の調製

ステップ A: 2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンズアルデヒドの調製

2 - クロロ - 4 - フルオロベンズアルデヒド (7.0 g、44.3 mmol)、3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール (9.03 g、66.45 mmol) および炭酸カリウム (12.2 g、88.6 mmol) の無水 N, N - ジメチルホルムアミド (70 mL) 中の混合物を 110 で 2 時間撹拌した。反応混合物を 0 に冷却し、氷水 (800 mL) 中に注ぎ入れ、15 分間撹拌した。形成された沈殿物をろ過し、減圧下で乾燥させて表題の化合物 (10.2 g) を得、これをさらに精製せずに用いた。

¹H NMR 10.4 (s, 1H), 8.00 (m, 2H), 7.85 (d, 1H), 7.77 (m, 1H), 6.70 (d, 1H).

【0175】

ステップ B: 2 - クロロ - N - シクロプロピル - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンゼンメタンアミンの調製

2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] ベンズアルデヒド (すなわち、ステップ A の生成物、1.0 g、3.6 mmol) の無水テトラヒドロフラン (10 mL) 中の溶液に、シクロプロピルアミン (0.2 g、4 mmol) およびチタン (IV) イソプロポキシド (5.2 g、18.2 mmol) を 0 で添加した。得られた溶液を周囲温度で 4 時間撹拌した。次いで、ナトリウムボロハイドライド (0.34 g、9.0 mmol) を添加し、混合物を室温で 6 時間撹拌した。反応混合物を氷水中に注ぎ入れ、酢酸エチル (20 mL) で抽出した。水性層を酢酸エチル (2 x 25 mL) で抽出し、組み合わせた有機層を塩水 (50 mL) で洗浄し、乾燥させ (Na₂SO₄)、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘキサン中の 50 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、表題の化合物 (0.6 g) を得た。

【0176】

ステップ C: N - [[2 - クロロ - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製

2 - クロロ - N - シクロプロピル - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾ

10

20

30

40

50

ール - 1 - イル] ベンゼンメタンアミン (すなわち、ステップ B の生成物、150 mg、0.47 mmol)、N - (3 - ジメチルアミノプロピル) - N' - エチルカルボジミド (137 mg、0.71 mmol)、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (77 mg、0.57 mmol) および N, N - ジイソプロピルエチルアミン (0.25 mL、1.43 mmol) のジクロロメタン (5 mL) 中の溶液に、3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (92 mg、0.47 mmol; 国際公開第 2010/130767 号パンフレットに記載のとおり調製) を添加し、12 時間撹拌した。反応混合物を水、塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘキサン中の 50% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルによるカラムクロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題の化合物 (100 mg) をオフホワイトの固体として得た。

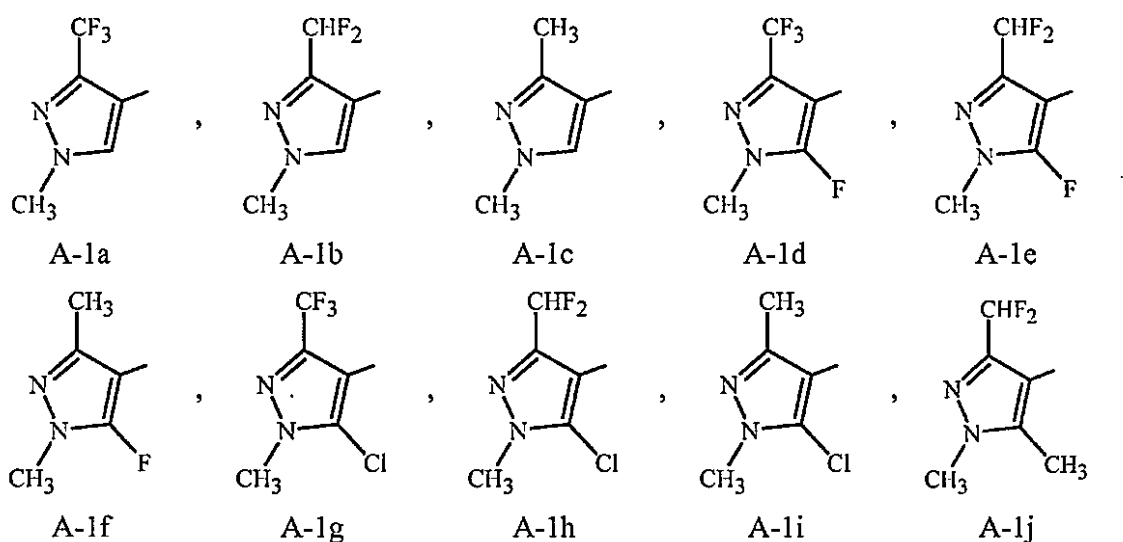
^1H NMR 7.94 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 6.80 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.78 (m, 1H), 0.70 (m, 4H).
【0177】

技術分野において公知である方法を伴う本明細書に記載の手法により、表 1 ~ 1539 の以下の化合物を調製可能である。以下の略語が以下の表において用いられている: Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、Pr はプロピルを意味し、i - Pr はイソプロピルを意味し、c - Pr はシクロプロピルを意味し、OMe はメトキシを意味し、TMS はトリメチルシリルを意味し、Ph はフェニルを意味し、MeOC(=O) はメトキシカルボニルを意味し、CN はシアノを意味する。「 $(\text{R}^3)_n$ は H である」とは、n が 0 であり、および、G を含む環が R^3 で置換されていないことを意味する。表中の個別の「A」置換基の構造は明細表 4 に図示されている。

【0178】

【化 20】

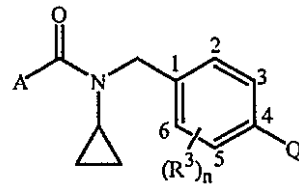
明細表 4



【0179】

【表 1】

表 1



A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。

Q	Q	Q
3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
4-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
5-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-I-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-I-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
5-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-I-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-OMe-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-OMe-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
4-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル

【 0 1 8 0 】

【表 2】

5-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,5-ジ-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,5-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
5-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-CF ₃ -5-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,4-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	10
3-F-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Br-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
3,5-ジ-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-Br-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	4-Me-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-CF ₃ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4-CHF ₂ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-F-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Cl-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4-Br-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Ph-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Me-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4,5-ジ-CF ₃ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Cl-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Br-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Me-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	
4-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-F-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	
4-Br-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	20
3-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	
3,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	2,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	
2,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	
1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	1-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-(F ₃ CCH ₂)-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-(F ₃ CCH ₂)-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1,3-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	3-Me-1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-Et-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	30
1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	5-Ph-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル	
3,5-ジ-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
5-CF ₃ -2,4-ジヒドロ-3-オキソピラゾール-1-イル	5-Me-2,4-ジヒドロ-3-オキソピラゾール-1-イル		

【0181】

本開示はまた表 2 ~ 7 6 9 を含み、これらの各々は、表 1 中の行表題（すなわち、「A は A - 1 a であり、および、R³ は H である。」）が以下に示されている行表題の各々で置き換えられていることを除き、上記の表 1 と同じく構成されている。例えば、表 2 において、行表題は「A は A - 1 a であり、および、R³ は 2 - F である」であり、Q は、上記の表 1 において定義されているとおりである。それ故、表 2 中の最初の項目は、特定の N - [[2 - フルオロ - 4 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドを開示している。表 3 ~ 7 6 9 が同様に構成されている。

【0182】

【表 3】

表	行表題	表	行表題
2	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	386	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
3	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	387	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
4	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	388	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
5	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	389	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
6	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	390	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
7	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	391	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
8	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	392	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
9	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	393	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
10	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	394	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
11	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	395	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
12	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	396	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
13	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	397	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
14	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	398	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
15	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	399	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
16	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	400	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
17	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。	401	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
18	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。	402	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
19	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。	403	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
20	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。	404	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
21	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。	405	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。
22	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。	406	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。
23	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。	407	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。
24	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。	408	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。
25	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。	409	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
26	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。	410	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
27	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。	411	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。
28	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。	412	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
29	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。	413	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
30	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。	414	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。
31	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。	415	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。
32	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。	416	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。
33	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。	417	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。
34	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。	418	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。

10

20

30

【 0 1 8 3 】

【表 4】

表	行表題	表	行表題
35	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。	419	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。
36	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。	420	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。
37	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。	421	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。
38	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。	422	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。
39	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。	423	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。
40	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	424	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
41	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	425	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
42	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	426	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
43	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	427	AはA-1aであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
44	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	428	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
45	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	429	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
46	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	430	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
47	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	431	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
48	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	432	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
49	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	433	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
50	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	434	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
51	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	435	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
52	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	436	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
53	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	437	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
54	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	438	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
55	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	439	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
56	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。	440	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
57	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。	441	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
58	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。	442	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
59	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。	443	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。
60	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。	444	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。
61	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。	445	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。
62	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。	446	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。
63	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。	447	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
64	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。	448	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
65	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。	449	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。
66	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。	450	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
67	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。	451	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
68	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。	452	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。
69	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。	453	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。
70	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。	454	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。
71	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。	455	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。

10

20

30

40

【表 5】

表	行表題	表	行表題
72	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。	456	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。
73	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。	457	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。
74	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。	458	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。
75	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。	459	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。
76	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。	460	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。
77	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。	461	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。
78	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。	462	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
78	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	463	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
79	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	464	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
80	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	465	AはA-1bであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
81	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	466	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
82	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	467	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
83	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	468	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
84	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	469	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
85	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	470	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
86	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	471	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
87	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	472	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
88	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	473	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
89	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	474	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
90	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	475	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
91	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	476	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
92	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	477	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
93	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	478	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
94	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。	479	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
95	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。	480	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
96	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。	481	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。
97	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。	482	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。
98	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。	483	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。
99	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。	484	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。
100	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。	485	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
101	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。	486	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
102	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。	487	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。
103	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。	488	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
104	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。	489	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
105	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。	490	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。
106	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。	491	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。
107	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。	492	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。

10

20

30

40

【 0 1 8 5 】

【表 6】

表	行表題	表	行表題
108	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。	493	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。
109	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。	494	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。
110	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。	495	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。
111	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。	496	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。
112	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。	497	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。
113	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。	498	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。
114	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。	499	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。
115	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。	500	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
116	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。	501	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
117	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	502	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
118	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	503	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
119	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	504	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
120	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	505	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
121	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	506	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
122	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	507	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
123	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	508	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
124	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	509	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
125	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	510	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
126	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	511	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
127	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	512	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
128	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	513	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
129	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	514	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
130	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	515	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
131	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	516	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
132	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	517	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
133	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。	518	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
134	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。	519	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。
135	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。	520	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。
136	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。	521	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。
137	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。	522	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。
138	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。	523	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
139	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。	524	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
140	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。	525	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。
141	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。	526	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
142	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。	527	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
143	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。	528	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。
144	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。	529	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。

10

20

30

40

【表 7】

表	行表題	表	行表題
145	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。	530	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。
146	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。	531	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。
147	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。	532	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。
148	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。	533	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。
149	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。	534	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。
150	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。	535	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。
151	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。	536	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。
152	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。	537	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。
153	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。	538	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
154	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。	539	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
155	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。	540	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
156	AはA-1eであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	541	AはA-1dであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
157	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	542	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
158	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	543	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
159	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	544	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
160	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	545	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
161	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	546	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
162	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	547	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
163	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	548	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
164	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	549	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
165	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	550	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
166	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	551	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
167	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	552	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
168	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	553	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
169	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	554	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
170	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	555	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
171	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	556	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
172	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。	557	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。
173	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。	558	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。
174	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。	559	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。
175	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。	560	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。
176	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。	561	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
177	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。	562	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。
178	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。	563	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。
179	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。	564	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
180	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。	565	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。
181	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。	566	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。

10

20

30

40

【表 8】

表	行表題	表	行表題
182	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- CF_3 である。	567	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- CF_3 である。
183	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- CF_3 である。	568	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- CF_3 である。
184	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。	569	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。
185	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。	570	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。
186	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。	571	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。
187	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。	572	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。
188	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。	573	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。
189	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。	574	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。
190	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。	575	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。
191	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。	576	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。
192	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。	577	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。
193	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。	578	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。
194	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。	579	AはA-1cであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。
195	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	580	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。
196	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。	581	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。
197	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。	582	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。
198	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。	583	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。
199	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。	584	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。
200	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。	585	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。
201	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。	586	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。
202	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。	587	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。
203	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。	588	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。
204	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。	589	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。
205	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。	590	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。
206	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。	591	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。
207	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。	592	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。
208	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。	593	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。
209	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。	594	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。
210	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。	595	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。
211	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。	596	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。
212	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。	597	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。
213	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。	598	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。
214	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。	599	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。
215	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	600	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。
216	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	601	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。
217	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。	602	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。
218	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。	603	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。

10

20

30

40

【表 9】

表	行表題	表	行表題
219	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-c-Prである。	604	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。
220	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。	605	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。
221	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。	606	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。
222	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。	607	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。
223	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。	608	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。
224	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。	609	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。
225	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。	610	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。
226	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。	611	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。
227	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。	612	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。
228	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。	613	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。
229	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。	614	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。
230	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。	615	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。
231	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。	616	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。
232	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。	617	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。
233	AはA-1fであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。	618	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。
234	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	619	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。
235	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。	620	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。
236	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。	621	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。
237	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。	622	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。
238	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。	623	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。
239	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。	624	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。
240	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。	625	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。
241	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。	626	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。
242	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。	627	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。
243	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。	628	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。
244	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。	629	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。
245	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。	630	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。
246	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。	631	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。
247	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。	632	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。
248	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。	633	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。
249	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。	634	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。
250	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。	635	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。
251	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。	636	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-i-Prである。
252	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。	637	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-i-Prである。
253	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-i-Prである。	638	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-i-Prである。
254	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-i-Prである。	639	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-c-Prである。
255	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-i-Prである。	640	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-c-Prである。

10

20

30

【表 10】

表	行表題	表	行表題
256	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-c-Prである。	641	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-c-Prである。
257	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-c-Prである。	642	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。
258	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-c-Prである。	643	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。
259	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。	644	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。
260	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。	645	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。
261	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。	646	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。
262	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。	647	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。
263	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。	648	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。
264	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。	649	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。
265	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。	650	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。
266	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。	651	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。
267	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。	652	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。
268	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。	653	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。
269	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。	654	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。
270	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。	655	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。
271	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。	656	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。
272	AはA-1gであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。	657	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。
273	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	658	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。
274	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。	659	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。
275	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。	660	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。
276	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。	661	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。
277	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。	662	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。
278	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。	663	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。
279	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。	664	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。
280	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。	665	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。
281	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。	666	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。
282	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。	667	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。
283	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。	668	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。
284	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。	669	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。
285	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。	670	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。
286	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。	671	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。
287	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。	672	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。
288	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。	673	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。
289	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。	674	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-i-Prである。
290	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。	675	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-i-Prである。
291	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。	676	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-i-Prである。
292	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-i-Prである。	677	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-c-Prである。

10

20

30

40

【0190】

【表 1 1】

表	行表題	表	行表題
293	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	678	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。
294	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	679	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。
295	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。	680	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。
296	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。	681	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。
297	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。	682	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。
298	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。	683	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。
299	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。	684	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。
300	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。	685	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。
301	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。	686	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。
302	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。	687	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。
303	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。	688	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。
304	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。	689	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。
305	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。	690	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。
306	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。	691	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。
307	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。	692	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。
308	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。	693	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。
309	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。	694	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。
310	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。	695	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。
311	AはA-1hであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。	696	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。
312	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	697	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。
313	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。	698	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。
314	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。	699	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。
315	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。	700	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。
316	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。	701	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。
317	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。	702	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。
318	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。	703	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。
319	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。	704	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。
320	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。	705	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。
321	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。	706	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。
322	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。	707	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。
323	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。	708	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。
324	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。	709	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。
325	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。	710	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。
326	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。	711	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。
327	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。	712	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>i</i> -Prである。
328	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。	713	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>i</i> -Prである。
329	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。	714	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。

10

20

30

40

【0 1 9 1】

【表 1 2】

表	行表題	表	行表題
330	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。	715	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-c-Prである。
331	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-i-Prである。	716	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-c-Prである。
332	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-i-Prである。	717	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-c-Prである。
333	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-i-Prである。	718	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。
334	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-c-Prである。	719	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。
335	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-c-Prである。	720	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。
336	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-c-Prである。	721	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。
337	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。	722	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。
338	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。	723	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。
339	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。	724	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。
340	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。	725	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。
341	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。	726	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。
342	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。	727	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。
343	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。	728	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。
344	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。	729	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。
345	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。	730	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。
346	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。	731	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。
347	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-TMSである。	732	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Fである。
348	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-TMSである。	733	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Fである。
349	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Meである。	734	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Fである。
350	AはA-1iであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Meである。	735	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Clである。
351	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ はHである。	736	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Clである。
352	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Fである。	737	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Clである。
353	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Fである。	738	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Brである。
354	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Fである。	739	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Brである。
355	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Clである。	740	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Brである。
356	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Clである。	741	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Iである。
357	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Clである。	742	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Iである。
358	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Brである。	743	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Iである。
359	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Brである。	744	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Meである。
360	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Brである。	745	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Meである。
361	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Iである。	746	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Meである。
362	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Iである。	747	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Etである。
363	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Iである。	748	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-Etである。
364	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Meである。	749	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-Etである。
365	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Meである。	750	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-i-Prである。
366	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Meである。	751	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-i-Prである。

10

20

30

40

【0 1 9 2】

【表 1 3】

表	行表題	表	行表題
367	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-Etである。	752	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>i</i> -Prである。
368	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-Etである。	753	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2- <i>c</i> -Prである。
369	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-Etである。	754	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ- <i>c</i> -Prである。
370	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>i</i> -Prである。	755	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ- <i>c</i> -Prである。
371	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	756	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-CF ₃ である。
372	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>i</i> -Prである。	757	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-CF ₃ である。
373	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3- <i>c</i> -Prである。	758	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-CF ₃ である。
374	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ- <i>c</i> -Prである。	759	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OMeである。
375	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ- <i>c</i> -Prである。	760	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OMeである。
376	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-CF ₃ である。	761	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OMeである。
377	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-CF ₃ である。	762	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-OCF ₃ である。
378	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-CF ₃ である。	763	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-OCF ₃ である。
379	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OMeである。	764	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-OCF ₃ である。
380	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OMeである。	765	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-TMSである。
381	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OMeである。	766	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,3-ジ-TMSである。
382	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-OCF ₃ である。	767	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,6-ジ-TMSである。
383	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2,5-ジ-OCF ₃ である。	768	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-6-Fである。
384	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3,5-ジ-OCF ₃ である。	769	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は2-Cl-5-Fである。
385	AはA-1jであり、および、 $(R^3)_n$ は3-TMSである。		

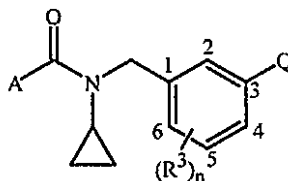
10

20

【0 1 9 3】

【表 1 4】

表 770

AはA-1aであり、 $(R^3)_n$ はHである。

30

Q	Q	Q
3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
4-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
5-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-1-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-1-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
5-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-1-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル
3-OMe-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル

40

【0 1 9 4】

【表 15】

3-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-OMe-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	10
4-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
5-CN-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-OCHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,5-ジ-F-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	4-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,5-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	5-MeOC(=O)-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
5-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,5-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-CF ₃ -5-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3,4-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	3,4-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	
3-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
3-F-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Br-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	20
3,5-ジ-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-Br-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	4-Me-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-CF ₃ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4-CHF ₂ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-F-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Cl-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4-Br-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Ph-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Me-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
4,5-ジ-CF ₃ -2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Cl-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4,5-ジ-Br-2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	
2 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-2-イル	4-Me-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	
4-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-F-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-Cl-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	
4-Br-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	4-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	1 <i>H</i> -[1,2,3]トリアゾール-1-イル	
3-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3-CHF ₂ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	
3,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	2,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	30
2,4-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-Br-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	3,4-ジ-Cl-1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	
1 <i>H</i> -ピロール-1-イル	1-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-(F ₃ CCH ₂)-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1,4-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	
1-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Et-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-(F ₃ CCH ₂)-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1,3-ジ-Me-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	3-Me-1-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	
1-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-Et-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	
1- <i>i</i> -Pr-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	1-Ph-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-3-イル	5-Ph-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル	
3,5-ジ-Me-1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-CF ₃ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	3,5-ジ-CHF ₂ -1 <i>H</i> -[1,2,4]トリアゾール-1-イル	
5-CF ₃ -2,4-ジヒドロ-3-オキソピラゾール-1-イル	5-Me-2,4-ジヒドロ-3-オキソピラゾール-1-イル		

【0195】

本開示はまた表 771 ~ 1539 を含み、これらの各々は、表 771 中の行表題（すなわち、「A は A - 1 a であり、および、R³ は H である。」）が以下に示されている行表題の各々で置き換えられていることを除き、上記の表 770 と同じく構成されている。例えば、表 771 において、行表題は「A は A - 1 a であり、および、R³ は 2 - F である」であり、Q は、上記の表 1 において定義されているとおりである。それ故、表 771 中の最初の項目は、特異的に N - [[2 - フルオロ - 3 - (3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) フェニル] メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドを開示している。表 772 ~ 1539 が同様に構成されている。

【0196】

【表 16】

表 771~1539

表	行表題	表	行表題
771	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1156	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。
772	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1157	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。
773	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1158	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。
774	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1159	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。
775	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1160	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
776	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1161	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
777	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1162	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
778	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1163	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
779	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1164	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
780	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1165	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
781	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1166	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
782	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1167	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
783	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1168	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
784	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1169	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
785	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1170	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
786	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1171	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
787	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1172	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
788	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1173	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
789	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1174	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
790	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1175	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
791	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1176	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
792	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1177	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
793	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1178	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
794	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1179	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
795	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1180	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
796	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1181	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
797	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1182	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
798	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1183	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
799	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1184	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
800	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1185	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
801	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1186	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
802	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1187	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
803	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1188	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 17】

804	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1189	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
805	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1190	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ O である。
806	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1191	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
807	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1192	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
808	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1193	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
809	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1194	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
810	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1195	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
811	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1196	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
812	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1197	A は A-1a であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
813	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1198	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
814	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1199	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
815	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1200	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
816	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1201	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
817	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1202	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
818	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1203	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
819	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1204	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
820	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1205	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
821	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1206	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
822	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1207	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
823	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1208	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
824	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1209	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
825	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1210	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
826	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1211	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
827	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1212	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
828	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1213	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
829	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1214	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
830	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1215	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
831	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1216	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
832	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1217	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
833	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1218	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
834	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1219	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
835	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1220	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
836	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1221	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
837	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1222	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
838	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1223	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
839	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1224	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
840	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1225	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
841	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1226	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 18】

842	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1227	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
843	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1228	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。
844	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1229	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
845	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1230	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
846	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1231	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
847	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1232	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
848	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1233	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
849	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1234	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
850	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1235	A は A-1b であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
851	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1236	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
852	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1237	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
853	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1238	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
854	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1239	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
855	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1240	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
856	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1241	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
857	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1242	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
858	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1243	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
859	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1244	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
860	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1245	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
861	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1246	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
862	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1247	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
863	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1248	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
864	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1249	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
865	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1250	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
866	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1251	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
867	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1252	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
868	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1253	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
869	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1254	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
870	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1255	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
871	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1256	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
872	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1257	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
873	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1258	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
874	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1259	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
875	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1260	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
876	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1261	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
877	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1262	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
878	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1263	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
879	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1264	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 19】

880	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1265	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。	
881	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1266	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。	
882	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1267	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。	
883	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1268	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。	
884	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1269	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。	
885	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1270	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。	
886	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1271	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。	
887	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1272	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。	10
888	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1273	A は A-1c であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。	
889	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1274	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。	
890	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1275	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。	
891	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1276	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。	
892	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1277	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。	
893	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1278	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。	
894	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1279	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。	
895	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1280	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。	
896	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1281	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。	20
897	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1282	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。	
898	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1283	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。	
899	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1284	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。	
900	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1285	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。	
901	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1286	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。	
902	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1287	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。	
903	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1288	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。	
904	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1289	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。	
905	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1290	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。	30
906	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1291	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。	
907	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1292	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。	
908	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1293	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
909	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1294	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
910	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1295	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。	
911	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1296	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
912	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1297	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
913	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1298	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。	
914	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1299	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。	40
915	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1300	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。	
916	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1301	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。	
917	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1302	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。	

【表 2 0】

918	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1303	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。	
919	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1304	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。	
920	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1305	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。	
921	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1306	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。	
922	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1307	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。	
923	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1308	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。	
924	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1309	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。	
925	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1310	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。	10
926	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1311	A は A-1d であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。	
927	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1312	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。	
928	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1313	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。	
929	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1314	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。	
930	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1315	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。	
931	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1316	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。	
932	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1317	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。	
933	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1318	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。	
934	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1319	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。	20
935	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1320	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。	
936	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1321	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。	
937	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1322	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。	
938	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1323	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。	
939	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1324	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。	
940	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1325	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。	
941	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1326	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。	
942	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1327	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。	
943	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1328	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。	30
944	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1329	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。	
945	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1330	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。	
946	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1331	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
947	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1332	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
948	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1333	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。	
949	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1334	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
950	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1335	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
951	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1336	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。	
952	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1337	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。	40
953	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1338	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。	
954	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1339	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。	
955	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1340	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。	

【表 2 1】

956	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1341	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
957	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1342	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。
958	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1343	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
959	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1344	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
960	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1345	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
961	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1346	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
962	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1347	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
963	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1348	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
964	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1349	A は A-1e であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
965	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1350	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
966	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1351	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
967	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1352	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
968	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1353	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
969	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1354	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
970	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1355	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
971	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1356	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
972	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1357	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
973	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1358	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
974	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1359	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
975	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1360	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
976	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1361	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
977	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1362	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
978	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1363	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
979	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1364	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
980	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1365	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
981	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1366	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
982	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1367	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
983	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1368	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
984	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1369	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
985	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1370	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
986	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1371	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
987	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1372	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
988	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1373	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
989	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1374	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
990	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1375	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
991	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1376	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
992	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1377	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
993	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1378	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 2 2】

994	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1379	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
995	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1380	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。
996	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1381	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
997	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1382	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
998	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1383	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
999	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1384	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
1000	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1385	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
1001	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1386	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
1002	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1387	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
1003	A は A-1f であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1388	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
1004	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1389	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
1005	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1390	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
1006	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1391	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
1007	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1392	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
1008	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1393	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
1009	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1394	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
1010	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1395	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
1011	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1396	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
1012	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1397	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
1013	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1398	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
1014	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1399	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
1015	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1400	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
1016	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1401	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
1017	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1402	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
1018	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1403	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
1019	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1404	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
1020	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1405	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
1021	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1406	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
1022	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1407	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1023	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1408	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1024	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1409	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
1025	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1410	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1026	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1411	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1027	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1412	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
1028	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1413	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
1029	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1414	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
1030	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1415	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
1031	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-CF ₃ である。	1416	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 2 3】

1032	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1417	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
1033	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1418	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。
1034	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1419	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
1035	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1420	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
1036	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1421	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
1037	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1422	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
1038	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1423	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
1039	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1424	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
1040	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1425	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
1041	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1426	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
1042	A は A-1g であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1427	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
1043	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1428	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
1044	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1429	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
1045	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1430	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
1046	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1431	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
1047	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1432	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
1048	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1433	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
1049	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1434	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
1050	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1435	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
1051	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1436	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
1052	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1437	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
1053	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1438	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
1054	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1439	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
1055	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1440	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
1056	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1441	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
1057	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1442	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
1058	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1443	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
1059	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1444	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
1060	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1445	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1061	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1446	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1062	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1447	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
1063	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1448	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1064	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1449	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1065	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1450	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-CF ₃ である。
1066	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1451	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-CF ₃ である。
1067	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1452	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-CF ₃ である。
1068	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-CF ₃ である。	1453	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。
1069	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-CF ₃ である。	1454	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。

10

20

30

40

【表 2 4】

1070	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- CF_3 である。	1455	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Ome である。
1071	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Ome である。	1456	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- OCF_3 である。
1072	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Ome である。	1457	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- OCF_3 である。
1073	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Ome である。	1458	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- OCF_3 である。
1074	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- OCF_3 である。	1459	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
1075	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- OCF_3 である。	1460	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
1076	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- OCF_3 である。	1461	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
1077	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1462	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
1078	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1463	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
1079	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1464	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。
1080	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1465	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。
1081	A は A-1h であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1466	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。
1082	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1467	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。
1083	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1468	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。
1084	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1469	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。
1085	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1470	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。
1086	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1471	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。
1087	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1472	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。
1088	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1473	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。
1089	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1474	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。
1090	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1475	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。
1091	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1476	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。
1092	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1477	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。
1093	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1478	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。
1094	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1479	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。
1095	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1480	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。
1096	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1481	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。
1097	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1482	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。
1098	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1483	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1099	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1484	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。
1100	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1485	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。
1101	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1486	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1102	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1487	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。
1103	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1488	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- CF_3 である。
1104	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1489	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- CF_3 である。
1105	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1490	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- CF_3 である。
1106	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1491	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Ome である。
1107	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- CF_3 である。	1492	A は A-1i であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Ome である。

10

20

30

40

【表 2 5】

1108	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- CF_3 である。	1493	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。	
1109	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- CF_3 である。	1494	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。	
1110	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1495	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。	
1111	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1496	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。	
1112	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1497	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。	
1113	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1498	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。	
1114	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1499	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。	
1115	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1500	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。	10
1116	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。	1501	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。	
1117	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-TMS である。	1502	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-F である。	
1118	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-TMS である。	1503	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-F である。	
1119	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-F である。	1504	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-F である。	
1120	A は A-li であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-F である。	1505	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Cl である。	
1121	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は H である。	1506	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Cl である。	
1122	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-F である。	1507	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Cl である。	
1123	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-F である。	1508	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Br である。	
1124	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-F である。	1509	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Br である。	20
1125	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl である。	1510	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Br である。	
1126	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Cl である。	1511	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-I である。	
1127	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Cl である。	1512	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-I である。	
1128	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Br である。	1513	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-I である。	
1129	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Br である。	1514	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Me である。	
1130	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Br である。	1515	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Me である。	
1131	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-I である。	1516	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Me である。	
1132	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-I である。	1517	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-Et である。	
1133	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-I である。	1518	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-Et である。	30
1134	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Me である。	1519	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-Et である。	
1135	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Me である。	1520	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>i</i> -Pr である。	
1136	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Me である。	1521	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
1137	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Et である。	1522	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>i</i> -Pr である。	
1138	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-Et である。	1523	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- <i>c</i> -Pr である。	
1139	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-Et である。	1524	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
1140	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>i</i> -Pr である。	1525	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- <i>c</i> -Pr である。	
1141	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1526	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4- CF_3 である。	
1142	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>i</i> -Pr である。	1527	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ- CF_3 である。	40
1143	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- <i>c</i> -Pr である。	1528	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ- CF_3 である。	
1144	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1529	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OMe である。	
1145	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- <i>c</i> -Pr である。	1530	A は A-lj であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OMe である。	

【表 2 6】

1146	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2- CF_3 である。	1531	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OMe である。
1147	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ- CF_3 である。	1532	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-OCF ₃ である。
1148	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ- CF_3 である。	1533	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-OCF ₃ である。
1149	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OMe である。	1534	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-OCF ₃ である。
1150	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OMe である。	1535	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 4-TMS である。
1151	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OMe である。	1536	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,5-ジ-TMS である。
1152	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-OCF ₃ である。	1537	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 4,5-ジ-TMS である。
1153	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,4-ジ-OCF ₃ である。	1538	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-6-Me である。
1154	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2,6-ジ-OCF ₃ である。	1539	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-Cl-4-Me である。
1155	A は A-1j であり、および、 $(R^3)_n$ は 2-TMS である。		

10

【0207】

配合物 / 実用性

本発明の式 1 の化合物（その N - オキシドおよび塩を含む）は、一般に、組成物において、キャリアとされる界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加のコンポーネントと共に、殺菌・殺力ビ性活性処方成分（すなわち配合物）として用いられるであろう。配合物または組成物処方成分は、活性処方成分の物理特性、適用形態、ならびに、土壌タイプ、水分および温度などの環境要因と適合するよう選択される。

20

【0208】

有用な配合物は液体組成物および固体組成物の両方を含む。液体組成物としては、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物および / またはサスポエマルジョンを含む）等が挙げられ、これらは、任意選択により、ゲルに増粘可能である。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮物、懸濁濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物およびサスポエマルジョンである。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物および油分散体である。

30

【0209】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、顆粒、ペレット、ブリル、香錠、錠剤、充填フィルム（種子粉衣を含む）等であり、これらは、水分散性（「湿潤性」）または水溶性であることが可能である。フィルム形成性溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングが種子処理に特に有用である。活性処方成分は、（マイクロ）カプセル化されていることが可能であり、さらに、懸濁液または固体配合物に形成されることが可能である；あるいは、活性処方成分の全配合物をカプセル化（または「オーバーコート」）することが可能である。カプセル化により、活性処方成分の放出を制御または遅延させることが可能である。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物配合物の利点と乾燥顆粒状配合物の利点の両方を兼ね備えている。高濃度組成物は、さらなる配合物への中間体として主に用いられる。

40

【0210】

噴霧可能な配合物は、典型的には、吹付けの前に好適な媒体中で希釈される。このような液体および固体配合物は、通常は水であるがまれに、芳香族またはパラフィン系炭化水素または植物油のような他の好適な媒体である、噴霧媒体中で容易に希釈されるよう配合される。噴霧量は、およそ約 1 ~ 数千リットル / ヘクタールの範囲であることが可能であるが、より典型的には、約 10 ~ 数百リットル / ヘクタールの範囲である。噴霧可能な配合物は、空中もしくは地上散布による葉の処理のために、または、植物の成長培地への適用のために好適な他の媒体または水と、タンク中で混合されることが可能である。液体お

50

よび乾燥配合物は、注入灌漑システムに直接的に計量可能であり、または、植え付けの最中に畝間に計量可能である。液体および固体配合物は、植え付けの前に、全身摂取を介して成長する根および他の地下植物部位および/または群葉を保護するために、作物および他の望ましい植生の種子に種子処理として適用されることが可能である。

【0211】

配合物は、典型的には、合計で100重量パーセントとなる以下のおおよその範囲内で有効量の活性処方成分、希釈剤および界面活性剤を含有するであろう。

【0212】

【表27】

	重量パーセント		
	活性 処方成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性顆粒、錠剤および粉末	0.001~90	0~99.999	0~15
油分散体、懸濁液、エマルジョン、溶液 (乳化性濃縮物を含む)	1~50	40~99	0~50
粉剤	1~25	70~99	0~5
顆粒およびペレット	0.001~95	5~99.999	0~15
高濃度組成物	90~99	0~10	0~2

10

20

【0213】

固体希釈剤としては、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンなどのクレイ、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖質（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに、硫酸ナトリウムが挙げられる。典型的な固体希釈剤は、Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに記載されている。

30

【0214】

液体希釈剤としては、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリジノン）、アルキルリン酸塩（例えば、リン酸トリエチル）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、炭酸プロピレン、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、正パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族化脂肪族、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンなどのケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシルおよび酢酸イソボルニルなどの酢酸塩、アルキル化乳酸塩エステル、二塩基性エステル、アルキルおよびアリール安息香酸塩および-ブチロラクトンなどの他のエステル、ならびに、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾ

40

50

ールおよびベンジルアルコールなどの直鎖、分岐、飽和または不飽和であることが可能であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としてはまた、植物種子および果実油（例えば、オリーブ、ヒマ、亜麻仁、ゴマ、コーン（トウモロコシ）、ピーナッツ、ヒマワリ、ブドウ種子、ペニバナ、綿実、ダイズ、ナタネ、ココナツおよびパーム核の油）、動物性脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝、魚油）、ならびに、これらの混合物などの飽和および不飽和脂肪酸のグリセロールエステル（典型的には $C_6 \sim C_{22}$ ）が挙げられる。液体希釈剤としてはまた、アルキル化脂肪酸（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）が挙げられ、ここで、脂肪酸は、植物および動物由来のグリセロールエステルの加水分解によって入手され得、蒸留により精製されることが可能である。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。

10

【0215】

本発明の固体および液体組成物は、度々、1種または複数種の界面活性剤を含む。液体に添加される場合、界面活性剤（「表面活性薬剤」としても知られている）は、一般に、液体の表面張力を変性（最も頻繁には低減）させる。界面活性剤分子中の親水性基および親油性基の性質に応じて、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用であることが可能である。

【0216】

界面活性剤は、ノニオン性、アニオン性またはカチオン性に分類されることが可能である。本組成物に有用なノニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：天然および合成アルコール（分岐または直鎖であり得る）系であり、ならびに、アルコールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されるアルコールアルコキシレートなどのアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミドおよびエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化ダイズ油、ヒマシ油およびナタネ油などのアルコキシル化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレートおよびドデシルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノールアルコキシレート（フェノールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたもの）；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドから調製されたブロックポリマー、および、末端ブロックがプロピレンオキシドから調製された逆ブロックポリマー；エトキシル化脂肪酸；エトキシル化脂肪エステルおよび油；エトキシル化メチルエステル；エトキシル化トリステアシルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたものを含む）；ポリエトキシル化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシル化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシル化グリセロール脂肪酸エステルなどの脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリン系誘導体、ポリエトキシレートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキドPEG（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトまたはくし形ポリマーおよび星形ポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（PEG）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコン系界面活性剤；ならびに、スクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキル多糖類などの糖質 - 誘導体が挙げられる。

20

30

40

【0217】

有用なアニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アルキルアリアルスルホン酸およびこれらの塩；カルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホネート誘導体；リグノスルホネートなどのリグニンおよびリグニン誘導体；マレイン酸またはコハク酸またはこれらの無水物；オレフィンスルホン酸塩；アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステルおよびステアシルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質系界面活性剤；サルコシン誘導体；硫酸ステアシルフェノールエーテル；油および脂肪酸の硫酸塩およびスルホン酸塩；エトキシル化アルキルフェノール

50

の硫酸塩およびスルホン酸塩；アルコールの硫酸塩；エトキシ化アルコールの硫酸塩；N，N - アルキルトアラートなどのアミンおよびアミドのスルホン酸塩；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびに、ドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩；縮合ナフタレンのスルホン酸塩；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩；精留された石油のスルホン酸塩；スクシナメート；ならびに、ジアルキルスルホコハク酸塩などのスルホコハク酸塩およびそれらの誘導体が挙げられる。

【0218】

有用なカチオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アミドおよびエトキシ化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレントトラアミン、ならびに、エトキシ化アミン、エトキシ化ジアミンおよびプロポキシ化アミンなどのアミン（アミンおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたもの）；アミン酢酸塩およびジアミン塩などのアミン塩；第4級塩、エトキシ化第4級塩およびジ第4級塩などの第4級アンモニウム塩；ならびに、アルキルジメチルアミノオキシドおよびビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミノオキシドなどのアミノオキシドが挙げられる。

【0219】

ノニオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物、または、ノニオン性界面活性剤とカチオン性界面活性剤との混合物もまた本組成物について有用である。ノニオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤およびカチオン性界面活性剤、ならびに、これらの推奨される使用が、McCUTCHEON'S Emulsifiers and Detergents, McCUTCHEON'S Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 発行の年刊国際および北米版；SISELY and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；および、A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987を含む多様な発行済みの文献中に開示されている。

【0220】

本発明の組成物はまた、配合助剤、および、当業者に配合助剤として公知である添加剤を含有していてもよい（これらのいく種かは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能するとみなされ得る）。このような配合助剤および添加剤は：pH（緩衝剤）、処理中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、有効成分の析出（懸濁剤）、粘度（チクソトロピー性増粘剤）、容器中の微生物の増殖（抗菌剤）、生成物の凍結（不凍液）、色（染料／顔料分散体）、洗濯堅牢性（塗膜形成剤または展着剤）、蒸発（蒸発抑制剤）および他の配合属性を制御し得る。塗膜形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン - ビニルアセテートコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。配合助剤および添加剤の例としては、McCUTCHEON'S Volume 2: Functional Materials, McCUTCHEON'S Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 発行の年刊国際および北米版；ならびに、国際公開第03/024222号パンフレットに列挙されているものが挙げられる。

【0221】

式1の化合物およびいずれかの他の有効成分は、典型的には、有効成分を溶剤中に溶解させることにより、または、液体もしくは乾燥希釈剤中に粉碎することにより、本組成物中に組み込まれる。乳化性濃縮物を含む溶液は、単に処方成分を混合することにより調製することが可能である。乳化性濃縮物として用いることが意図されている液体組成物の溶剤が不水和性である場合、乳化剤は、典型的には、水での希釈時に有効成分含有溶剤が乳化するよう添加される。2,000 μm以下の粒径を有する有効成分スラリーは、媒体ミ

10

20

30

40

50

ルを用いて湿潤粉碎されて、 $3\text{ }\mu\text{m}$ 未満の平均直径を有する粒子とされることが可能である。水性スラリーは、最終懸濁濃縮物（例えば、米国特許第3,060,084号明細書を参照のこと）とされるか、または、噴霧乾燥によりさらに処理されて水-分散性顆粒が形成されることが可能である。乾燥配合物は、通常は、 $2\sim 10\text{ }\mu\text{m}$ の範囲内の平均粒径をもたらす乾式粉碎プロセスを必要とする。粉剤および粉末は、ブレンド工程および通常は粉碎工程により調製されることが可能である（ハンマーミルまたは流体-エネルギーミルなどで）。顆粒およびペレットは、予め形成した粒状キャリアに有効成分材を吹付けることにより、または、凝塊技術により調製されることが可能である。Browning, 「Agglomeration」, Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57およびそれ以降、ならびに、国際公開第91/13546号パンフレットを参照のこと。ペレットは、米国特許第4,172,714号明細書に記載のとおり調製することが可能である。水分散性および水溶性顆粒は、米国特許第4,144,050号明細書、米国特許第3,920,442号明細書および独国特許第3,246,493号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。錠剤は、米国特許第5,180,587号明細書、米国特許第5,232,701号明細書および米国特許第5,208,030号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。フィルムは、英国特許2,095,558号明細書および米国特許第3,299,566号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。本発明の一実施形態は、本発明の殺菌・殺力ビ組成物（界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤と配合された式1の化合物、または、式1の化合物と少なくとも1種の他の殺菌・殺力ビ剤との配合混合物）を水で希釈するステップ、任意選択により、補助剤を添加して希釈組成物を形成するステップ、ならびに、真菌性病原体またはその環境に有効量の前記希釈組成物を接触させるステップを含む、真菌性病原体の防除方法に関する。

10

20

30

40

50

【0222】

本殺菌・殺力ビ組成物が十分な濃度となるよう水で希釈されて形成される噴霧組成物は真菌性病原体の防除に十分な効力を提供することが可能であるが、別個に配合された補助剤生成物を噴霧タンク混合物に添加することも可能である。これらの追加の補助剤は通例、「噴霧補助剤」または「タンク混合補助剤」として公知であり、有害生物防除剤の性能を向上させるか、または、噴霧混合物の物理特性を改変するために噴霧タンクにおいて混合されるいずれかの物質を含む。補助剤は、アニオン性またはノニオン性界面活性剤、乳化剤、石油系作物油、作物由来の種子油、酸性化剤、緩衝剤、増粘剤または消泡剤であることが可能である。補助剤は、効力（例えば、生物学的活性、付着性、浸透性、被覆均一性および保護の耐久性）を高めるため、または、配合禁忌、発泡、流動性、蒸発、揮発および分解に関連する噴霧適用に係る問題を最低限とするかもしくは排除するために用いられる。最適な性能を得るために、補助剤は、活性処方成分、配合物および標的（例えば、作物、昆虫有害生物）の特性に関連して選択される。

【0223】

噴霧混合物に添加される補助剤の量は、一般に、約2.5%～0.1体積%の範囲である。噴霧混合物に添加される補助剤の施用量は、典型的には、1ヘクタール当たり約1～5Lである。噴霧補助剤の代表例としては：液体炭化水素中の47%メチル化ナタネ油であるAdigor（登録商標）（Syngenta）、ポリアルキレンオキシド変性ヘプタメチルトリシロキサンであるSilwet（登録商標）（Helena Chemical Company）、および、83%パラフィン系鉱油中の17%界面活性剤ブレンドであるAssist（登録商標）（BASF）が挙げられる。

【0224】

種子処理する方法の1つは、種子を播種する前に、種子に本発明の化合物を（すなわち、配合された組成物として）吹付けまたは散粉することによるものである。種子処理用に配合された組成物は、一般に、塗膜形成剤または接着剤を含む。従って、典型的には、本

発明の種子粉衣組成物は、生物学的に有効な量の式 1 の化合物、および、塗膜形成剤または接着剤を含む。種子は、流動性の懸濁液濃縮物を直接的に種子の回転床に吹付け、次いで、これらの種子を乾燥させることによりコート可能である。あるいは、湿った粉末、溶液、サスポエマルジョン、乳化性濃縮物および水中のエマルジョンなどの他の配合物タイプを種子に噴霧することが可能である。このプロセスは、フィルムコーティングを種子に適用するために特に有用である。種々のコーティング機器およびプロセスが当業者に利用可能である。好適なプロセスとしては、P. Koster et al., Seed Treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Monograph No. 57、および、この中に列挙された文献に列挙されたものが挙げられる。

10

【0225】

配合の技術分野に関するさらなる情報については、T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120 - 133 を参照のこと。また、米国特許第 3, 235, 361 号明細書、第 6 欄、第 16 行～第 7 欄、第 19 行および実施例 10～41；米国特許第 3, 309, 192 号明細書、第 5 欄、第 43 行～第 7 欄、第 62 行および実施例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167 および 169～182；米国特許第 2, 891, 855 号明細書、第 3 欄、第 66 行～第 5 欄、第 17 行および実施例 1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp. 81 - 96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；ならびに、Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000 を参照のこと。

20

30

【0226】

以下の実施例において、すべての割合は重量基準であり、すべての配合物は従来の方法調製されている。化合物番号は索引表 A～F 中の化合物を指す。さらなる詳細を伴わずに、前記の記載を用いることにより、当業者は、本発明を最大限利用可能であると考えられている。以下の実施例は、従って、単なる例示としてみなされるべきであり、本開示を如何様にも限定するものではない。別途記載されていない限り、割合は重量基準である。

【0227】

実施例 A

高濃度濃縮物

化合物 3	98.5%
シリカエアロゲル	0.5%
合成アモルファス微細シリカ	1.0%

40

【0228】

実施例 B

水和剤

化合物 12	65.0%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%

50

モンモリロナイト（焼成）	23.0	
【0229】		
実施例 C		
顆粒		
化合物 3	10.0%	
アタパルジャイト顆粒（低揮発性物質、0.71 / 0.30 mm ; . 25 - 50 ふるい）	90.0%	U.S.S. No
【0230】		
実施例 D		
押出しペレット		10
化合物 1 2	25.0%	
無水硫酸ナトリウム	10.0%	
粗リグノスルホン酸カルシウム	5.0%	
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	
カルシウム / マグネシウムベントナイト	59.0%	
【0231】		
実施例 E		
乳化性濃縮物		
化合物 3	10.0%	
ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレート	20.0%	20
C 6 ~ C 10 脂肪酸メチルエステル	70.0%	
【0232】		
実施例 F		
マイクロエマルジョン		
化合物 1 2	5.0%	
ポリビニルピロリドン - 酢酸ビニルコポリマー	30.0%	
アルキルポリグリコシド	30.0%	
グリセリルモノオレエート	15.0%	
水	20.0%	
【0233】		30
実施例 G		
種子処理		
化合物 3	20.000%	
ポリビニルピロリドン - 酢酸ビニルコポリマー	5.000%	
モンタン酸ワックス	5.000%	
リグノスルホン酸カルシウム	1.000%	
ポリオキシエチレン / ポリオキシプロピレンブロックコポリマー	1.000%	
ステアリルアルコール（POE 20）	2.000%	
ポリオルガノシラン	0.200%	
着色剤赤色染料	0.050%	40
水	65.750%	
【0234】		
実施例 H		
肥料スティック		
化合物 3	2.500%	
ピロリドン - スチレンコポリマー	4.800%	
トリスチリルフェニル 16 - エトキシレート	2.300%	
タルク	0.800%	
コーンデンプン	5.000%	
緩効性肥料	36.000%	50

カオリン	38.00%	
水	10.60%	
【0235】		
実施例 I		
懸濁液濃縮物		
化合物 1 2	35%	
ブチルポリオキシエチレン / ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	
ステアリン酸 / ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサンタンガム	0.1%	10
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系脱泡剤	0.1%	
1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン	0.1%	
水	53.7%	
【0236】		
実施例 J		
水中エマルジョン		
化合物 3	10.0%	
ブチルポリオキシエチレン / ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	
ステアリン酸 / ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	20
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサンタンガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系脱泡剤	0.1%	
1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0%	
水	58.7%	
【0237】		
実施例 K		
油分散体		30
化合物 1 2	25%	
ポリオキシエチレン ソルビトール ヘキサオレエート	15%	
有機変性ベントナイトクレイ	2.5%	
脂肪酸メチルエステル	57.5%	
【0238】		
実施例 L		
サスポエマルジョン		
化合物 3	10.0%	
イミダクロプリド	5.0%	
ブチルポリオキシエチレン / ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	40
ステアリン酸 / ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサンタンガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系脱泡剤	0.1%	
1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0%	
水	53.7%	
【0239】		
水溶性および水分散性配合物は、典型的には、適用前に水で希釈されて水性組成物が形		50

成される。植物もしくはその一部に直接適用される水性組成物（例えば、噴霧タンク組成物）は、典型的には、本発明の化合物を少なくとも約 1 ppm 以上（例えば、1 ppm ~ 100 ppm）で含有する。

【0240】

種子は通常、種子 1 キログラム当たり約 0.001 g（より典型的には、約 0.1 g）~ 約 10 g（すなわち、処理前の種子の約 0.0001 ~ 1 重量%）の量で処理される。種子処理用に配合された流動性懸濁液は、典型的には、約 0.5 ~ 約 70 % の活性処方成分、約 0.5 ~ 約 30 % のフィルム形成性接着剤、約 0.5 ~ 約 20 % の分散剤、0 ~ 約 5 % の増粘剤、0 ~ 約 5 % の顔料および / または染料、0 ~ 約 2 % の消泡剤、0 ~ 約 1 % の防腐剤、ならびに、0 ~ 約 75 % の揮発性液体希釈剤を含む。

10

【0241】

本発明の化合物は植物病害防除剤として有用である。従って、本発明は、保護されるべき植物もしくはその一部または保護されるべき植物種子に、有効量の本発明の化合物または前記化合物を含有する殺菌・殺力ビ組成物を適用するステップを含む、真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法をさらに含む。本発明の化合物および / または組成物は、子囊菌門、担子菌門、接合菌門、および、真菌様卵菌門における広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる病害の防除をもたらす。これらは、広範囲の植物病害、特に、観賞植物、芝生、野菜、圃場、穀類および果実作物の葉病原体の防除において効果的である。これらの病原体としては、これらに限定されないが、表 1 に列挙されているものが挙げられる。子囊菌および担子菌に関しては、公知である場合、有性時代 / 有性世代 / 完全世代の名称、ならびに、無性時代 / 無性世代 / 不完全世代の名称（括弧中）の両方が列挙されている。病原体に係る同義名は、等号によって示されている。例えば、有性時代 / 有性世代 / 完全世代の名称 *Phaeosphaeria nodorum* の後に、対応する無性時代 / 無性世代 / 不完全世代の名称である *Stagnospora nodorum* および同義の旧名である *Septoria nodorum* が続いている。

20

【0242】

【表 2 8】

表 1

<p>アルテルナリアソラニ(<i>Alternaria solani</i>)、<i>A. アルテルナタ</i>(<i>A. alternata</i>)および <i>A. ブラシカ</i>(<i>A. brassicae</i>)、<i>ガイグナルディアビドウェリイ</i>(<i>Guignardia bidwellii</i>)、<i>ベンツリアイナエクアリス</i>(<i>Venturia inaequalis</i>)、<i>ピレノホラトリティシレペンティス</i>(<i>Pyrenophora tritici-repentis</i>)(<i>ドレシエラトリティシレペンティス</i>(<i>Drechslera tritici-repentis</i>)=<i>ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス</i>(<i>Helminthosporium tritici-repentis</i>))および <i>ピレノホラテレス</i>(<i>Pyrenophora teres</i>)(<i>ドレシエラテレス</i>(<i>Drechslera teres</i>) = <i>ヘルミントスポリウムテレス</i>(<i>Helminthosporium teres</i>))、<i>コリネスボラカッシイコラ</i>(<i>Corynespora cassiicola</i>)、<i>ファエオスファエリアノドルム</i>(<i>Phaeosphaeria nodorum</i>) (<i>スタゴノスポラノドルム</i>(<i>Stagonospora nodorum</i>)=<i>セプトリアノドルム</i>(<i>Septoria nodorum</i>))、<i>コクリオボルスカルボヌム</i>(<i>Cochliobolus carbonum</i>)および <i>C. ヘテロストロフス</i>(<i>C. heterostrophus</i>)、<i>レプトスファエリア</i>(<i>Leptosphaeria biglobosa</i>) および <i>L. マクランス</i>(<i>L. maculans</i>)を含む <i>プレオスポラ目</i>(<i>Pleosporales</i>)の子囊菌;</p>	10
<p><i>マイコスファエレラグラミニコラ</i>(<i>Mycosphaerella graminicola</i>) (<i>ジモセプトリアトリティシ</i>(<i>Zymoseptoria tritici</i>) = <i>セプトリアトリティシ</i>(<i>Septoria tritici</i>))、<i>M. ベルケレイ</i>(<i>M. berkeleyi</i>)(<i>セルコスボリジウムベルソナツム</i>(<i>Cercosporidium personatum</i>))、<i>M. アラキディス</i>(<i>M. arachidis</i>) (<i>セルコスボラアラキディコーラ</i>(<i>Cercospora arachidicola</i>))、<i>パッサロラソジナ</i>(<i>Passalora sojae</i>) (<i>セルコスボラソジナ</i>(<i>Cercospora sojae</i>))、<i>セルコスボラゼアエマイディス</i>(<i>Cercospora zeaemaydis</i>)および <i>C. ベチコラ</i>(<i>C. beticola</i>)を含む <i>マイコスファエレラレス目</i>(<i>Mycosphaerellales</i>)の子囊菌;</p>	20
<p><i>ブルメリアグラミニス</i>f.sp.<i>トリティシ</i>(<i>Blumeria graminis</i> f.sp.<i>tritici</i>)および <i>ブルメリアグラミニス</i>f.sp.<i>ホルデイ</i>(<i>Blumeria graminis</i> f.sp.<i>hordei</i>)、<i>エリシフェポリゴニ</i>(<i>Erysiphe polygoni</i>)、<i>E. ネカトル</i>(<i>E. necator</i>) (= <i>ウンシヌラネカトル</i>(<i>Uncinula necator</i>))、<i>ポドスファエラフリギネア</i>(<i>Podosphaera fuliginea</i>) (= <i>スファエロテカフリギネア</i>(<i>Sphaerotheca fuliginea</i>))、および、<i>ポドスファエラレウコトリカ</i>(<i>Podosphaera leucotricha</i>) (= <i>スファエロテカフリギネア</i>(<i>Sphaerotheca fuliginea</i>))などの <i>ウドンコカビ目</i>(<i>Erysiphales</i>)の子囊菌(ウドンコ病菌);</p>	20

【 0 2 4 3 】

【表 2 9】

<p>ボトリオチニアフッケリアナ(<i>Botryotinia fuckeliana</i>) (ボトリチスシネレア(<i>Botrytis cinerea</i>)), オクリマクラヤルンダエ(<i>Oculimacula yallundae</i>) (= タベシアヤルンダエ(<i>Tapesia yallundae</i>); 無性世代ヘルガルディアヘルボトリコイデス(<i>Helgardia herpotrichoides</i>)=シュードセルコスボレラヘルベトリコイデス(<i>Pseudocercospora herpetrichoides</i>)), モニリニアフルクティコーラ(<i>Monilinia fructicola</i>), シュレロチニアスクレロチオルム(<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>), シュレロチニアミノル(<i>Sclerotinia minor</i>), および、シュレロチニアホモエオカルパ(<i>Sclerotinia homoeocarpa</i>)などのビョウタケ目(<i>Helotiales</i>)の子囊菌;</p>	
<p>ギベラゼアエ(<i>Giberella zcae</i>) (フザリウムグラミネアルム(<i>Fusarium graminearum</i>)), G.モノリホルミス(<i>G.moniliformis</i>) (フザリウムモノリホルム(<i>Fusarium moniliforme</i>)), フザリウムソラニ(<i>Fusarium solani</i>)およびベルティシリウムダーリエ(<i>Verticillium dahliae</i>)などのヒボクレア目(<i>Hypocreales</i>)の子囊菌;</p>	10
<p>アスペルギルスフラバス(<i>Aspergillus flavus</i>)および A. パラシチクス(<i>A.parasiticus</i>)などのユーロチウム目(<i>Eurotiales</i>)の子囊菌;</p>	
<p>クリプトスフォレラビチコラ(<i>Cryptosporophora viticola</i>) (=ホモプシスビチコラ(<i>Phomopsis viticola</i>)), ホモプシスロンギコラ(<i>Phomopsis longicolla</i>), およびジアボルテファセオロルム(<i>Diaporthe phaseolorum</i>)などのジアボルタレス目(<i>Diaporthales</i>)の子囊菌;</p>	
<p>マグナボルテグリース(<i>Magnaporthe grisea</i>), ゲーウマノミセスグラミニス(<i>Gaeumannomyces graminis</i>), リンコスボリウムセカリス(<i>Rhynchosporium secalis</i>)などの他の子囊菌病原体、ならびに、グロメラアクタタ(<i>Glomerella acutata</i>) (コレトリカムアクタタ(<i>Colletotrichum acutatum</i>)), G. グラミニコラ(<i>G.graminicola</i>) (C. グラミニコラ(<i>C.graminicola</i>))および G. ラゲナリア(<i>G.lagenaria</i>) (C. オルビクラエ(<i>C.orbiculare</i>))などの炭疽病病原体;</p>	20
<p>プッシニアレコンディタ(<i>Puccinia recondita</i>), P. ストリエホルミス(<i>P.striiformis</i>), プッシニアホルデイ(<i>Puccinia hordei</i>), P. グラミニス(<i>P.graminis</i>)および P. アラキディス(<i>P.arachidis</i>)), ヘミレイアバスタトリクス(<i>Hemileia vastatrix</i>)およびファコプソラパチリジ(<i>Phakopsora pachyrhizi</i>)を含むウレジニアレス目(<i>Uredinales</i>)の担子菌(錆菌);</p>	
<p>タナトホルムククメリス(<i>Thanatophorum cucumeris</i>) (リゾクトニアソラニ(<i>Rhizoctonia solani</i>))およびセラトバシジウムオリゼーサチバエ(<i>Ceratobasidium oryzae sativae</i>) (リゾクトニアオリザエ(<i>Rhizoctonia oryzae</i>))などのセラトバシジアレス目(<i>Ceratobasidiales</i>)の担子菌;</p>	
<p>アテリアロルフイシイ(<i>Athelia rolfsii</i>) (スクレロティウムロルフイシイ(<i>Sclerotium rolfsii</i>))などのタマチョレイタケ目(<i>Polyporales</i>)の担子菌;</p>	30
<p>ウスチラゴマイディス(<i>Ustilago maydis</i>)などのクロボ菌目(<i>Ustilaginales</i>)の担子菌;</p>	
<p>リゾプスストロニファー(<i>Rhizopus stolonifer</i>)などのケカビ目(<i>Mucorales</i>)の接合菌綱(<i>Zygomycetes</i>);</p>	
<p>フィトフトラインフェスタンス(<i>Phytophthora infestans</i>), P. メガスベルマ(<i>P.megasperma</i>), P. パラシチカ(<i>P.parasitica</i>), P. ソジャエ(<i>P.sojae</i>), P. シナモミ(<i>P.cinnamomi</i>)および P. カプシチ(<i>P.capsici</i>)などのピチアレ目(<i>Pythiales</i>)の卵菌、ならびに、ピシウムアフアニデルマツム(<i>Pythium aphanidermatum</i>), P. グラミニコラ(<i>P.graminicola</i>), P. イレグラレ(<i>P.irregulare</i>), P. ウルチムム(<i>P.ultimum</i>)および P. ディソチックム(<i>P.dissoiticum</i>)などのピシウム属(<i>Pythium</i>)病原体;</p>	
<p>プラズモパラビチコーラ(<i>Plasmopara viticola</i>), P. ハルステジイ(<i>P.halstedii</i>), ペロノスポラヒオシヤミ(<i>Peronospora hyoscyami</i>) (=ペロノスポラタバシナ(<i>Peronospora tabacina</i>)), P. マンシュリカ(<i>P.manshurica</i>), ヒアロペロノスポラパラシチカ(<i>Hyaloperonospora parasitica</i>) (=ペロノスポラパラシチカ(<i>Peronospora parasitica</i>)), シュードペロノスポラクベンシス(<i>Pseudoperonospora cubensis</i>)およびブレミアラクツカエ(<i>Bremia lactucae</i>)などのツユカビ目(<i>Peronosporales</i>)の卵菌;</p>	40
<p>ならびに、上記の病原体と近縁であるすべての他の属および種。</p>	

【0 2 4 4】

本発明の化合物は、クレブス回路(TCA回路)における重要な酵素、すなわちコハク酸脱水素酵素(SDH)を攪乱することによって複合体II(コハク酸脱水素酵素)真菌性呼吸を阻害することにより、真菌性植物病原体からの保護を提供すると考えられている。SDHは、核にコードされている4種のポリペプチド(SDHA、SDHB、SDHC

およびSDHDとして同定される)により組成される。呼吸が阻害されることで真菌によるATPの形成が妨げられ、それ故、成長および繁殖が阻害される。分子レベルでは、カルボキサミドは、SDH酵素におけるサブユニットSDHB、SDHCおよびSDHDにより形成されるユビキノ結合部位(Q_p部位)に結合することにより、ユビキノ還元を阻害する。Fungicide Resistance Action Committee (FRAC)によって、この殺菌・殺カビ性作用機構を有する化学化合物が、コハク酸脱水素酵素抑制剤に係る略記として「SDHI」として同定されており、FRACコード7に分類されている。

【0245】

現在では、ユビキノ結合部位を形成するサブユニットSDHB、SDHCおよびSDHDにおける多様な突然変異が、SDHIに対する耐性を引き起こすことが知られている。FRACは、ウェブサイト上に「List of fungal species with resistance reports towards SDHI fungicides and mutations in the succinate dehydrogenates gene (updated March 2012)」(<http://frac.info/frac/work/List%20of%20SDHI%20resistant%20species.pdf> (2012年6月28日時点で入手可能))を公表しており、これは、SDHIに対して耐性を示す、人為的な突然変異誘発を介して実験室においてもたらされる突然変異と、圃場において見出される天然突然変異との両方を含む。Scalliet et al., “Mutagenesis and Functional Studies with Succinate Dehydrogenase Inhibitors in the Wheat Pathogen *Mycosphaerella graminicola*”, PLoS ONE, 2012, 7(4), 1-20 (Adobe Acrobatファイル形式で、journal.pone.00035429.pdfとして発行され、2012年6月28日に<http://www.plosone.org/article/info%3Adoi%2F10.1371%2Fjournal.pone.00035429>を介して入手可能である)には、マイコスファエレラグラミニコラ(*Mycosphaerella graminicola*)の追加的な突然変異が記載されている。これらの刊行物には、既知の耐性突然変異を有する真菌性病原体としては、アルテルナリアアルテルナタ(*Alternaria alternata*) (SDHB: H277Y、H277R; SDHC: H134R; SDHD: D123E、H133R)、アスペルギルスオリゼー(*Aspergillus oryzae*) (SDHB: H249Y、H249L、H249N; SDHC: T90I; SDHD: D124E)、ボトリチスシネアレア(*Botrytis cinerea*) (SDHB: P225L、P225T、P225F、H272Y、H272R、H272L、N230I; SDHD: H132R)、ボトリチスエリプチカ(*Botrytis elliptica*) (SDHB: H272Y、H272R)、コリネスボラカッシイコラ(*Corynespora cassiicola*) (SDHB: H287Y、H287R; SDHC: S73P、SDHD: S89P)、ジディメラブリオニアエ(*Didymella bryoniae*) (SDHB: H277R、H277Y)、マイコスファエレラグラミニコラ(*Mycosphaerella graminicola*) (SDHB: S218F、P220T、P220L、S221P、N225H、N225I、R265P、H267L、H267N、H267R、H267Q、H267Y、I269V、N271K; SDHC: T79I、S83G、A84V、A84I、L85P、N86K、R87C、V88D、H145R、H152R; SDHD: D129E、D129G、D129S、D129T、H139E)、ポドスファエラキサントイイ(*Podosphaera xanthii*) (SDHB: H[???]Y)、スクレロティニアスクレロティオルム(*Sclerotinia sclerotiorum*) (SDHD: H132R)、ウスチラゴマイディス(*Ustilago maydis*) (SDHB: H257L)、ステムフィリウムボトリオセ(*Stemph*

10

20

30

40

50

ylum botryose) (SDHB: P225L、H272Y、H272R) およびウスチラゴマイディス (Ustilago maydis) (SDHB: H257L) が挙げられることが開示されており、ここで、左側の英字は一般的な野生種酵素サブユニットにおけるアミノ酸を示し、数字はサブユニットにおけるアミノ酸の位置を特定し、右側の英字は、突然変異サブユニットにおけるアミノ酸を示す (アミノ酸は、標準的な一文字の英字コードによって示されている; 例えば、2012年6月28日にアクセスした <http://www.bio.davidson.edu/Biology/aatable.html> を参照のこと)。セプトリアトリティシ (Septoria tritici) などの他の真菌性病原体の代謝にもコハク酸脱水素酵素が関与するため、これらについても SDHI - 耐性突然変異が可能である。

10

【0246】

特に、本発明の化合物は、他の SDHI に対して高度に耐性である突然変異真菌性病原体に対する十分な活性を保持しており、従って、本化合物は、突然変異病原体、ならびに、野生種病原体に対して植物を保護する農業経済学的な有用性が保持される。SDHI - 耐性真菌性病原体により引き起こされる植物病害に係る他の SDHI 殺菌・殺カビ剤と比した本化合物の向上した効力は、野生種真菌性病原体の代わりに SDHI - 耐性病原体を用いる、例えば本明細書に開示のテスト A ~ E と同様のテストといった単純な植物病害防除テストにより判定可能である。

【0247】

これらの殺菌・殺カビ活性に追加して、組成物または組み合わせもまた、エルウィニア アミロボラ (Erwinia amylovora)、キサントモナスカムペストリス (Xanthomonas campestris)、シュードモナスシリंगाエ (Pseudomonas syringae) および他の関連種などのバクテリアに対して活性を有する。有害な微生物を防除することにより、本発明の化合物は、作物植物もしくはその栄養繁殖体 (例えば、種子、球茎、鱗茎、塊茎、挿木) に接触する、または、作物植物もしくはその栄養繁殖体の農学的環境における有益な微生物対有害な微生物の比を改善 (すなわち、増大) させるために有用である。

20

【0248】

本発明の化合物は、すべての植物、植物部位および種子の処理に有用である。植物および種子の変種および栽培品種は、従来の繁殖および育種法により、または、遺伝子操作法により得ることが可能である。遺伝子操作された植物または種子 (遺伝子組換え植物または種子) は、異種遺伝子 (導入遺伝子) が安定して植物または種子のゲノムに組み込まれたものである。植物ゲノムにおける特定の位置により定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子組換えイベントと呼ばれる。

30

【0249】

本発明に従って処理可能である遺伝子操作された植物栽培品種は、1種以上の生物ストレス (線虫、昆虫、ダニ、真菌等などの有害生物) もしくは非生物ストレス (渇水、低温、土壌塩分等) に対して耐性であるもの、または、他の望ましい特徴を有するものを含む。植物は、遺伝子操作されて、例えば、除草剤耐性、昆虫耐性、変性油プロファイルまたは渇水耐性といった形質を示すことが可能である。単一の遺伝子形質転換イベントまたは形質転換イベントの組み合わせを含む有用な遺伝子操作された植物が表2に列挙されている。表2に列挙されている遺伝子修飾に係る追加の情報は、例えば、米国農務省によって管理されている公開データベースから入手可能である。

40

【0250】

表2においては、形質について、以下の略語 T1 ~ T37 が用いられている。「-」は、項目が適用可能ではないことを意味する。

【0251】

【表 3 0】

形質	記載	形質	記載	形質	記載
T1	グリホサート 耐性	T15	耐寒性	T27	高トリプトファン
T2	高ラウリン酸油	T16	イミダゾリノン除草剤耐性	T28	直立葉半矮性
T3	グルホシネート耐性	T17	変性 α -アミラーゼ	T29	半矮性
T4	フィチン酸塩分解	T18	受粉防除	T30	低鉄耐性
T5	オキシニル耐性	T19	2,4-D 耐性	T31	変性油/脂肪酸
T6	病害耐性	T20	リシン増加	T32	HPPD 耐性
T7	昆虫耐性	T21	湯水耐性	T33	高油分
T9	花の変色	T22	熟成/老化の遅延	T34	アリールオキシアルカノエート耐性
T11	ALS 除草剤耐性	T23	産物の変質	T35	メソトリオン耐性
T12	ジカンバ耐性	T24	高セルロース	T36	ニコチンの低減
T13	抗アレルギー性	T25	化エデンブ/炭水化物	T37	産物の変性
T14	塩耐性	T26	昆虫 & 病害耐性。		

10

【 0 2 5 2 】

【表 3 1】

表 2					属	
作物	事象名称	事象コード	形質			
アルファルファ	J101	MON-00101-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)		
アルファルファ	J163	MON-00163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)		
カノーラ*	23-18-17 (事象 18)	CGN-89465-2	T2	te		
カノーラ*	23-198 (事象 23)	CGN-89465-2	T2	te		
カノーラ*	61061	DP-061061-7	T1	gat4621		
カノーラ*	73496	DP-073496-4	T1	gat4621		
カノーラ*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247		10
カノーラ*	GT73 (RT73)	MON-00073-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247		
カノーラ*	HCN10 (Topas 19/2)	-	T3	bar		
カノーラ*	HCN28 (T45)	ACS-BN008-2	T3	pat (syn)		
カノーラ*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BN007-1	T3	bar		
カノーラ*	MON88302	MON-88302-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)		
カノーラ*	MPS961	-	T4	phyA		
カノーラ*	MPS962	-	T4	phyA		
カノーラ*	MPS963	-	T4	phyA		
カノーラ*	MPS964	-	T4	phyA		
カノーラ*	MPS965	-	T4	phyA		20
カノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	T3	bar		
カノーラ*	MS8	ACS-BN005-8	T3	bar		
カノーラ*	OXY-235	ACS-BN011-5	T5	bxn		
カノーラ*	PHY14	-	T3	bar		
カノーラ*	PHY23	-	T3	bar		
カノーラ*	PHY35	-	T3	bar		
カノーラ*	PHY36	-	T3	bar		
カノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	T3	bar		
カノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	T3	bar		
カノーラ*	RF3	ACS-BN003-6	T3	bar		
マメ	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	T6	ac1 (センスおよびアンチセンス)		30
ナス#	EE-1	-	T7	cry1Ac		
カーネーション	11 (7442)	FLO-07442-4	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)		
カーネーション	11363 (1363A)	FLO-11363-1	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		
カーネーション	1226A (11226)	FLO-11226-8	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		
カーネーション	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)		
カーネーション	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)		
カーネーション	123.8.12	FLO-40689-6	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		
カーネーション	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		
カーネーション	1351A (11351)	FLO-11351-7	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		
カーネーション	1400A (11400)	FLO-11400-2	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)		40
カーネーション	15	FLO-00015-2	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)		

【表 3 2】

カーネーション	16	FLO-000016-3	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	4	FLO-000004-9	T8; T9	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	66	FLO-000066-8	T8; T10	surB; acc	
カーネーション	959A (11959)	FLO-11959-3	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	988A (11988)	FLO-11988-7	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	26407	IFD-26497-2	ST8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	25958	IFD-25958-3	T8; T9	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
チコリ	RM3-3	-	T3	bar	10
チコリ	RM3-4	-	T3	bar	
チコリ	RM3-6	-	T3	bar	
綿	19-51a	DD-01951A-7	T11	S4-HrA	
綿	281-24-236	DAS-24236-5	T3; T7	pat (syn); cry1F	
綿	3006-210-23	DAS-21023-5	T3; T7	pat (syn); cry1Ac	
綿	31707	-	T5; T7	bxn; cry1Ac	
綿	31803	-	T5; T7	bxn; cry1Ac	
綿	31807	-	T5; T7	bxn; cry1Ac	
綿	31808	-	T5; T7	bxn; cry1Ac	
綿	42317	-	T5; T7	bxn; cry1Ac	
綿	BNLA-601	-	T7	cry1Ac	20
綿	BXN10211	BXN10211-9	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10215	BXN10215-4	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10222	BXN10222-2	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10224	BXN10224-4	T5	bxn; cry1Ac	
綿	COT102	SYN-IR102-7	T7	vip3A(a)	
綿	COT67B	SYN-IR67B-1	T7	cry1Ab	
綿	COT202	-	T7	vip3A	
綿	事象 1	-	T7	cry1Ac	
綿	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	T7	cry1Ab-Ac	
綿	GHB119	BCS-GH005-8	T7	cry2Ae	30
綿	GHB614	BCS-GH002-5	T1	2mepsps	
綿	GK12	-	T7	cry1Ab-Ac	
綿	LLCotton25	ACS-GH001-3	T3	bar	
綿	MLS 9124	-	T7	cry1C	
綿	MON1076	MON-89924-2	T7	cry1Ac	
綿	MON1445	MON-01445-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	MON15985	MON-15985-7	T7	cry1Ac; cry2Ab2	
綿	MON1698	MON-89383-1	T7	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	MON531	MON-00531-6	T7	cry1Ac	
綿	MON757	MON-00757-7	T7	cry1Ac	
綿	MON88913	MON-88913-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	40
綿	Nqwe Chi 6 Bt	-	T7	-	

【表 3 3】

綿	SKG321	-	T7	cry1A; CpTI	
綿	T303-3	BCS-GH003-6	T7; T3	cry1Ab; bar	
綿	T304-40	BCS-GH004-7	T7; T3	cry1Ab; bar	
綿	CE43-67B	-	T7	cry1Ab	
綿	CE46-02A	-	T7	cry1Ab	
綿	CE44-69D	-	T7	cry1Ab	
綿	1143-14A	-	T7	cry1Ab	
綿	1143-51B	-	T7	cry1Ab	
綿	T342-142	-	T7	cry1Ab	10
綿	PV-GHGT07 (1445)	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	EE-GH3	-	T1	mepsps	
綿	EE-GH5	-	T7	cry1Ab	
綿	MON88701	MON-88701-3	T12; T3	変性 dmo; bar	
綿	OsCr11	-	T13	変性 Cry j	
コヌカグサ	ASR368	SMG-36800-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ユーカリ属	20-C	-	T14	codA	
ユーカリ属	12-5C	-	T14	codA	
ユーカリ属	12-5B	-	T14	codA	
ユーカリ属	107-1	-	T14	codA	20
ユーカリ属	1/9/2001	-	T14	codA	
ユーカリ属	2/1/2001	-	T14	codA	
ユーカリ属		-	T15	des9	
亜麻	FP967	CDC-FL001-2	T11	als	
レンチル	RH44	-	T16	als	
トウモロコシ	3272	SYN-E3272-5	T17	amy797E	
トウモロコシ	5307	SYN-05307-1	T7	ecry3.1Ab	
トウモロコシ	59122	DAS-59122-7	T7; T3	cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	676	PH-000676-7	T3; T18	pat; dam	
トウモロコシ	678	PH-000678-9	T3; T18	pat; dam	30
トウモロコシ	680	PH-000680-2	T3; T18	pat; dam	
トウモロコシ	98140	DP-098140-6	T1; T11	gat4621; zm-hra	
トウモロコシ	Bt10	-	T7; T3	cry1Ab; pat	
トウモロコシ	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	T7; T3	cry1Ab; bar	
トウモロコシ	BVLA430101	-	T4	phyA2	
トウモロコシ	CBH-351	ACS-ZM004-3	T7; T3	cry9C; bar	
トウモロコシ	DAS40278-9	DAS40278-9	T19	aad-1	
トウモロコシ	DBT418	DKB-89614-9	T7; T3	cry1Ac; pinII; bar	
トウモロコシ	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	T3	bar	
トウモロコシ	GA21	MON-00021-9	T1	mepsps	
トウモロコシ	GG25	-	T1	mepsps	40

【表 3 4】

トウモロコシ	GJ11	-	T1	mepsps	
トウモロコシ	FI117	-	T1	mepsps	
トウモロコシ	GAT-ZM1	-	T3	pat	
トウモロコシ	LY038	REN-00038-3	T20	cordapA	
トウモロコシ	MIR162	SYN-IR162-4	T7	vip3Aa20	
トウモロコシ	MIR604	SYN-IR604-5	T7	mcry3A	
トウモロコシ	MON801 (MON80100)	MON801	T7; T1	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON802	MON-80200-7	T7; T1	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	10
トウモロコシ	MON809	PH-MON-809-2	T7; T1	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON810	MON-00810-6	T7; T1	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON832	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON863	MON-00863-5	T7	cry3Bb1	
トウモロコシ	MON87427	MON-87427-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON87460	MON-87460-4	T21	cspB	
トウモロコシ	MON88017	MON-88017-3	T7; T1	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON89034	MON-89034-3	T7	cry2Ab2; cry1A.105	20
トウモロコシ	MS3	ACS-ZM001-9	T3; T18	bar; bar-se	
トウモロコシ	MS6	ACS-ZM005-4	T3; T18	bar; bar-se	
トウモロコシ	NK603	MON-00603-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	T14	ACS-ZM002-1	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	T25	ACS-ZM003-2	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	TC1507	DAS-01507-1	T7; T3	cry1Fa2; pat	
トウモロコシ	TC6275	DAS-06275-8	T7; T3	mocry1F; bar	
トウモロコシ	VIP1034		T7; T3	vip3A; pat	
トウモロコシ	43A47	DP-043A47-3	T7; T3	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	40416	DP-040416-8	T7; T3	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	30
トウモロコシ	32316	DP-032316-8	T7; T3	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	4114	DP-004114-3	T7; T3	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
メロン	メロン A	-	T22	sam-k	
メロン	メロン B	-	T22	sam-k	
パパイヤ	55-1	CUH-CP551-8	T6	prsv cp	
パパイヤ	63-1	CUH-CP631-7	T6	prsv cp	
パパイヤ	Huanong No. 1	-	T6	prsv rep	
パパイヤ	X17-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp	
ペチュニア	ペチュニア-CHS	-	T25	CHS 抑制	
セイヨウスモモ	C-5	ARS-PLMC5-6	T6	ppv cp	
カノーラ**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	40
カノーラ**	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
カノーラ**	ZSR503	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
ポプラ	Bt ポプラ	-	T7	cry1Ac; API	

【表 3 5】

ポブラ	ハイブリッドポブラクロ ーン 741	-	T7	cry1Ac; API	
ポブラ	trg300-1	-	T24	AaXEG2	
ポブラ	trg300-2	-	T24	AaXEG2	
ジャガイモ	1210 amk	-	T7	cry3A	
ジャガイモ	2904/1kgs	-	T7	cry3A	
カノーラ**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
カノーラ**	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
ジャガイモ	ATBT04-27	NMK-89367-8	T7	cry3A	10
ジャガイモ	ATBT04-30	NMK-89613-2	T7	cry3A	
ジャガイモ	ATBT04-31	NMK-89170-9	T7	cry3A	
ジャガイモ	ATBT04-36	NMK-89279-1	T7	cry3A	
ジャガイモ	ATBT04-6	NMK-89761-6	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT06	NMK-89812-3	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT10	NMK-89175-5	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT12	NMK-89601-8	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT16	NMK-89167-6	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT17	NMK-89593-9	T7	cry3A	
ジャガイモ	BT18	NMK-89906-7	T7	cry3A	20
ジャガイモ	BT23	NMK-89675-1	T7	cry3A	
ジャガイモ	EH92-527-1	BPS-25271-9	T25	gbss (アンチセンス)	
ジャガイモ	HLMT15-15	-	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	HLMT15-3	-	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	HLMT15-46	-	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	RBMT15-101	NMK-89653-6	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	RBMT21-129	NMK-89684-1	T7; T6	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT21-152	-	T7; T6	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT21-350	NMK-89185-6	T7; T6	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT22-082	NMK-89896-6	T7; T6.; T1	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	30
ジャガイモ	RBMT22-186	-	T7; T6.; T1	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	RBMT22-238	-	T7; T6.; T1	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	RBMT22-262	-	T7; T6.; T1	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	SEMT15-02	NMK-89935-9	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	SEMT15-07	-	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	SEMT15-15	NMK-89930-4	T7; T6	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	SPBT02-5	NMK-89576-1	T7	cry3A	
ジャガイモ	SPBT02-7	NMK-89724-5	T7	cry3A	40
イネ	7Cp#242-95-7	-	T13	7crp	
イネ	7Cp#10	-	T13	7crp	
イネ	GM Shanyou 63	-	T7	cry1Ab; cry1Ac	

【表 3 6】

イネ	Huahui-1/TT51-1	-	T7	cry1Ab; cry1Ac	
イネ	LLRICE06	ACS-OS001-4	T3	bar	
イネ	LLRICE601	BCS-OS003-7	T3	bar	
イネ	LLRICE62	ACS-OS002-5	T3	bar	
イネ	Tarom molaii + cry1Ab	-	T7	cry1Ab (切断型)	
イネ	GAT-OS2	-	T3	bar	
イネ	GAT-OS3	-	T3	bar	
イネ	PE-7	-	T7	Cry1Ac	10
イネ	7Cp#10	-	T13	7crp	
イネ	KPD627-8	-	T27	OASA1D	
イネ	KPD722-4	-	T27	OASA1D	
イネ	KA317	-	T27	OASA1D	
イネ	HW5	-	T27	OASA1D	
イネ	HW1	-	T27	OASA1D	
イネ	B-4-1-18	-	T28	Δ OsBRI1	
イネ	G-3-3-22	-	T29	OSGA2ox1	
イネ	AD77	-	T6	DEF	
イネ	AD51	-	T6	DEF	20
イネ	AD48	-	T6	DEF	
イネ	AD41	-	T6	DEF	
イネ	13p-s-atAprt1	-	T30	Hv-S1; Hv-AT-A; APRT	
イネ	13pAprt1	-	T30	APRT	
イネ	gHv-S1-gHv-AT-1	-	T30	Hv-S1; Hv-AT-A; Hv-AT-B	
イネ	gHvIDS3-1	-	T30	HvIDS3	
イネ	gHv-AT1	-	T30	Hv-AT-A; Hv-AT-B	
イネ	gHv-S1-1	-	T30	Hv-S1	
イネ	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS005-3	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS004-2	-	T6	WRKY45	30
イネ	NIA-OS003-1	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS002-9	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS001-8	-	T6	WRKY45	
イネ	OsCr11	-	T13	変性 ed Cry j	
イネ	17053	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
イネ	17314	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
バラ	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)	
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)	
ダイズ	260-05 (G94-1、 G94-19、 G168)	-	T9	gm-fad2-1 (座位のサイレンシング)	
ダイズ	A2704-12	ACS-GM005-3	T3	pat	40
ダイズ	A2704-21	ACS-GM004-2	T3	pat	

【表 3 7】

ダイズ	A5547-127	ACS-GM006-4	T3	pat	
ダイズ	A5547-35	ACS-GM008-6	T3	pat	
ダイズ	CV127	BPS-CV127-9	T16	csr1-2	
ダイズ	DAS68416-4	DAS68416-4	T3	pat	
ダイズ	DP305423	DP-305423-1	T31; T11	gm-fad2-1 (座位のサイレンシング); gm-hra	
ダイズ	DP356043	DP-356043-5	T31; T1	gm-fad2-1 (座位のサイレンシング); gat4601	
ダイズ	FG72	MST-FG072-3	T1; T32	2mepsps; hppdPF W336	10
ダイズ	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	GU262	ACS-GM003-1	T3	pat	
ダイズ	MON87701	MON-87701-2	T7	cry1Ac	
ダイズ	MON87705	MON-87705-6	T31; T1	fatb1-A (センス&アンチセンス); fad2-1A (センス&アンチセンス); cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON87708	MON-87708-9	T12; T1	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON87769	MON-87769-7	T31; T1	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON89788	MON-89788-1	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	20
ダイズ	W62	ACS-GM002-9	T3	bar	
ダイズ	W98	ACS-GM001-8	T3	bar	
ダイズ	MON87754	MON-87754-1	T33	dgat2A	
ダイズ	DAS21606	DAS-21606	T34; T3	変性 aad-12; pat	
ダイズ	DAS44406	DAS-44406-6	T34; T1; T3	変性 aad-12; 2mepsps; pat	
ダイズ	SYHT04R	SYN-0004R-8	T35	変性 avhppd	
ダイズ	9582.814.19.1		T7; T3	cry1Ac; cry1F; pat	
カボチャ	CZW3	SEM-0CZW3-2	T6	cmv cp; zymv cp; wmv cp	
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	zymv cp、 wmv cp	
サトウダイコン	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
サトウダイコン	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	30
サトウダイコン	T120-7	ACS-BV001-3	T3	pat	
サトウダイコン	T227-1	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウキビ	NXL-1T	-	T21	EcbetA	
ヒマワリ	X81359	-	T16	als	
シシトウガラシ	PK-SP01	-	T6	cmv cp	
タバコ	C/F/93/08-02	-	T5	bxn	
タバコ	ベクター 21-41	-	T36	NtQPT1 (アンチセンス)	
トマト	1345-4	-	T22	acc (切断型)	
トマト	35-1-N	-	T22	sam-k	
トマト	5345	-	T7	cry1Ac	40
トマト	8338	CGN-89322-3	T22	accd	
トマト	B	SYN-0000B-6	T22	pg (センスまたはアンチセンス)	
トマト	Da	SYN-0000DA-9	T22	pg (センスまたはアンチセンス)	

【表 3 8】

ヒマワリ	X81359	-	T16	als
トマト	Da Dong No 9	-	T37	-
トマト	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	T22	pg (センスまたはアンチセンス)
トマト	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	T22	pg (センスまたはアンチセンス)
トマト	Huafan No 1	-	T22	anti-efe
トマト	PK-TM8805R (8805R)	-	T6	cmv cp
コムギ	MON71800	MON-71800-3	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)

* アルゼンチン産、** ポーランド産、# ナス

10

【0260】

本発明の化合物による遺伝子操作された植物および種子の処理により、超相加的または相乗的な効果がもたらされ得る。例えば、施用量の低減、活性スペクトルの拡大、ストレス/非生物ストレスに対する耐性の増加、または、保管安定性の増加が、遺伝子操作された植物および種子に本発明の化合物を適用した場合における単純な相加的効果から予期されるものを超える可能性がある。

【0261】

本発明の化合物はまた、種子を植物病害から保護するための種子処理において有用である。本開示および特許請求の範囲の文脈において、種子の処理とは、種子を、典型的には本発明の組成物として配合された本発明の化合物と生物学的に有効な量で接触させることを意味する。この種子処理により種子が土壌伝播性病害病原体から保護され、一般に、発芽種子から発生する実生の土壌と接触している根および他の植物部位をも保護することが可能である。種子処理はまた、発生する植物における本発明の化合物または第2の活性処方成分の転流による群葉の保護をももたらし得る。

20

種子処理は、遺伝的に形質転換されて特殊な形質を発現する植物が発芽するものを含むすべてのタイプの種子に適用可能である。代表例としては、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) トキシンなどの無脊椎有害生物に有害なタンパク質を発現するもの、または、グリホサートに対する耐性をもたらしグリホサートアセチルトランスフェラーゼなどの除草抵抗性を発現するものが挙げられる。本発明の化合物による種子処理はまた、種子から生育する植物の活力を高めることが可能である。

30

【0262】

本発明の化合物およびその組成物は、共に単独で、および、他の殺菌・殺力ビ剤、殺線虫剤および殺虫剤との組み合わせで、特にこれらに限定されないが、トウモロコシまたはコーン、ダイズ、綿、穀類（例えば、コムギ、カラスムギ、オオムギ、ライ麦およびイネ）、ジャガイモ、野菜およびアブラナを含む作物に対する種子処理において特に有用である。

【0263】

さらに、本発明の化合物は、真菌およびバクテリアにより引き起こされる果実および野菜の収穫後病害の処置において有用である。これらの感染は、収穫中、および、その前後に生じる可能性がある。例えば、感染は、収穫の前に生じ、次いで、成熟中のある時点まで休眠し続ける可能性があり（例えば、宿主が感染が進行可能であるように組織変化し始める）；また、感染は、機械的に、または、昆虫被害により生じた表面の傷から発生する可能性がある。この点において、本発明の化合物は、収穫後消費されるまでの間いつでも発生し得る収穫後病害に起因する損失（すなわち、量および品質面からもたらされる損失）を低減させることが可能である。本発明の化合物による収穫後病害の処置により、収穫後に、傷みやすい可食性の植物部位（例えば、果実、種子、群葉、茎、鱗茎、塊茎）を冷蔵保管し、または、冷蔵せずに保管することが可能な期間であって、可食状態が維持されると共に、真菌もしくは他の微生物による明らかなもしくは有害な品質の低下、または、

40

50

真菌もしくは他の微生物による汚染が伴わない期間を延長することが可能である。収穫前もしくは収穫後における、本発明の化合物による可食性の植物部位の処理はまた、例えばアフラトキシンなどのマイコトキシンといった、真菌または他の微生物による有害な代謝産物の形成を低減させることが可能である。

【0264】

植物病害防除は、有効量の本発明の化合物を、感染前もしくは感染後に、根、茎、群葉、果実、種子、塊茎もしくは鱗茎などの保護されるべき植物の一部分、または、保護されるべき植物が成長している培地（土壌または砂）に適用することにより通常達成される。種子および種子から発育する実生を保護するために化合物を種子に適用することも可能である。化合物はまた、植物を処理するために灌漑水を介して適用することが可能である。収穫前に産物に感染する収穫後病原体の防除は、典型的には、本発明の化合物の圃場適用により達成され、感染が収穫後に生じる場合においては、化合物は、収穫された作物に、浸漬、噴霧、燻蒸、処理されたラップおよび箱のライナーとして適用されることが可能である。

10

【0265】

これらの化合物の適用量（すなわち殺菌・殺力比的に有効な量）は、防除されるべき植物病害、保護されるべき植物種、周囲水分量および温度などの要因によって影響される可能性があり、実際の使用条件下で判定されるべきである。当業者は、植物病害の防除に係る所望のレベルに必要とされる殺菌・殺力比的に有効な量を単純な実験を通して容易に判定することが可能である。群葉は通常、約 1 g / ha 未満～約 5,000 g / ha の量の活性処方成分で処理された場合に保護可能である。種子および実生は通常、種子が、種子 1 キログラム当たり、約 0.001 g（より典型的には、約 0.1 g）～約 10 g の量で処理された場合に保護可能である。

20

【0266】

本発明の化合物はまた、殺菌・殺力比剤、殺虫剤、抗線虫薬、殺菌剤、殺ダニ剤、除草剤、除草剤毒性緩和剤、昆虫脱皮阻害剤および発根刺激剤などの成長調節剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養分、他の生物学的に有効な化合物または昆虫病原性バクテリア、ウイルスまたは真菌を含む他の生物学的に有効な化合物もしくは薬剤の 1 種または複数種と混合されて多成分有害生物防除剤を形成して、さらに広範囲の農学的保護をもたらすことが可能である。それ故、本発明はまた、式 1 の化合物（殺菌・殺力比的に有効な量）と、少なくとも 1 種の追加の生物学的に有効な化合物または薬剤（生物学的に有効な量）とを含む組成物に関し、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも 1 種をさらに含んでいることが可能である。他の生物学的に有効な化合物もしくは薬剤は、界面活性剤、固体または液体希釈剤の少なくとも 1 種を含む組成物中で配合されることが可能である。本発明の混合物に関して、1 種もしくは複数種の他の生物学的に有効な化合物もしくは薬剤は、式 1 の化合物と一緒に配合されて予混合物が形成可能であり、または、1 種もしくは複数種の他の生物学的に有効な化合物もしくは薬剤は式 1 の化合物から個別に配合され、配合物を、適用前に（例えば、噴霧タンク中で）一緒に組み合わせること、または、あるいは、逐次的に適用することが可能である。

30

40

【0267】

発明の概要において記載のとおり、本発明の一態様は、式 1 の化合物、その N - オキシドまたは塩（すなわち、コンポーネント）と、少なくとも 1 種の他の殺菌・殺力比剤（すなわち、コンポーネント b）とを含む殺菌・殺力比組成物である（すなわち、混合物またはその組み合わせ）。注目すべきは、他の殺菌・殺力比性活性処方成分が式 1 の化合物とは異なる作用部位を有するような組み合わせである。一定の事例において、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 種の他の殺菌・殺力比性活性処方成分との組み合わせが耐性管理に関して特に有利であろう。それ故、本発明の組成物はさらに、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 種の追加の殺菌・殺力比性活性処方成分を殺菌・殺力比的に有効な量で含んでいることが可能である。

50

【 0 2 6 8 】

コンポーネント (a) の式 1 の化合物に追加して、コンポーネント (b) として、F R A C により定義されている作用機構 (M O A) クラス (A) 核酸合成、(B) 有糸分裂および細胞分裂、(C) 呼吸、(D) アミノ酸およびタンパク質合成、(E) シグナル伝達、(F) 脂質合成および膜統合性、(G) 膜におけるステロール生合成、(H) 膜における細胞壁生合成、(I) 細胞壁におけるメラニン合成、(P) 宿主植物の抵抗性誘導、多部位接触活性、ならびに、不明な作用形態からなる群から選択される少なくとも 1 種の殺菌・殺力ビ性化合物を含む組成物に注目すべきである。

【 0 2 6 9 】

F R A C により承認または提言されている標的作用部位は、上記の M O A クラスに属するその F R A C 標的部位コードに加えて、(A 1) R N A ポリメラーゼ I、(A 2) アデノシンデアミナーゼ、(A 3) D N A / R N A 合成 (提言されている)、(A 4) D N A トポイソメラーゼ、(B 1 ~ B 3) 有糸分裂における - チュープリンアセンブリ、(B 4) 細胞分裂 (提言されている)、(B 5) スペクトリン様タンパク質の非局在化、(C 1) 複合体 I N A D H オキシド - レダクターゼ、(C 2) 複合体 I I : コハク酸脱水素酵素、(C 3) Q o 部位における複合体 I I I : チトクロム b c 1 (ユビキノールオキシダーゼ)、(C 4) Q i 部位における複合体 I I I : チトクロム b c 1 (ユビキノンレダクターゼ)、(C 5) 酸化性リン酸化の脱共役剤、(C 6) 酸化性リン酸化の抑制剤、A T P シンターゼ、(C 7) A T P 産生 (提言されている)、(C 8) Q x (未知) 部位における複合体 I I I : チトクロム b c 1 (ユビキノンレダクターゼ)、(D 1) メチオニン生合成 (提言されている)、(D 2 ~ D 5) タンパク質合成、(E 1) シグナル伝達 (未知のメカニズム)、(E 2 ~ E 3 浸透圧シグナル伝達における M A P / ヒスチジンキナーゼ、(F 2) リン脂質生合成、メチルトランスフェラーゼ、(F 3) 脂質過酸化 (提言されている)、(F 4) 細胞膜浸透性、脂肪酸 (提言されている)、(F 6) 病原体細胞膜の微生物性攪乱物質、(F 7) 細胞膜攪乱 (提言されている)、(G 1) ステロール生合成における C 1 4 - デメチラーゼ、(G 2) ステロール生合成における 1 4 - レダクターゼおよび 8 7 - イソメラーゼ、(G 3) 3 - ケトレダクターゼ、C 4 - 脱メチル化、(G 4) ステロール生合成におけるスクアレンエポキシダーゼ、(H 3) トレハラールゼおよびイノシトール生合成、(H 4) キチンシンターゼ、(H 5) セルロースシンターゼ、(I 1) メラニン生合成におけるレダクターゼ、ならびに、(I 2) メラニン生合成におけるデヒドラターゼである。

【 0 2 7 0 】

特に注目すべきは、コンポーネント (a) の式 1 の化合物に追加して、コンポーネント (b) として、クラス (b 1) メチルベンズイミダゾールカルバメート (M B C) 殺菌・殺力ビ剤；(b 2) ジカルボキシイミド殺菌・殺力ビ剤；(b 3) 脱メチル化抑制剤 (D M I) 殺菌・殺力ビ剤；(b 4) フェニルアミド殺菌・殺力ビ剤；(b 5) アミンノホルリン殺菌・殺力ビ剤；(b 6) リン脂質生合成抑制剤殺菌・殺力ビ剤；(b 7) コハク酸脱水素酵素抑制剤殺菌・殺力ビ剤；(b 8) ヒドロキシ (2 - アミノ -) ピリミジン殺菌・殺力ビ剤；(b 9) アニリノピリミジン殺菌・殺力ビ剤；(b 1 0) N - フェニルカルバメート殺菌・殺力ビ剤；(b 1 1) キノン外部抑制剤 (Q o I) 殺菌・殺力ビ剤；(b 1 2) フェニルピロール殺菌・殺力ビ剤；(b 1 3) アザナフタレン殺菌・殺力ビ剤；(b 1 4) 脂質過酸化抑制剤殺菌・殺力ビ剤；(b 1 5) メラニン生合成抑制剤 - レダクターゼ (M B I - R) 殺菌・殺力ビ剤；(b 1 6) メラニン生合成抑制剤 - デヒドラターゼ (M B I - D) 殺菌・殺力ビ剤；(b 1 7) ステロール生合成抑制剤 (S B I) : クラス I I I 殺菌・殺力ビ剤；(b 1 8) スクアレン - エポキシダーゼ抑制剤殺菌・殺力ビ剤；(b 1 9) ポリオキシシン殺菌・殺力ビ剤；(b 2 0) フェニル尿素殺菌・殺力ビ剤；(b 2 1) キノン内部抑制剤 (Q i I) 殺菌・殺力ビ剤；(b 2 2) ベンズアミドおよびチアゾールカルボキサミド殺菌・殺力ビ剤；(b 2 3) エノピラヌロン酸抗生物質殺菌・殺力ビ剤；(b 2 4) ヘキソピラノシル抗生物質殺菌・殺力ビ剤；(b 2 5) グルコピラノシル抗生物質：タンパク質合成殺菌・殺力ビ剤；(b 2 6) グルコピラノシル抗生物質：

トレハラーゼおよびイノシトール生合成殺菌・殺カビ剤；(b 2 7) シアノアセタミドオキシム殺菌・殺カビ剤；(b 2 8) カルバメート殺菌・殺カビ剤；(b 2 9) 酸化性リン酸化脱共役殺菌・殺カビ剤；(b 3 0) 有機錫殺菌・殺カビ剤；(b 3 1) カルボン酸殺菌・殺カビ剤；(b 3 2) 芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤；(b 3 3) ホスホネート殺菌・殺カビ剤；(b 3 4) フタルアミド酸殺菌・殺カビ剤；(b 3 5) ベンゾトリアジン殺菌・殺カビ剤；(b 3 6) ベンゼン - スルホンアミド殺菌・殺カビ剤；(b 3 7) ピリダジノン殺菌・殺カビ剤；(b 3 8) チオフェン - カルボキサミド殺菌・殺カビ剤；(b 3 9) 複合体 I N A D H オキシドレダクターゼ抑制剤殺菌・殺カビ剤；(b 4 0) カルボン酸アミド (C A A) 殺菌・殺カビ剤；(b 4 1) テトラサイクリン抗生物質殺菌・殺カビ剤；(b 4 2) チオカルバメート殺菌・殺カビ剤；(b 4 3) ベンズアミド殺菌・殺カビ剤；(b 4 4) 微生物性殺菌・殺カビ剤；(b 4 5) Q_x I 殺菌・殺カビ剤；(b 4 6) 植物抽出物殺菌・殺カビ剤；(b 4 7) 宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤；(b 4 8) 多部位接触作用殺菌・殺カビ剤；(b 4 9) クラス (b 1) ~ (b 4 8) の殺菌・殺カビ剤以外の殺菌・殺カビ剤；および、クラス (b 1) ~ (b 4 8) の化合物の塩を含む組成物である。

【0 2 7 1】

殺菌・殺カビ性化合物のこれらのクラスのさらなる説明を以下に記載する。

【0 2 7 2】

(b 1) 「メチルベンズイミダゾールカルバメート (M B C) 殺菌・殺カビ剤」(F R A C コード 1) は、微小管会合の最中に - チュープリンに結合することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。メチルベンズイミダゾールカルバメート殺菌・殺カビ剤としては、ベンズイミダゾールおよびチオファネート殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ベンズイミダゾールとしては、ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾールおよびチアベンダゾールが挙げられる。チオファネートとしては、チオファネートおよびチオファネート - メチルが挙げられる。

【0 2 7 3】

(b 2) 「ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤」(F R A C コード 2) は、浸透圧シグナル伝達における M A P / ヒスチジンキナーゼを阻害する。例としては、クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドンおよびピンクロゾリンが挙げられる。

【0 2 7 4】

「脱メチル化抑制剤 (D M I) 殺菌・殺カビ剤」(F R A C コード 3) (ステロール生合成抑制剤 (S B I) : クラス I) ステロール産生に關与する C 1 4 - デメチラーゼを阻害する。エルゴステロールなどのステロールが膜構造および機能に必要とされており、これらは、機能性細胞壁の発達のために必須とされている。従って、これらの殺菌・殺カビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的に死滅をもたらす。D M I 殺菌・殺カビ剤は数々の化学分類に分類されている：アゾール (トリアゾールおよびイミダゾールを含む)、ピリミジン、ピペラジン、ピリジンおよびトリアゾリンチオン。トリアゾールとしては、アザコナゾール、ピテルタノール、フロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール (ジニコナゾール - M を含む)、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、キンコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウニコナゾール - P、 - (1 - クロロシクロプロピル) - [2 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル) エチル] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、r e l - 1 - [[(2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] メチル] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、r e l - 2 - [[(2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] - メチル] - 1, 2 - ジヒド

10

20

30

40

50

ロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、および、rel - 1 - [[(2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] メチル] - 5 - (2 - プロペン - 1 - イルチオ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾールが挙げられる。イミダゾールとしては、エコナゾール、イマザリル、オキスポコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエートおよびトリフルミゾールが挙げられる。ピリミジンとしては、フェナリモル、ヌアリモルおよびトリアリモルが挙げられる。ピペラジンとしては、トリホリンが挙げられる。ピリジンとしては、ブチオベート、ピリフェノックス、ピリゾキサゾール (3 - [(3 R) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - 3 - イソキサゾリジニル] ピリジン、3 R , 5 R - および 3 R , 5 S - 異性体) の混合物、ならびに、(S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 4 - イソオキサゾリル] - 3 - ピリジンメタノールが挙げられる。トリアゾリンチオンとしては、プロチオコナゾールおよび 2 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - (2 , 2 - ジクロロシクロプロピル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオンが挙げられる。生化学的研究によって、K . H . Kuck et al . in Modern Selective Fungicides - Properties , Applications and Mechanisms of Action , H . Lyr (Ed .) , Gustav Fischer Verlag : New York , 1995 , 205 - 258 に記載されているとおり、上記の殺菌・殺力ビ剤のすべてがDMI殺菌・殺力ビ剤であることが示されている。

10

20

【0275】

(b 4) 「フェニルアミド殺菌・殺力ビ剤」(F R A C コード 4) は、卵菌真菌におけるRNAポリメラーゼの特異的抑制剤である。これらの殺菌・殺力ビ剤に露出された感受性の真菌は、rRNAへのウリジンの組み込み能の低下を示す。感受性の真菌における成長および発生は、このクラスの殺菌・殺力ビ剤に対する露出により妨げられる。フェニルアミド殺菌・殺力ビ剤としては、アシルアラニン、オキサゾリジノンおよびブチロラクトン殺菌・殺力ビ剤が挙げられる。アシルアラニンとしては、ペナラキシル、ペナラキシル - M (キララクシルとしても公知である) 、フララキシル、メタラキシルおよびメタラキシル - M (メフェノキサムとしても公知である) が挙げられる。オキサゾリジノンとしてはオキサジキシルが挙げられる。ブチロラクトンとしてはオフレースが挙げられる。

30

【0276】

(b 5) 「アミン/モルホリン殺菌・殺力ビ剤」(F R A C コード 5) (S B I : クラス II) は、ステロール生合成経路、⁸ ⁷ イソメラーゼおよび ¹ ⁴ レダクターゼにおける2つの標的部位を阻害する。エルゴステロールなどのステロールが膜構造および機能に必要とされており、これらは、機能性細胞壁の発達のために必須とされている。従って、これらの殺菌・殺力ビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的に死滅をもたらす。アミン/モルホリン殺菌・殺力ビ剤 (非DMIステロール生合成抑制剤としても知られる) としては、モルホリン、ペペリジンおよびスピロケタール - アミン殺菌・殺力ビ剤が挙げられる。モルホリンとしては、アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフおよびトリモルファミドが挙げられる。ペペリジンとしてはフェンプロピジンおよびピペラリンが挙げられる。スピロケタール - アミンとしてはスピロキサミンが挙げられる。

40

【0277】

(b 6) 「リン脂質生合成抑制剤殺菌・殺力ビ剤」(F R A C コード 6) は、リン脂質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。リン脂質生合成殺菌・殺力ビ剤としては、ホスホロチオレートおよびジチオラン殺菌・殺力ビ剤が挙げられる。ホスホロチオレートとしては、エディフェンホス、イプロベンホスおよびピラゾホスが挙げられる。ジチオランとしてはイソプロチオランが挙げられる。

【0278】

(b 7) 「コハク酸脱水素酵素抑制剤 (S D H I) 殺菌・殺力ビ剤」(F R A C コード

50

7) は、クレブス回路 (TCA 回路) における重要な酵素、すなわちコハク酸脱水素酵素を攪乱することにより複合体 I I 真菌性呼吸を阻害する。呼吸が阻害されることで真菌による ATP の形成が妨げられ、それ故、成長および繁殖が阻害される。SDHI 殺菌・殺カビ剤としては、フェニルベンズアミド、フランカルボキサミド、オキサチンカルボキサミド、チアゾールカルボキサミド、ピラゾール - 4 - カルボキサミド、ピリジンカルボキサミド、フェニルオキシエチルチオフエンアミドおよびピリジニルエチルベンズアミドが挙げられる。ベンズアミドとしては、ベノダニル、フルトラニルおよびメプロニルが挙げられる。フランカルボキサミドとしては、フェンフラムが挙げられる。オキサチンカルボキサミドとしては、カルボキシシンおよびオキシカルボキシシンが挙げられる。チアゾールカルボキサミドとしては、チフルザミドが挙げられる。ピラゾール - 4 - カルボキサミドとしては、ベンゾピンジフルピル (N - [9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、ピキサフェン、フルキサピロキサド (3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (3', 4', 5' - トリフルオロ [1, 1' - ビフェニル] - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、フラメトピル、イソピラザム (3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 9 - (1 - メチルエチル) - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、ペンフルフェン (N - [2 - (1, 3 - ジメチル - プチル) フェニル] - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、ペンチオピラド、セダキサン (N - [2 - [1, 1' - ビシクロプロピル] - 2 - イルフェニル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、N - [2 - (1 S, 2 R) - [1, 1' - ビシクロプロピル] - 2 - イルフェニル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - [2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチルエチル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドおよび N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [[2 - (1 - メチルエチル) - フェニル] メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドが挙げられる。ピリジンカルボキサミドとしては、ボスカリドが挙げられる。フェニルオキシエチルチオフエンアミドとしては、イソフェタミド (N - [1, 1 - ジメチル - 2 - [2 - メチル - 4 - (1 - メチルエトキシ) フェニル] - 2 - オキシエチル] - 3 - メチル - 2 - チオフエンカルボキサミド) が挙げられる。ピリジニルエチルベンズアミドとしては、フルオピラムが挙げられる。

【0279】

(b8) 「ヒドロキシ (2 - アミノ -) ピリミジン殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード8) はアデノシンデアミナーゼに干渉することにより核酸合成を阻害する。例としては、ブピリメート、ジメチリモールおよびエチリモールが挙げられる。

【0280】

(b9) 「アニリノピリミジン殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード9) は、アミノ酸メチオニン合成を阻害すると共に、感染の最中に植物細胞を溶解する加水分解酵素の分泌を攪乱すると提言されている。例としては、シプロジニル、メバニピリムおよびピリメタニルが挙げられる。

【0281】

(b10) 「N - フェニルカルバメート殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード10) は、
- チュープリンに結合し、微小管会合を攪乱することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。例としては、ジエトフェンカルブが挙げられる。

【0282】

(b11) 「キノン外部抑制剤 (QoI) 殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード11) は

10

20

30

40

50

、ユビキノールオキシダーゼに作用することにより真菌における複合体ⅠⅠⅠミトコンドリア呼吸を阻害する。ユビキノールの酸化は、真菌の内部ミトコンドリア膜内に位置されているチトクロム $b c_1$ 複合体の「キノン外部」(Q_o)部位でブロックされる。ミトコンドリア呼吸が阻害されることにより、正常な真菌増殖および発生が妨げられる。キノン外部抑制剤殺菌・殺カビ剤としては、メトキシアクリレート、メトキシカルバメート、オキシミノアセテート、オキシミノアセタミドおよびジヒドロジオキサジン殺菌・殺カビ剤(総括して、ストロビルリン殺菌・殺カビ剤としても公知である)、およびオキサゾリジンジオン、イミダゾリノンおよびベンジルカルバメート殺菌・殺カビ剤が挙げられる。メトキシアクリレートとしては、アゾキシストロビン、クモキシストロビン(メチル(E)-2-[[(3-ブチル-4-メチル-2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-7-イル)オキシ]メチル]- (メトキシメチレン)ベンゼンアセテート)、エノキサストロビン(メチル(E)-2-[[[(E)-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]アミノ]オキシ]メチル]- (メトキシメチレン)ベンゼンアセテート)(エネストロブリンとしても公知である)、フルフェノキシストロビン(メチル(E)-2-[[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル]- (メトキシメチレン)ベンゼンアセテート)、ピコキシストロビン、およびピラオキシストロビン(メチル(E)-2-[[[3-(4-クロロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル]オキシ]メチル]- (メトキシメチレン)ベンゼンアセテート)が挙げられる。メトキシカルバメートとしては、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン(メチルN-[2-[[(1,4-ジメチル-3-フェニル-1H-ピラゾール-5-イル)オキシ]メチル]フェニル]-N-メトキシカルバメート)およびトリクロピリカルブ(メチルN-メトキシ-N-[2-[[(3,5,6-トリクロロ-2-ピリジニル)オキシ]メチル]フェニル]カルバメート)が挙げられる。オキシミノ酢酸としては、クレソキシム-メチル、およびトリフロキシストロビンが挙げられる。オキシミノアセタミドとしては、ジモキシストロビン、フェナミンストロビン((E)-2-[[[(E)-[(2E)-3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]アミノ]オキシ]メチル]- (メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセタミド)、メトミノストロビン、オリザストロビンおよび-[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[[[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ]-イミノ]-メチル]-ベンゼンアセタミドが挙げられる。ジヒドロジオキサジンとしては、フルオキサストロビンが挙げられる。オキサゾリジンジオンとしては、ファモキサドンが挙げられる。イミダゾリノンとしては、フェンアミドンが挙げられる。ベンジルカルバメートとしては、ピリベンカルブが挙げられる。クラス(b11)はまた、マンデストロビン(2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]- -メトキシ-N-ベンゼンアセトアミド)が挙げられる。

【0283】

(b12)「フェニルピロール殺菌・殺カビ剤」(FRACコード12)は、真菌における浸透圧シグナル伝達系に関連するMAP/ヒスチジンキナーゼを阻害する。フェンビクロニルおよびフルジオキサニルがこの殺菌・殺カビ剤クラスの例である。

【0284】

(b13)「アザナフタレン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード13)は、未知のメカニズムによりシグナル伝達を阻害すると提言されている。これらは、ウドンコ病を引き起こす真菌における発芽および/または付着器形成に干渉するとみられている。アザナフタレン殺菌・殺カビ剤としては、アリアルオキシキノリンおよびキナゾリノンが挙げられる。アリアルオキシキノリンとしては、キノキシフェンが挙げられる。キナゾリノンとしては、プロキナジドが挙げられる。

【0285】

(b14)「脂質過酸化抑制剤殺菌・殺カビ剤」(FRACコード14)は、真菌における膜合成に作用する脂質過酸化を阻害すると提言されている。エトリジアゾールなどのこのクラスの構成要素もまた、呼吸およびメラニン生合成などの他の生物学的プロセスに

作用し得る。脂質過酸化殺菌・殺カビ剤としては、芳香族炭化水素および 1, 2, 4 - チアジアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。芳香族炭化水素殺菌・殺カビ剤としては、ピフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼンおよびトルコホス - メチルが挙げられる。1, 2, 4 - チアジアゾールとしては、エトリジアゾールが挙げられる。

【0286】

(b15) 「メラニン生合成抑制剤 - レダクターゼ (MBI - R) 殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード16.1) は、メラニン生合成におけるナフトレン還元ステップを阻害する。メラニンは、ある種の真菌によって宿主植物感染のために必要とされる。メラニン生合成抑制剤 - レダクターゼ殺菌・殺カビ剤としては、イソベンゾフラノン、ピロロキノリンおよびトリアゾロベンゾチアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。イソベンゾフラノンとしては、フサライドが挙げられる。ピロロキノリンとしては、ピロキロンが挙げられる。トリアゾロベンゾチアゾールとしては、トリシクラゾールが挙げられる。

10

【0287】

(b16) 「メラニン生合成抑制剤 - デヒドラターゼ (MBI - D) 殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード16.2) は、メラニン生合成におけるシタロンデヒドラターゼを阻害する。メラニンは、ある種の真菌によって宿主植物感染のために必要とされる。メラニン生合成抑制剤 - デヒドラターゼ殺菌・殺カビ剤としては、シクロプロパンカルボキサミド、カルボキサミドおよびプロピオンアミド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。シクロプロパンカルボキサミドとしては、カルプロパミドが挙げられる。カルボキサミドとしては、ジクロシメットが挙げられる。プロピオンアミドとしては、フェノキサニルが挙げられる。

20

【0288】

(b17) 「ステロール生合成抑制剤 (SBI) : クラスIII殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード17) は、ステロール産生におけるC4 - 脱メチル化中に3 - ケトレダクターゼを阻害する。SBI : クラスIII抑制剤としては、ヒドロキシアニリド殺菌・殺カビ剤およびアミノピラゾリノン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ヒドロキシアニリドとしては、フェンヘキサミドが挙げられる。アミノピラゾリノンとしては、フェンピラザミン (S - 2 - プロペン - 1 - イル5 - アミノ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 - (1 - メチルエチル) - 4 - (2 - メチルフェニル) - 3 - オキソ - 1H - ピラゾール - 1 - カルボチオエート) が挙げられる。

【0289】

(b18) 「スクアレン - エポキシダーゼ抑制剤殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード18) (SBI : クラスIV) は、ステロール生合成経路におけるスクアレン - エポキシダーゼを阻害する。エルゴステロールなどのステロールは、膜構造および膜機能のために必要であり、機能性細胞壁の発達のために必須とされる。従ってこれらの殺菌・殺カビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的には死滅をもたらす。スクアレン - エポキシダーゼ抑制剤殺菌・殺カビ剤としては、チオカルバメートおよびアリルアミン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。チオカルバメートとしては、ピリプチカルブが挙げられる。アリルアミンとしては、ナフチフィンおよびテルピナフィンが挙げられる。

30

【0290】

(b19) 「ポリオキシシン殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード19) はキチンシンターゼを阻害する。例としては、ポリオキシシンが挙げられる。

40

【0291】

(b20) 「フェニル尿素殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード20) は、細胞分裂に作用すると提言されている。例としては、ペンシクロンが挙げられる。

【0292】

(b21) 「キノン内部抑制剤 (QiI) 殺菌・殺カビ剤」 (FRACコード21) は、ユビキノレダクターゼに作用することにより真菌における複合体IIIミトコンドリア呼吸を阻害する。ユビキノンの還元は、真菌の内部ミトコンドリア膜内に位置されているチトクロムbc₁複合体の「キノン内部」 (Q_i) 部位でブロックされる。ミトコンドリア呼吸が阻害されることにより、正常な真菌増殖および発生が妨げられる。キノン内部

50

抑制剤殺菌・殺カビ剤としては、シアノイミダゾールおよびスルファモイルトリアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。シアノイミダゾールとしては、シアゾファミドが挙げられる。スルファモイルトリアゾールとしては、アミスルプロムが挙げられる。

【0293】

(b22)「ベンズアミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード22)は、 β -チューブリンに結合し、微小管会合を攪乱することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。ベンズアミドとしては、ゾキサミドが挙げられる。チアゾールカルボキサミドとしては、エタボキサムが挙げられる。

【0294】

(b23)「エノピラヌロン酸抗生物質殺菌・殺カビ剤」(FRACコード23)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、プラストサイジン-Sが挙げられる。

【0295】

(b24)「ヘキサピラノシル抗生物質殺菌・殺カビ剤」(FRACコード24)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、カスガマイシンが挙げられる。

【0296】

(b25)「グルコピラノシル抗生物質：タンパク質合成殺菌・殺カビ剤」(FRACコード25)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、ストレプトマイシンが挙げられる。

【0297】

(b26)「グルコピラノシル抗生物質：トレハラーゼおよびイノシトール生合成殺菌・殺カビ剤」(FRACコード26)は、トレハラーゼおよびイノシトール生合成を阻害する。例としては、バリダマイシンが挙げられる。

【0298】

(b27)「シアノアセタミドオキシム殺菌・殺カビ剤」(FRACコード27)としては、シモキサニルが挙げられる。

【0299】

(b28)「カルバメート殺菌・殺カビ剤」(FRACコード28)は、真菌増殖の多部位抑制剤であるとみなされる。これらは、細胞膜における脂肪酸の合成に干渉し、次いで、細胞膜浸透性を攪乱すると提言されている。プロパマカルブ、ヨードカルブおよびプロチオカルブがこの殺菌・殺カビ剤クラスの例である。

【0300】

(b29)「酸化性リン酸化脱共役殺菌・殺カビ剤」(FRACコード29)は、脱共役酸化性リン酸化により真菌の呼吸を阻害する。呼吸が阻害されることにより、正常な真菌の成長および発生が妨げられる。このクラスは、フルアジナムなどの2,6-ジニトロアニリン、ならびに、ジノカップ、メブチルジノカップおよびビナバクリルなどのクロトン酸ジニトロフェニルを含む。

【0301】

(b30)「有機錫殺菌・殺カビ剤」(FRACコード30)は、酸化性リン酸化経路におけるアデノシン三リン酸(ATP)シンターゼを阻害する。例としては、酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズおよびトリフェニルスズヒドロキシドが挙げられる。

【0302】

(b31)「カルボン酸殺菌・殺カビ剤」(FRACコード31)は、デオキシリボ核酸(DNA)トポイソメラーゼタイプII(ギラーゼ)に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、オキシリン酸が挙げられる。

【0303】

(b32)「芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤」(Fungicide Resistance Action Committee (FRAC)コード32)は、DNA/リボ

10

20

30

40

50

核酸 (RNA) 合成に作用すると提言されている。芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤としては、イソキサゾールおよびイソチアゾロンが挙げられる。イソキサゾールとしてはヒメキサゾールが挙げられ、および、イソチアゾロンとしては、オクチリノンが挙げられる。

【0304】

(b33) 「ホスホネート殺菌・殺カビ剤」(FRACコード33)としては、ホセチル-アルミニウムを含む亜リン酸およびその種々の塩が挙げられる。

【0305】

(b34) 「フタルアミド酸殺菌・殺カビ剤」(FRACコード34)としては、テクロフタラムが挙げられる。

【0306】

(b35) 「ベンゾトリアジン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード35)としては、トリアゾキシドが挙げられる。

【0307】

(b36) 「ベンゼン-スルホンアミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード36)としては、フルスルファミドが挙げられる。

【0308】

(b37) 「ピリダジノン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード37)としては、ジクロメジンが挙げられる。

【0309】

(b38) 「チオフェン-カルボキサミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード38)は、ATP産生に作用すると提言されている。例としては、シルチオフアムが挙げられる。

【0310】

(b39) 「複合体I NADHオキシドレダクターゼ抑制剤殺菌・殺カビ剤」(FRACコード39)はミトコンドリアにおける電子伝達を阻害し、ジフルメトリムなどのピリミジンアミン、および、トルフェンピラドなどのピラゾール-5-カルボキサミドを含む。

【0311】

(b40) 「カルボン酸アミド(CAA)殺菌・殺カビ剤」(FRACコード40)は、セルロースシンターゼを阻害して、標的真菌の成長を妨げ、死に至らしめる。カルボン酸アミド殺菌・殺カビ剤は、桂皮酸アミド、バリンアミドおよび他のカルバメート、およびマンデル酸アミド殺菌・殺カビ剤を含む。桂皮酸アミドとしては、ジメトモルフ、フルモルフおよびピリモルフ(3-(2-クロロ-4-ピリジニル)-3-[4-(1,1-ジメチルエチル)フェニル]-1-(4-モルホリニル)-2-プロペン-1-オン)が挙げられる。バリンアミドおよび他のカルバメートとしては、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブ-イソプロピル、イプロバリカルブ、トルプロカルブ(2,2,2-トリフルオロエチルN-[(1S)-2-メチル-1-[[[4-メチルベンゾイル]アミノ]メチル]プロピル]カルバメート)およびバリフェナレート(メチルN-[(1-メチルエトキシ)カルボニル]-L-バリル-3-(4-クロロフェニル)-アラニネート)(バリフェナルとしても公知である)が挙げられる。マンデル酸アミドとしては、マンジプロパミド、N-[2-[4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(メチルスルホニル)-アミノ]-ブタンアミドおよびN-[2-[4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]-エチル]-3-メチル-2-[(エチルスルホニル)アミノ]ブタンアミドが挙げられる。

【0312】

(b41) 「テトラサイクリン抗生物質殺菌・殺カビ剤」(FRACコード41)は、タンパク質合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、オキシテトラサイクリンが挙げられる。

【0313】

(b42) 「チオカルバメート殺菌・殺カビ剤」(FRACコード42)としては、メ

10

20

30

40

50

タスルホカルブが挙げられる。

【0314】

(b43)「ベンズアミド殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード43)は、スペクトリン様タンパク質を非局在化することにより真菌の成長を阻害する。例としては、フルオピコリドなどのピリジニルメチルベンズアミド殺菌・殺カビ剤(現在では、F R A Cコード7、ピリジニルエチルベンズアミド)が挙げられる。

【0315】

(b44)「微生物性殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード44)真菌性病原体細胞膜を破壊する。微生物性殺菌・殺カビ剤としては、パチルスアミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)菌株QST713、FZB24、MB1600、D747などのパチルス(*Bacillus*)種、および、これらが産生する殺菌・殺カビ性リボペプチドが挙げられる。

【0316】

(b45)「Q_xI殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード45)は、チトクロムbc₁複合体の未知の(Q_x)部位でユビキノレダクターゼに作用することにより、真菌における複合体IIIミトコンドリア呼吸を阻害する。ミトコンドリア呼吸を阻害することにより、正常な真菌の成長および発達が妨げられる。Q_xI殺菌・殺カビ剤としては、アメトクトラジン(5-エチル-6-オクチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-アミン)などのトリアゾロピリミジリアミンが挙げられる。

【0317】

(b46)「植物抽出物殺菌・殺カビ剤」は、細胞膜を攪乱することにより作用すると提言されている。植物抽出物殺菌・殺カビ剤としては、メラレウカアルテルニフォリア(*Melaleuca alternifolia*)(チャノキ)由来の抽出物などのテルペン炭化水素およびテルペンアルコールが挙げられる。

【0318】

(b47)「宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードP)は、宿主植物防御メカニズムを誘起させる。宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤としては、ベンゾチアジアゾール、ベンズイソチアジアゾールおよびチアジアゾール-カルボキサミド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ベンゾチアジアゾールとしては、アシベンゾラル-S-メチルが挙げられる。ベンズイソチアジアゾールとしては、プロベナゾールが挙げられる。チアジアゾール-カルボキサミドとしては、チアジニルおよびイソチアニルが挙げられる。

【0319】

(b48)「多部位接触殺菌・殺カビ剤」は、複数の作用部位を介して真菌増殖を阻害し、また、接触/予防活性を有する。このクラスの殺菌・殺カビ剤は以下を含む。(b48.1)「銅殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM1)、(b48.2)「硫黄殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM2)、(b48.3)「ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM3)、(b48.4)「フタルイミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM4)、(b48.5)「クロロニトリル殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM5)、(b48.6)「スルファミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM6)、(b48.7)多部位接触「グアニジン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM7)、(b48.8)「トリアジン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM8)、(b48.9)「キノン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM9)、(b48.10)「キノキサリン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM10)および(b48.11)「マレイミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM11)。「銅殺菌・殺カビ剤」は、典型的には銅(II)酸化状態で銅を含有する無機化合物であり；例としては、ボルドー液(三塩基性硫酸銅)などの組成物を含む、オキシ塩化銅、硫酸銅および水酸化銅が挙げられる。「硫黄殺菌・殺カビ剤」は、硫黄原子の環または鎖を含有する無機化学物質であり；例としては、元素硫黄が挙げられる。「ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤」は、ジチオカルバメート分子部分を含有し；例としては、マンコゼブ、メチラム、プロピネブ、フェルバム、マンネブ、チラム、ジネブおよびジラムが挙げられる。「フタルイミド殺菌・殺カビ剤」は、フタルイミド分子部

10

20

30

40

50

分を含有し；例としては、ホルペット、キャプタンおよびカプタホールが挙げられる。「クロロニトリル殺菌・殺カビ剤」はクロロおよびシアノで置換された芳香族環を含有し；例としては、クロロタロニルが挙げられる。「スルファミド殺菌・殺カビ剤」としては、ジクロフルアニドおよびトリフルアニドが挙げられる。多部位接触「アニジン殺菌・殺カビ剤」としては、グアザチン、イミノクタジンアルベシレートおよびイミノクタジンシアセテートが挙げられる。「トリアジン殺菌・殺カビ剤」としては、アニラジンが挙げられる。「キノン殺菌・殺カビ剤」としては、ジチアノンが挙げられる。「キノキサリン殺菌・殺カビ剤」としては、キノメチオネート（キノメチオネートとしても公知である）が挙げられる。「マレイミド殺菌・殺カビ剤」としては、フルオロイミドが挙げられる。

【0320】

(b49)「クラス(b1)～(b48)の殺菌・殺カビ剤以外の殺菌・殺カビ剤」は、作用機構が未知であり得る一定の殺菌・殺カビ剤を含む。これらとしては：(b49.1)「フェニル・アセトアミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコードU6)、(b49.2)「アリール・フェニル・ケトン殺菌・殺カビ剤」(FRACコードU8)、(b49.3)「グアニジン殺菌・殺カビ剤」(FRACコードU12)、(b49.4)「チアゾリジン殺菌・殺カビ剤」(FRACコードU13)、(b49.5)「ピリミジノン・ヒドラゾン殺菌・殺カビ剤」(FRACコードU14)、および、(b49.6)国際公開第2013/009971号パンフレットに記載のオキシステロール結合タンパク質に結合する化合物が挙げられる。フェニルアセトアミドとしては、シフルフェナミドおよびN-[[[(シクロプロピルメトキシ)-アミノ]-[6-(ジフルオロメトキシ)-2,3-ジフルオロフェニル]-メチレン]-ベンゼンアセタミドが挙げられる。アリール・フェニルケトンとしては、メトラフェノンなどのベンゾフェノン、および、ピリオフェノンなどのベンゾイルピリジン((5-クロロ-2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジニル)(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン)が挙げられる。グアニジンとしては、ドジンが挙げられる。チアゾリジンとしては、フルチアニル((2Z)-2-[[[2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]チオ]-2-[3-(2-メトキシフェニル)-2-チアゾリジニリデン]アセトニトリル]が挙げられる。ピリミジノン・ヒドラゾンとしては、フェリムゾンが挙げられる。(b49.6)クラスとしては、オキサチアピプロリン(1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン)、および、1-[4-[4-[5R-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-エタノンであるそのR-エナンチオマー(登録番号1003319-79-6)が挙げられる。

【0321】

(b49)クラスとしてはまた、ベトキサジン、フロメトキン(2-エチル-3,7-ジメチル-6-[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-4-キノリニルメチルカーボネート)、フルオロイミド、ネオアソジン(メタアルソン酸第二鉄(ferric methanearsonate))、ピカルブトラゾックス(1,1-ジメチルエチルN-[6-[[[[(Z)-1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル]フェニルメチレン]アミノ]オキシ]メチル]-2-ピリジニル]-カルバメート)、ピロールニトリン、キノメチオネート、テブフロキン(6-(1,1-ジメチルエチル)-8-フルオロ-2,3-ジメチル-4-キノリニルアセテート)、トルニファニド(N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド)、2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-1-ベンゾピラン-4-オン、3-ブチン-1-イルN-[6-[[[[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニルメチレン]-アミノ]オキシ]-メチル]-2-ピリジニル]-カルバメート、(N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド)、N'-[4-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)-フェノキシ]-2,5-

10

20

30

40

50

ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルメタンイミダミド、N - [[(シクロプロピルメトキシ) - アミノ] - [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] - メチレン] - ベンゼンアセタミド、2, 6 - ジメチル - 1 H, 5 H - [1, 4] ジチノ [2, 3 - c : 5, 6 - c'] - ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2 H, 6 H) - テトロン、5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルフェニル) メトキシ] - 4 - ピリミジンアミン、5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロフェニル) メトキシ] - 4 - ピリミジンアミンおよび 4 - フルオロフェニル N - [1 - [[[1 - (4 - シアノフェニル) - エチル] - スルホニル] メチル] - プロピル] カルバメート、ペンチル N - [6 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメート、ペンチル N - [4 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] - アミノ] オキシ] メチル] - 2 - チアゾリル] カルバメートおよびペンチル N - [6 - [[[[(Z) - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメートが挙げられる。(b 4 9) クラスとしてはさらに、上記の特定のクラスのものに加えて、有糸分裂 - および細胞分裂 - 阻害殺菌・殺カビ剤 (例えば、(b 1)、(b 1 0) および (b 2 2)) が挙げられる。

10

20

30

40

50

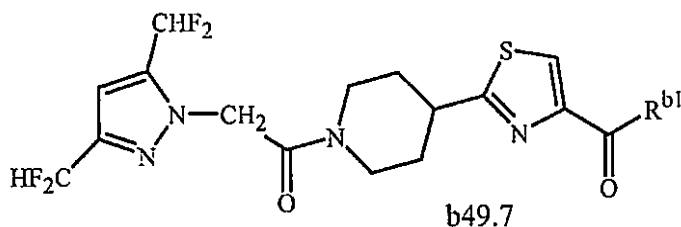
【 0 3 2 2 】

その作用機構が未知であり得るか、または、分類され得ていない追加の「クラス (b 1) ~ (b 4 8 の殺菌・殺カビ剤以外の殺菌・殺カビ剤) 」としては、以下に示されているコンポーネント (b 4 9 . 7) ~ (b 4 9 . 1 2) から選択される殺菌・殺カビ性化合物が挙げられる。

【 0 3 2 3 】

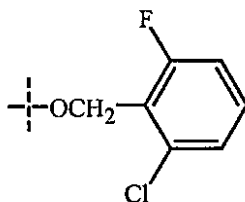
コンポーネント (b 4 9 . 7) は、式 b 4 9 . 7 の化合物

【 化 2 1 】



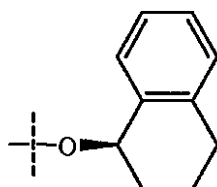
に関連し、式中、R b 1 は

【 化 2 2 】



または

【 化 2 3 】



である。

【 0 3 2 4 】

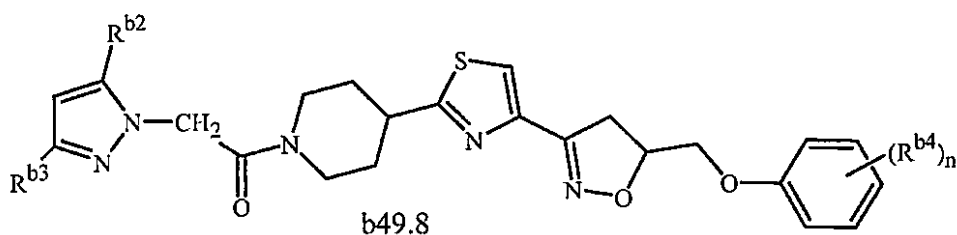
式 b 4 9 . 7 の化合物の例としては、(b 4 9 . 7 a) (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - メチル 2 - [1 - [2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジニル] - 4 - チアゾール - カルボキシレート (登録番号 1 2 9 9 4 0 9 - 4 0 - 7) および (b 4 9 . 7 b) (1 R) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 - ナフタレニル 2 - [1 - [2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジニル] - 4 - チアゾールカルボキシレート (登録番号 1 2 9 9 4 0 9 - 4 2 - 9) が挙げられる。式 4 9 . 7 の化合物を調製するための方法が、国際公開第 2 0 0 9 / 1 3 2 7 8 5 号パンフレットおよび国際公開第 2 0 1 1 / 0 5 1 2 4 3 号パンフレットに記載されている。

10

【 0 3 2 5 】

コンポーネント (b 4 9 . 8) は式 b 4 9 . 8 の化合物

【 化 2 4 】



20

に関連し、式中、 R^{b2} は CH_3 、 CF_3 または CHF_2 であり； R^{b3} は CH_3 、 CF_3 または CHF_2 であり； R^{b4} はハロゲンまたはシアノであり；および、 n は、0、1、2 または 3 である。

【 0 3 2 6 】

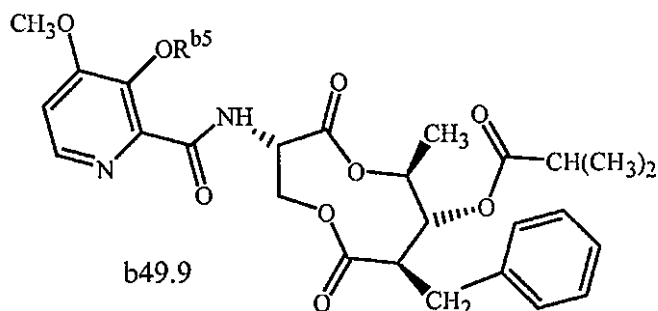
式 b 4 9 . 8 の化合物の例としては、(b 4 9 . 8 a) 1 - [4 - [4 - [5 - [(2 , 6 - ジフルオロフェノキシ) メチル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - チアゾリル] - 1 - ピペリジニル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノンが挙げられる。式 4 9 . 8 の化合物を調製するための方法が、国際特許出願第 P C T / U S 1 1 / 6 4 3 2 4 号パンフレットに記載されている。

30

【 0 3 2 7 】

コンポーネント (b 4 9 . 9) は、式 b 4 9 . 9 の化合物

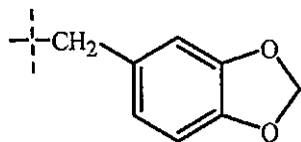
【 化 2 5 】



40

に関連し、式中、 R^{b5} は $-CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)CH_3$ 、 $-CH_2OC(O)CH_3$ 、 $-C(O)OCH_2CH(CH_3)_2$ または

【化 2 6】



である。

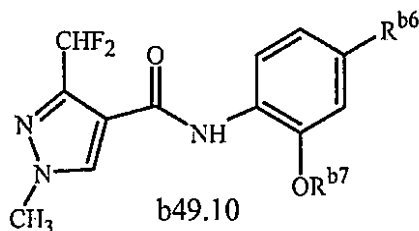
【0328】

式 b 4 9 . 9 の化合物の例としては、(b 4 9 . 9 a) [[4 - メトキシ - 2 - [[(3 S , 7 R , 8 R , 9 S) - 9 - メチル - 8 - (2 - メチル - 1 - オキシプロボキシ) - 2 , 6 - ジオキソ - 7 - (フェニルメチル) - 1 , 5 - ジオキソナン - 3 - イル] - アミノ] - カルボニル] - 3 - ピリジニル] オキシ] メチル 2 - メチルプロパノエート (登録番号 5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2) 、 (b 4 9 . 9 b) (3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 3 - [[[3 - (アセチルオキシ) - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル] - カルボニル] - アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチル - プロパノエート (登録番号 2 3 4 1 1 2 - 9 3 - 7) 、 (b 4 9 . 9 c) (3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 3 - [[[3 - [(アセチルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル] カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチル - プロパノエート (登録番号 5 1 7 8 7 5 - 3 1 - 9) 、 (b 4 9 . 9 d) (3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 3 - [[[4 - メトキシ - 3 - [[(2 - メチル - プロボキシ) - カルボニル] オキシ] - 2 - ピリジニル] - カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート (登録番号 3 2 8 2 5 6 - 7 2 - 0) 、 および (b 4 9 . 9 e) N - [[3 - (1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルメトキシ) - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル] カルボニル] - O - [2 , 5 - ジデオキシ - 3 - O - (2 - メチル - 1 - オキシプロピル) - 2 - (フェニルメチル) - L - アラビノノイル] - L - セリン、(1 4 ') - ラクトン (登録番号 1 2 8 5 7 0 6 - 7 0 - 8) が挙げられる。式 4 9 . 9 の化合物を調製するための方法が、国際公開第 9 9 / 4 0 0 8 1 号パンフレット、国際公開第 2 0 0 1 / 0 1 4 3 3 9 号パンフレット、国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 5 6 1 7 号パンフレットおよび国際公開第 2 0 1 1 0 4 4 2 1 3 号パンフレットに記載されている。

【0329】

コンポーネント (b 4 9 . 1 0) は式 b 4 9 . 1 0 の化合物

【化 2 7】



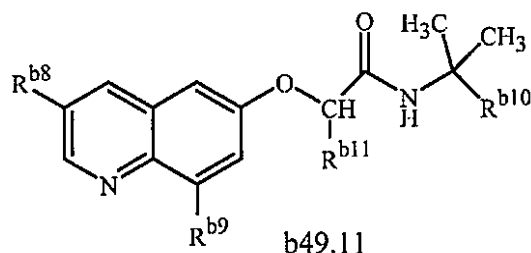
に関連し、式中、 R^{b6} は H または F であり、および、 R^{b7} は、 $-CF_2CHFCF_3$ または $-CF_2CF_2H$ である。式 b 4 9 . 1 0 の化合物の例は、(b 4 9 . 1 0 a) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - プロボキシ) - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (登録番号 1 1 7 2 6 1 1 - 4 0 - 3) および (b 4 9 . 1 0 b) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (登録番号 9 2 3 9 5 3 - 9 8 - 4) で

ある。式 49.10 の化合物は、国際公開第 2007/017450 号パンフレットに記載の方法によって調製されることが可能である。

【0330】

コンポーネント b49.11 は式 b49.11 の化合物

【化28】



10

に関連し、式中、

R^{b8} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_2 \sim C_4$ アルキニルであり；

R^{b9} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^{b10} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_4 \sim C_{12}$ アルコキシアルケニル、 $C_4 \sim C_{12}$ アルコキシアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルチオまたは $C_2 \sim C_{12}$ アルキルチオアルキルであり；

20

R^{b11} はメチルまたは $-Y^{b13}-R^{b12}$ であり；

R^{b12} は $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；および

Y^{b13} は CH_2 、O または S である。

【0331】

式 49.11 の化合物の例としては、(b49.11a) 2-[(3-プロモ-6-キノリニル)オキシ]-N-(1,1-ジメチル-2-ブチン-1-イル)-2-(メチルチオ)アセトアミド、(b49.11b) 2-[(3-エチニル-6-キノリニル)オキシ]-N-[1-(ヒドロキシ-メチル)-1-メチル-2-プロピン-1-イル]-2-(メチルチオ)-アセタミド、(b49.11c) N-(1,1-ジメチル-2-ブチン-1-イル)-2-[(3-エチニル-6-キノリニル)オキシ]-2-(メチルチオ)-アセタミド、(b49.11d) 2-[(3-プロモ-8-メチル-6-キノリニル)オキシ]-N-(1,1-ジメチル-2-プロピン-1-イル)-2-(メチルチオ)アセトアミドおよび (b49.11e) 2-[(3-プロモ-6-キノリニル)オキシ]-N-(1,1-ジメチルエチル)-ブタンアミドが挙げられる。式 49.11 の化合物、殺菌・殺カビ剤としてのその使用、および、調製方法は一般に公知である；例えば、国際公開第 2004/047538 号パンフレット、国際公開第 2004/108663 号パンフレット、国際公開第 2006/058699 号パンフレット、国際公開第 2006/058700 号パンフレット、国際公開第 2008/110355 号パンフレット、国際公開第 2009/030469 号パンフレット、国際公開第 2009/049716 号パンフレットおよび国際公開第 2009/087098 号パンフレットを参照のこと。

30

40

【0332】

コンポーネント (b49.12) は $N'-[4-[[3-[(4-クロロフェニル)メチル]-1,2,4-チア-ジアゾール-5-イル]オキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルメタンイミダミド$ に関連し、これは、ステロールの生合成に關与する C_{24} -メチルトランスフェラーゼを阻害すると考えられている。

【0333】

従って、注目すべきは、式 1 の化合物と、上記のクラス (b1) ~ (b49) からなる群から選択される少なくとも 1 種の殺菌・殺カビ性化合物とを含む混合物（すなわち、組成物）である。また、注目すべきは、前記混合物（殺菌・殺カビ的に有効な量で）を含む

50

と共に、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加のコンポーネントをさらに含む組成物である。特に注目すべきは、式1の化合物と、クラス(b1)～(b49)と関連して上記に列挙されている特定の化合物の群から選択される少なくとも1種の殺菌・殺力ピ性化合物とを含む混合物(すなわち、組成物)である。また、特に注目すべきは、前記混合物(殺菌・殺力ピ的に有効な量で)を含むと共に、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の界面活性剤をさらに含む組成物である。

【0334】

コンポーネント(b)殺菌・殺力ピ剤の例としては、アシベンゾラル-S-メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、アミスルプロム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル(ベナラキシル-Mを含む)、ベノダニル、ベノミル、ベンチアバリカルブ(ベンチアバリカルブ-イソプロピルを含む)、ベンゾビンジフルビル、ベトキサジン、ビナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピキサフェン、プラストサイジン-S、ボスカリド、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カプタホル、キャプタン、カルベンダジム、カルボキシシ、カルプロバミド、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、クロトリマゾール、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、クモキシストロビン、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール(ジニコナゾール-Mを含む)、ジノカップ、ジチアノン、ジチオラン、ドデモルフ、ドジン、エコナゾール、エディフェンホス、エノキサストロビン(エネストロプリンとしても公知である)、エボキシコナゾール、エタコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナリモル、フェナミンストロビン、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロビジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フロメトキン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルフェノキシストロビン、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホル、フルキサピロキサド、ホルベット、フサライド、フベリダゾール、フララキシル、フラメトビル、グアザチン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジンアルベシレート、イミノクタジン三アセテート、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブプロベンホス、イブプロジオン、イブプロバリカルブ、イソコナゾール、イソフェタミド、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシム-メチル、マンコゼブ、マンデプロバミド、マンデストロビン、マンネブ、メバニピリム、メプロニル、メプチルジノカップ、メタラキシル(メタラキシル-M/メフェノキサムを含む)、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、ミコナゾール、ミクロブタニル、ナフチフィン、ネオアソジン、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、オリザストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン、オキシリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシシ、オキシテトラサイクリン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ベンチオピラド、亜リン酸(例えば、ホセチル-アルミニウムといったその塩を含む)、ピカルブトラゾックス、ピコキシストロビン、ピペラリン、ポリオキシシ、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパマカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブチカルブ、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピリゾキサゾール、ピロキロン、ピロールニトリン、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、セダキサシ、シルチオフアム、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロ

10

20

30

40

50

フタラム、テクナゼン、テルピナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフル
 ザミド、チオファネート、チオファネート - メチル、チラム、チアジニル、トルコホス -
 メチル、トルニファニド、トルプロカルブ、トリフルアニド、トリアジメホン、トリアジ
 メノール、トリアリモル、トリチコナゾール、トリアゾキシド、三塩基性硫酸銅、トリシ
 クラゾール、トリクロピリカルブ、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミ
 ゾール、トリホリン、トリモルファミド、ウニコナゾール、ウニコナゾール - P、バリダ
 マイシン、バリフェナレート（バリフェナルとしても公知である）、ピンクロゾリン、ジ
 ネブ、ジラム、ゾキサミド、(3S, 6S, 7R, 8R) - 3 - [[[3 - [(アセチル
 オキシ)メトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル]カルボニル]アミノ] - 6 - メチ
 ル - 4, 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル2 - 10
 メチル - プロパノエート、(3S, 6S, 7R, 8R) - 3 - [[[3 - (アセチルオキ
 シ) - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル] - カルボニル] - アミノ] - 6 - メチル - 4, 9
 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル2 - メチル - プ
 ロパノエート、N - [[3 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルメトキシ) - 4 -
 メトキシ - 2 - ピリジニル]カルボニル] - O - [2, 5 - ジデオキシ - 3 - O - (2 -
 メチル - 1 - オキソプロピル) - 2 - (フェニルメチル) - L - アラビノノイル] - L -
 セリン、(1, 4') - ラクトン、N - [2 - (1S, 2R) - [1, 1' - ビシクロブ
 ロピル] - 2 - イルフェニル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾ
 ール - 4 - カルボキサミド、2 - [(3 - プロモ - 6 - キノリニル)オキシ] - N - (1
 , 1 - ジメチル - 2 - ブチン - 1 - イル) - 2 - (メチルチオ)アセトアミド、2 - [(20
 3 - プロモ - 6 - キノリニル)オキシ] - N - (1, 1 - ジメチルエチル) - ブタンアミ
 ド、2 - [(3 - プロモ - 8 - メチル - 6 - キノリニル)オキシ] - N - (1, 1 - ジメ
 チル - 2 - プロピン - 1 - イル) - 2 - (メチルチオ)アセトアミド、2 - ブトキシ - 6
 - ヨード - 3 - プロピル - 4H - 1 - ベンゾピラン - 4 - オン、3 - ブチン - 1 - イルN
 - [6 - [[[(1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニルメチレン]
 - アミノ]オキシ] - メチル] - 2 - ピリジニル]カルバメート、(1 - クロロシク
 ロプロピル) - [2 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル)エチル] - 1H - 1, 2
 , 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、2 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 -
 (2, 2 - ジクロロシクロプロピル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 1, 2 - ジヒドロ - 3
 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フル
 オロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 4 - イソオキサゾリル] - 3 - 30
 ピリジンメタノール、rel - 1 - [[(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) -
 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] - メチル] - 1H - 1, 2,
 4 - トリアゾール、rel - 2 - [[(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2
 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル]メチル] - 1, 2 - ジヒドロ -
 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、rel - 1 - [[(2R, 3S) - 3 -
 (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル]メ
 チル] - 5 - (2 - プロペン - 1 - イルチオ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、3 -
 [5 - (4 - クロロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - 3 - イソキサゾリジニル]ピリジン
 、(2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - メチル2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス(ジ
 フルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル]アセチル] - 4 - ビペリジニル] - 4
 - チアゾール - カルボキシレート、N' - [4 - [[3 - [(4 - クロロフェニル)メチ
 ル] - 1, 2, 4 - チア - ジアゾール - 5 - イル]オキシ] - 2, 5 - ジメチルフェニル
] - N - エチル - N - メチル - メタンイミダアミド、N - [2 - [4 - [[3 - (4 - ク
 ロロフェニル) - 2 - プロピン - 1 - イル]オキシ] - 3 - メトキシフェニル] - エチル
] - 3 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル) - アミノ] - ブタンアミド、N - [2 - [4
 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピン - 1 - イル]オキシ] - 3 - メトキ
 シフェニル] - エチル] - 3 - メチル - 2 - [(エチルスルホニル) - アミノ] - ブタン
 アミド、N' - [4 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - フェノキシ] - 2,
 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルメタンイミダミド、N - シクロプロピ
 50

ル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [[2 - (1 - メチルエチル) - フェニル] メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - [[(シクロプロピルメトキシ) - アミノ] - - [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] - メチレン] - ベンゼンアセタミド、N - [2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチルエチル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (3', 4' - ジフルオロ [1, 1' - ビフェニル] - 2 - イル) - 3 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピラジンカルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサ - フルオロ - プロポキシ) - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、5, 8 - ジフルオロ - N - [2 - [3 - メトキシ - 4 - [[4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] オキシ] - フェニル] - エチル] - 4 - キナゾリンアミン、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 - [4 - [4 - [5 R - [(2, 6 - ジフルオロフェノキシ) メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - チアゾリル] - 1 - ビベルジニル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、N - (1, 1 - ジメチル - 2 - ブチン - 1 - イル) - 2 - [(3 - エチニル - 6 - キノリニル) オキシ] - 2 - (メチルチオ) - アセタミド、2, 6 - ジメチル - 1 H, 5 H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c'] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2 H, 6 H) - テترون、2 - [(3 - エチニル - 6 - キノリニル) オキシ] - N - [1 - (ヒドロキシ - メチル) - 1 - メチル - 2 - プロピン - 1 - イル] - 2 - (メチルチオ) - アセタミド、4 - フルオロフェニル N - [1 - [[[1 - (4 - シアノフェニル) - エチル] - スルホニル] メチル] - プロピル] カルバメート、5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロフェニル) - - メトキシ] - 4 - ピリミジンアミン、5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルフェニル) - メトキシ] - 4 - ピリミジンアミン、(3 S, 6 S, 7 R, 8 R) - 3 - [[[4 - メトキシ - 3 - [[(2 - メチル - プロポキシ) - カルボニル] オキシ] - 2 - ピリジニル] - カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、 - (メトキシ - イミノ) - N - メチル - 2 - [[[1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エトキシ] - イミノ] - メチル] - ベンゼンアセタミド、[[4 - メトキシ - 2 - [[[(3 S, 7 R, 8 R, 9 S) - 9 - メチル - 8 - (2 - メチル - 1 - オキソプロポキシ) - 2, 6 - ジオキソ - 7 - (フェニルメチル) - 1, 5 - ジオキソナン - 3 - イル] - アミノ] - カルボニル] - 3 - ピリジニル] オキシ] メチル 2 - メチルプロパノエート、ペンチル N - [6 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメート、ペンチル N - [4 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] - アミノ] オキシ] メチル] - 2 - チアゾリル] カルバメート、およびペンチル N - [6 - [[[[(Z) - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメートおよび (1 R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1 - ナフタレニル 2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジニル] - 4 - チアゾールカルボキシレートが挙げられる。従って、注目すべきは、コンポーネント (a) として式 1 の化合物 (または、その N - オキシドもしくは塩) と、コンポーネント (b) として、上記のリストから選択される少なくとも 1 種の殺菌・殺力ピ剤とを含む殺菌・殺力ピ組成物である。

【0335】

特に注目すべきは、式 1 の化合物 (または、その N - オキシドもしくは塩) (すなわち、組成物中のコンポーネント (a)) と、アゾキシストロビン、ベンゾピンジフルビル、

10

20

30

40

50

ビキサフェン、キャプタン、カルプロパミド、クロロタロニル、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメトモルフ、エボキシコナゾール、エタボキサム、フェナリモル、フェンヘキサミド、フルアジナム、フルジオキソニル、フルオピラム、フルシラゾール、フルチアニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、イプロジオン、イソフェタミド、イソピラザム、クレソキシム - メチル、マンコゼブ、マンドストロビン、メブチルジノカップ、メタラキシル (メタラキシル - M / メフェノキサムを含む)、メトコナゾール、メトラフェノン、ミクロブタニル、オキサチアピプロリン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、亜リン酸 (例えば、ホセチル - アルミニウムといったその塩を含む)、ピコキシストロビン、プロピコナゾール、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピリメタニル、セダキサンスピロキサミン、硫黄、テブコナゾール、チオフアネート - メチル、トリフロキシストロビン、ゾキサミド、
 - (1 - クロロシクロプロピル) - [2 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル) エチル] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、2 - [2 - (1 クロロシクロプロピル) - 4 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 1, 2 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、N - [2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチルエチル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 - [4 - [4 - [5 R - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - チアゾリル] - 1 - ビペリジニル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - エタノン、1, 1 - ジメチルエチル N - [6 - [[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニルメチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメート、2, 6 - ジメチル - 1 H, 5 H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c'] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2 H, 6 H) - テترون、5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロフェニル) - メトキシ] - 4 - ピリミジンアミン、5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルフェニル) - メトキシ] - 4 - ピリミジンアミン、(S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 4 - イソオキサゾリル] - 3 - ピリジンメタノール、rel - 1 - [[(2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] - メチル] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、rel - 2 - [[(2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] メチル] - 1, 2 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、および rel - 1 - [[(2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキシラニル] メチル] - 5 - (2 - プロペン - 1 - イルチオ) - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール (すなわち、組成物中のコンポーネント (b) として) との組み合わせである。

【0336】

真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害のより良好な防除 (例えば、低使用量または広範囲の植物病原体の防除) または耐性管理には、上記の群から選択される殺菌・殺力ビ剤を伴う本発明の化合物の混合物が好ましい。

【0337】

本発明の化合物を配合可能な他の生物学的に有効な化合物または薬剤の例は以下のとおりである：アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アクリナトリン、アフイドピロペン ([(3 S, 4 R, 4 a R, 6 S, 6 a S, 12 R, 12 a S, 12 b S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1, 3, 4, 4 a, 5, 6, 6 a, 12, 12 a, 12 b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6 a, 12 b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2 H, 11 H - ナフト [2, 1 - b] ピラノ [3, 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチルシクロプロパンカルボキシレート)、アミドフルメト (S - 1955)、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス - メチル、ピフェ

10

20

30

40

50

ントリン、ピフェナゼート、ブプロフェジン、カルボフラン、カルタップ、クロラントラ
 ニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホ
 ス - メチル、クロマフェノジド、クロチアニジン、シアントラニリプロール (3 - プロモ
 - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - [(メチ
 ルアミノ) カルボニル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シクラ
 ニリプロール (3 - プロモ - N - [2 - プロモ - 4 - クロロ - 6 - [[(1 - シクロプロ
 ピルエチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) -
 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シクロキサブリド ((5 S , 8 R) - 1 - [
 (6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 , 3 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - 9
 - ニトロ - 5 , 8 - エポキシ - 1 H - イミダゾ [1 , 2 - a] アゼピン)、シフルメトフ
 ェン、シフルトリン、 - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、シペル
 メトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ディルド
 リン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラ
 ン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、フェノチ
 オカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、
 フロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェノキシストロビン (メチ
 ル (E) - 2 - [[2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] メチル] -
 - (メトキシメチレン) ベンゼンアセテート)、フルフェンスルフォン (5 - クロロ -
 2 - [(3 , 4 , 4 - トリフルオロ - 3 - プテン - 1 - イル) スルホニル] チアゾール)
 、フルピプロール (1 - [2 , 6 - ジクロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] -
 5 - [(2 - メチル - 2 - プロペン - 1 - イル) アミノ] - 4 - [(トリフルオロメチル)
 スルフィニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル)、フルピラジフロン (4 -
 [[(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] (2 , 2 - ジフルオロエチル) アミノ] -
 2 (5 H) - フラノン)、 - フルバリネート、フルフェネリム (UR - 5 0 7 0 1)、
 フルフェノクスロン、ホノホス、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン ([2 , 3 , 5 , 6
 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) フェニル] メチル 2 , 2 - ジメチル - 3 - [
 (1 Z) - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 1 - プロペン - 1 - イル] シクロプロパンカルボ
 キシレート)、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロブリド、インドキサカ
 ルブ、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メベルフルトリン ([2 , 3 , 5 ,
 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) フェニル] メチル (1 R , 3 S) - 3 - (2 ,
 2 - ジクロロエテニル) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート)、メ
 タフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メトブレン、
 メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、ミルベマイシンオキシム、モン
 フルオロトリン ([2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) フェニル
] メチル 3 - (2 - シアノ - 1 - プロペン - 1 - イル) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパ
 ンカルボキシレート)、モノクロトホス、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバル
 ロン、ノピフルムロン (XDE - 0 0 7)、オキサミル、ピフルブミド (1 , 3 , 5 - ト
 リメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキサプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル)
 - 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチ
 ル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド)、パラチオン、パラチオン -
 メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカー
 ブ、プロフェノホス、プロフルトリン、ピメトロジン、ピラフルプロール、プレトリン、
 ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン (メチル (E) - 2 - [[[2 -
 [(2 , 4 - ジクロロフェニル) アミノ] - 6 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリミジ
 ニル] オキシ] メチル] - - (メトキシメチレン) ベンゼンアセテート)、ピリプロール
 、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジ
 クロフェン、スピロメシフェン (BSN 2 0 6 0)、スピロテトラマト、スルホキサフロ
 ル、スルプロホス、テブフェノジド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テ
 トラクロルピンホス、テトラメチルフルトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チオ
 ジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザ

10

20

30

40

50

メート、トリクロルホンおよびトリフルムロンなどの無脊椎有害生物防除化合物または薬剤；ならびに、バチルスチューリングエンシスアイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*)、バチルスチューリングエンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*)、およびバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) の被包性デルタエンドトキシン (例えば、Cellcap、MPV、MPV II) などの昆虫病原性バクテリアを含む生物剤；グリーンムスカリン菌などの昆虫病原性菌；ならびに、バキュロウイルス、HzNPV、AfNPVなどの核多核体ウイルス (NPV) を含む昆虫病原性ウイルス；ならびに、CpGVなどのグラニュローシスウイルス (GV)。

10

【0338】

本発明の化合物およびその組成物は、遺伝的に形質転換されて、無脊椎有害生物に有害なタンパク質 (バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシンなど) を発現する植物に適用されることが可能である。外因的に適用される本発明の殺菌・殺力ビ性化合物の効果は、発現されるトキシンタンパク質と相乗的であり得る。

【0339】

農学的保護剤 (すなわち、殺虫剤、殺菌・殺力ビ剤、抗線虫薬、殺ダニ剤、除草剤および生物剤) に関する一般的な文献としては、The Pesticide Manual, 13th Edition, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003およびThe BioPesticide Manual, 2nd Edition, L.G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001が挙げられる。

20

【0340】

これらの種々の混合相手の1種または複数種が用いられる実施形態について、これらの種々の混合相手 (合計) 対式1の化合物の重量比は、典型的には、約1:3000~約3000:1である。注目すべきは、約1:300~約300:1の重量比 (例えば、約1:30~約30:1の比) である。当業者は、所望の範囲の生物学的活性に必要とされる活性処方成分の生物学的に有効な量を単純な実験を通して容易に判定することが可能である。これらの追加のコンポーネントを包含することで、式1の化合物単独で防除される範囲を超えて、防除される病害の範囲を拡大し得ることが明らかであろう。

30

【0341】

一定の事例において、本発明の化合物と他の生物学的に有効な (特に殺菌・殺力ビ性) 化合物もしくは薬剤 (すなわち、活性処方成分) との組み合わせは、相加的を超える (すなわち相乗的な) 効果をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される活性処方成分の量を低減させることが常に望ましい。殺菌・殺力ビ性活性処方成分の相乗作用が農業経済学的に十分なレベルの真菌防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組み合わせは、作物生産コストの削減および環境負荷の低減に有利であることが可能である。

40

【0342】

また、一定の事例において、本発明の化合物と他の生物学的に有効な化合物もしくは薬剤との組み合わせは、農学的環境に有益な生体に対して拮抗作用 (すなわち、毒性緩和) 効果をもたらすことが可能である。例えば、本発明の化合物は、作物植物に対して除草剤の毒性を緩和し、または、殺虫剤から有益な昆虫種 (例えば、捕食昆虫、蜂などの受粉媒介者) を保護し得る。

【0343】

種子処理において有用な混合物を提供するための式1の化合物との配合について注目すべき殺菌・殺力ビ剤としては、これらに限定されないが、アミスルプロム、アゾキシスト

50

ロビン、ボスカリド、カルベンダジム、カルボキシニル、シモキサニル、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジメトモルフ、フルアジナム、フルジオキサニル、フルフェノキシストロビン、フルキンコナゾール、フルオピコリド、フルオキサストロビン、フルトリアホール、フルキサピロキサド、イブコナゾール、イブプロジオン、メタラキシル、メフェノキサム、メトコナゾール、ミクロブタニル、バクロブトラゾール、ペンフルフェン、ピコキシストロビン、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、セダキサン、シルチオフアム、テブコナゾール、チアベンダゾール、チオファネート - メチル、チラム、トリフロキシストロビンおよびトリチコナゾールが挙げられる。

【0344】

種子処理において有用な混合物を提供するために式1の化合物と配合可能である無脊椎有害生物防除化合物または薬剤としては、これらに限定されないが、アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンサルタップ、ピフェントリン、プロプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナビル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シフルトリン、
- シフルトリン、シハロトリン、
- シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、シペルメトリン、
- シペルメトリン、
- シペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ディルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンブロックス、エトキサゾール、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジ
アミド、フルエンシルホン、フルフェノクスロン、フルフィプロール、フルピラジフロン、フルバリネート、ホルメタネート、ホスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルム
ロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メペルフルトリン、メタフルミゾン、メチオカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシフェノジ
ド、モンフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフル
ブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリミノストロビン、ピリダリル、ピ
リプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピ
ロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフル、テブフェノジド、テトラメトリン
、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスル
タップ - ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルムロン、バチルスチュ
ーリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシ
ン、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) の
菌株およびヌクレオポリヒドロシス (*Nucleopolyhydrosis*) ウイル
スの菌株が挙げられる。

【0345】

種子処理に有用な式1の化合物を含む組成物は、植物病原性真菌もしくはバクテリアおよび/または線虫などの土壌伝播性動物による悪影響に対する保護をもたらすことが可能であるバクテリアおよび真菌をさらに含むことが可能である。殺線虫特性を示すバクテリアとしては、これらに限定されないが、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*)、セレウス菌 (*Bacillus cereus*)、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) およびパストリアペネトランス (*Pasteuria penetrans*) が挙げられ得る。好適なバチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) 菌株は、BioNem (商標) として市販されている菌株 CNCM
I - 1582 (GB - 126) である。好適なセレウス菌 (*Bacillus cereus*) 菌株は、菌株 NCMM I - 1592 である。両方のバチルス (*Bacillus*) 菌株が米国特許第 6, 406, 690 号明細書に開示されている。殺線虫活性を示す他の好適なバクテリアは、B. アミロリケファシエンシス (*B. amyroliquefaciens*) IN937a および枯草菌 (*B. subtilis*) 菌株 GB03 である。殺菌・殺カビ特性を示すバクテリアとしては、これらに限定されないが、B. プミルス (*B. pumilus*) 菌株 GB34 が挙げられ得る。殺線虫特性を示す真菌性種としては

、これらに限定されないが、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*)、パエシロマイセスリラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) およびブルプレオチリウムリラシヌム (*Purpureocillium lilacinum*) が挙げられ得る。

【0346】

種子処理はまた、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*) などの一定のバクテリア性植物病原体から単離される、ハルピンと呼ばれるエリシタータンパク質などの天然の殺線虫性剤を1種または複数種含んでいることが可能である。一例は、N-Hibit (商標) Gold CSTとして入手可能である Harpin-N-Tek 種子処理技術である。

10

【0347】

種子処理はまた、マイクロ共生窒素固定バクテリアであるダイズ根粒菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) などのマメ科植物-根粒形成菌種の1種または複数種を含んでいることが可能である。これらの接種株は、任意選択により、マメ科植物の根における根粒形成の開始時に根粒菌によって生成される根粒形成 (Nod) 要因である1種または複数種のリポキトオリゴ糖 (LCO) を含んでいることが可能である。例えば、Optimize (登録商標) という銘柄の種子処理技術では、接種株と組み合わせて LCO Promoter Technology (商標) が取り入れられる。

【0348】

種子処理はまた、菌根菌による根コロニー形成レベルを高めることが可能である1種または複数種のイソフラボンを含んでいることが可能である。菌根菌は、水、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩および金属などの栄養分の根吸収を高めることにより植物の成長を向上させる。イソフラボンの例としては、これらに限定されないが、ゲニステイン、ビオカニンA、ホルモノネチン、ダイゼイン、グリシテイン、ヘスペレチン、ナリングニンおよびプラテンセインが挙げられる。ホルモノネチンは、PHC Colonize (登録商標) AG などの菌根接種株製品における有効成分として入手可能である。

20

【0349】

種子処理はまた、病原体との接触後に植物における全身獲得抵抗性を誘起させる1種または複数種の植物活性化剤を含んでいることが可能である。このような保護メカニズムを誘起させる植物活性化剤の一例は、アシベンゾラル-S-メチルである。

30

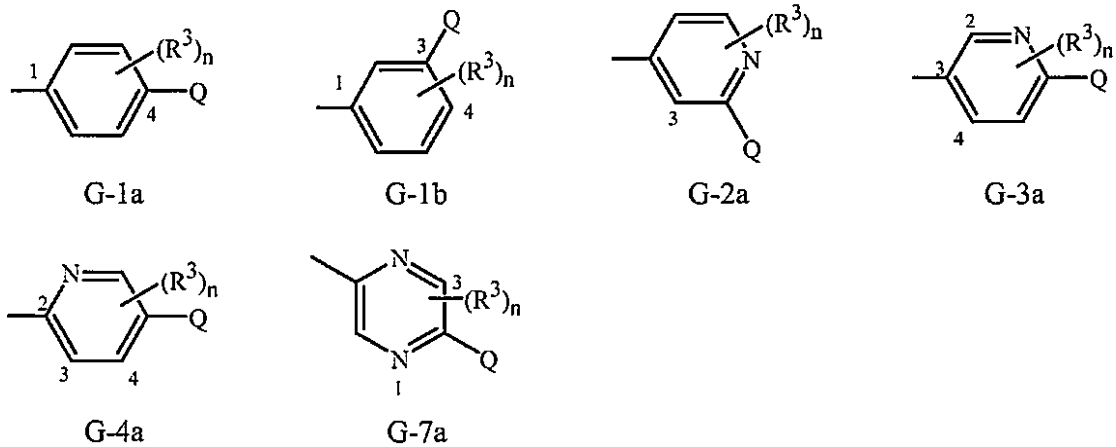
【0350】

以下のテストは、特定の病原体に対する本発明の化合物の防除効力を実証する。化合物によりもたらされる病原体防除保護は、しかしながら、これらの種には限定されない。化合物の説明については索引表 A ~ H を参照のこと。以下の表においては以下の略語が用いられている: Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、Pr はプロピルを意味し、i-Pr はイソプロピルを意味し、i-Pre はイソプロペニルを意味し、c-Pr はシクロプロピルを意味し、OMe はメトキシを意味し、TMS はトリメチルシリルを意味し、Ph はフェニルを意味し、MeOC (=O) はメトキシカルボニルを意味し、CN はシアノを意味する。 $(R^3)_n$ が「H」として列挙されている場合、これは、n が0であり、および、Gを含む環が R^3 で置換されていないことを意味する。略記「Ex .」という略記は、「実施例」を指し、これには、どの実施例において化合物が調製されているかを示す数字が続いている。以下の索引表において、質量スペクトルは、大気圧化学イオン化 (AP^+) または電気スプレー電離 (ESI^+) を用いる質量分光計 (MS) が組み合わされた液体クロマトグラフィーを用いることにより観察された、 H^+ (分子量1) の分子への付加により形成され、同位体存在度が最も高い親イオン ($M+1$)、または、分子からの H^+ (分子量1) の損失により形成される ($M-1$) の分子量として報告され、ここで、「amu」は原子質量単位を表す。以下の索引表 A ~ F において、「G」は以下の通り定義される。

40

【0351】

【化 2 9】

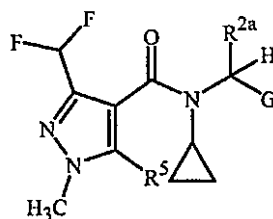


10

【 0 3 5 2】

【表 3 9】

索引表 A



20

化合物 No.	R ⁵	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m. p. (°C)	M+1	M-1
1 (Ex. 1)	H	CH ₃	G-3a	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	*		
2	H	H	G-3a	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		441	

30

【 0 3 5 3】

【表 4 0】

化合物 No.	R ⁵	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m. p. (°C)	M+1	M-1
3	F	H	G-1b	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		458	
4	H	H	G-4a	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		442	
5	H	H	G-4a	H	3-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		408	
6	H	H	G-4a	H	4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		408	
7	H	H	G-4a	H	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		374	
8	H	H	G-4a	H	3-フェニル-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		450	
9 (Ex. 2)	H	H	G-1b	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	*		10
10	H	H	G-1a	2-Cl	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	**	485	
11	H	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	112~115		
12 (Ex. 3)	F	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	*	492	
13	H	H	G-1b	6-NO ₂	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		485	
14	H	H	G-1b	6-OCH ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		471	
16	H	H	G-4a	3-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	150~153	521	
17	H	CH ₃	G-4a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		489	
18	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		510	
19	H	CH ₃	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		489	
20	H	H	G-1a	2-Cl	4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		441	20
21	H	CH ₃	G-1b	4-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			522
22	H	CH ₃	G-1b	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			488
23	F	H	G-1a	2-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	94~96		
24	H	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	133~136		
25	F	H	G-1a	2-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	126~129		
26	H	CH ₃	G-1b	4-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			468
27	H	H	G-1b	4-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		454	
28	H	H	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		454	
29	H	H	G-1b	5-Me-6-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		473	
30	H	H	G-1b	6-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		474	30
31	Cl	H	G-1a	2-Cl	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		520	
32	H	H	G-1b	6-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		518	
33	H	H	G-1b	6- <i>c</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		480	
34	F	H	G-1a	2-Cl	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		504	
36	H	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	129~132		
37	F	H	G-1a	2-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	114~117		
38	H	H	G-1b	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		474	
39	H	H	G-1b	6-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		525	
40	H	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	86~89		40
41	H	H	G-1b	2-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		508	

【 0 3 5 4 】

【表 4 1】

化合物 No.	R ⁵	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m. p. (°C)	M+1	M-1
42	H	CH ₃	G-1b	5-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			522
43	F	H	G-3a	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	121~124		
44	H	CH ₃	G-1b	4-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			484
45	H	CH ₃	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			468
46	F	H	G-1a	2-Cl	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		424	
47	F	H	G-1a	2-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		504	
48	H	H	G-1a	2-Cl	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		406	10
49	H	H	G-1a	2-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		486	
50	H	H	G-1a	2-Cl	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		407	
51	F	CH ₃	G-1b	4-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	96~99		
52	F	CH ₃	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			486
53	F	CH ₃	G-1b	6-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			552
54	F	CH ₃	G-1b	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	119~122		
55	F	CH ₃	G-1b	4-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	96~99		
56	F	CH ₃	G-1b	5-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	111~115		
57	F	H	G-1b	6-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		527	
58	F	H	G-1b	5-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		527	20
59	F	H	G-1b	4-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		527	
60	F	H	G-1b	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		493	
61	F	H	G-1a	2-OCH ₂ CN	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	121~124		
62	F	H	G-1a	2-OCH ₂ C≡CH	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	96~99		
63	H	H	G-4a	3- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	135~138		
64	F	H	G-1a	2-Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル		425	
65	F	H	G-1a	2-Cl	3-CH ₃ -1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		439	
66	F	H	G-1a	2-Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル		425	
67	F	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		494	30
68	F	H	G-1a	2-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		476	
69	H	H	G-1a	2-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		459	
70	F	H	G-1a	2,6-ジ-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		495	
71	H	H	G-1a	2,6-ジ-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		476	
72	F	CH ₃	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		506	
73	F	CH ₃	G-1b	4-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	112~115		
74	F	CH ₃	G-1b	4-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			506
75	H	H	G-2a	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	160~163		
76	F	H	G-4a	3- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	124~127		
77	H	CH ₃	G-1b	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	79~83		40
78	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	4-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	156~159		

【 0 3 5 5 】

【表 4 2】

化合物 No.	R ⁵	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m. p. (°C)	M+1	M-1
79	F	CH ₃	G-1b	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			506
80	H	CH ₃	G-1b	6- <i>i</i> -Pre	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			494
81	F	H	G-4a	3-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	130~133		
82	H	CH ₃	G-1b	6- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			496
84	F	H	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		473	
85	F	H	G-1b	5-Me-6-F	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		491	
86	F	H	G-1b	6-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		493	10
87	F	H	G-1b	4-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		473	
88	F	H	G-1b	6- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		499	
89	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	77~81		
90	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	3-Ph-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	170~172		
91	F	H	G-4a	3-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	154~158		
92	F	H	G-2a	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	171~174		
93	F	H	G-1a	3-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	104~107		
94	F	H	G-1a	3-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		543	
95	F	H	G-1a	3-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		526	
96	F	H	G-1a	3-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		489	20
97	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	142~145		
98	F	H	G-1a	3-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		536	
99	F	H	G-1a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		492	
100	H	H	G-2a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			474
101	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	112~116		
102	F	H	G-1a	3- <i>i</i> -Pre	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		498	
103	F	CH ₃	G-4a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	170~173		
104	F	H	G-7a	H	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	107~111		
105	F	H	G-1a	2-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	97~100		30
106	F	H	G-1a	2-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	121~124		
107	H	H	G-1b	6-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		509	
108	H	H	G-1b	5-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		509	
109	H	H	G-1b	4-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		509	
110	F	H	G-4a	3-Br	1-CH ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル		483	
111	F	H	G-1b	6-NO ₂	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		504	
112	H	H	G-1b	5-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		475	
113	F	H	G-1b	6-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		489	
114	F	H	G-4a	3- <i>c</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	123~126		
115	H	H	G-4a	3- <i>i</i> -Pre	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	128~131		40
116	F	H	G-1a	3- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		500	

【 0 3 5 6 】

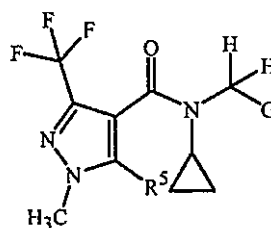
【表 4 3】

化合物 No.	R ⁵	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m. p. (°C)	M+1	M-1
117	F	H	G-4a	3-Cl	4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	300~300		
118	F	H	G-7a	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	125~128		
119	H	CH ₃	G-1b	6-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	87~90		
120	H	CH ₃	G-1b	6-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			484
121	F	H	G-1a	2- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	107~110		
122	F	H	G-4a	3-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	150~153		
123	F	CH ₃	G-1b	6- <i>i</i> -Pre	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			512
124	H	H	G-4a	3-CH ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		456	
125	F	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	144~148		
126	H	CH ₃	G-1b	4-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			488
127	F	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	132~135		
128	H	CH ₃	G-1b	6-Br	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	131~134		
129	H	CH ₃	G-1b	6-NO ₂	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	172~175		
130	H	CH ₃	G-1b	6-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	99~102		
131	F	H	G-4a	3- <i>i</i> -Pre	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	127~130		
132	F	H	G-1a	2,6-ジ-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	66~69		
133	F	CH ₃	G-1b	6-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			556
134	F	CH ₃	G-1b	6-NO ₂	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	154~157		
135	F	CH ₃	G-1b	6-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	117~121		
136	F	H	G-1b	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		492	
137	F	H	G-1b	2-CF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		526	
138	F	H	G-1b	4-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		493	
139	H	H	G-1b	4-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		475	
140	F	H	G-1b	6-OCF ₃	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		543	
141	F	CH ₃	G-1b	6- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			514
142	F	CH ₃	G-1b	6-OMe	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	88~92		
143	F	H	G-1a	2-Cl	4-Cl-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		458	
144	F	H	G-1a	2-Cl	4-CH ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		438	
145	F	H	G-1a	2-Cl	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		425	
146	F	H	G-1a	2-Cl	3-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		459	
147	F	H	G-1a	2-Cl	3-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル		505	

* ¹H NMR データについては合成例を参照のこと。** ¹H NMR データについては索引表 G を参照のこと。

【表 4 4】

索引表 B



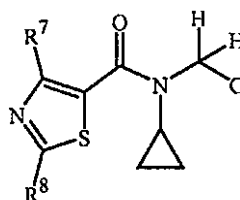
化合物 No.	R ⁵	G	(R ³) _n	Q	m.p. (°C)	M+1	M-1
35	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		493	
148	H	G-3a	4-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	200~203		
149	H	G-1b	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル			458

10

【 0 3 5 8 】

【表 4 5】

索引表 C



化合物 No.	R ⁷	R ⁸	G	(R ³) _n	Q	m.p. (°C)	M + 1
150	CF ₃	CH ₃	G-1b	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	99~101	
151	CF ₃	CH ₃	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		510
158	Br	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	129~132	
159	CH ₃	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	106~109	
160	F	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	120~124	

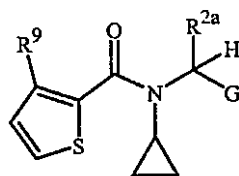
20

30

【 0 3 5 9 】

【表 4 6】

索引表 D



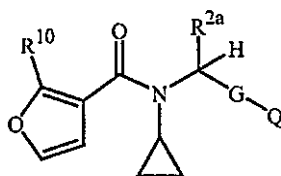
化合物 No.	R ⁹	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m.p. (°C)	M+1	M-1
152	CH ₃	H	G-1b	H	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	*		406
153	Cl	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	124~127		
154	I	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	117~119		
155	CH ₃	CH ₃	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		435	
156	I	CH ₃	G-1b	6-Me	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル		547	
157	CH ₃	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	89~92		

10

【 0 3 6 0 】

【表 4 7】

索引表 E



化合物 No.	R ¹⁰	R ^{2a}	G	(R ³) _n	Q	m.p. (°C)
161	CH ₃	H	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	78~81

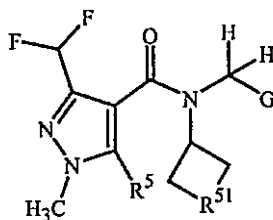
20

30

【 0 3 6 1 】

【表 4 8】

索引表 F



化合物 No.	R ⁵	R ⁵¹	G	(R ³) _n	Q	m.p. (°C)
162	F	CH ₂	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	134~137
163	H	CH ₂	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	131~134
164	F	O	G-1a	2-Cl	3-CF ₃ -1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	114~117

40

【 0 3 6 2 】

【表 4 9】

索引表 G

化合物 No.	¹ H NMR データ(他に記載のない限り CDCl ₃ 溶液) ^a
10	δ 7.91 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.49 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.07 (t, 1H), 4.83 (s, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.74 (t, 1H), 0.62–0.82 (m, 4H).

^a ¹H NMR データは、テトラメチルシランの低磁場側で ppm で表記。カップリングは、(s)-一重項、(d)-二重項、(t)-三重項、(m)-多重項、(dd)-二重項の二重項で記載。

10

【0363】

本発明の生物学的実施例

テスト A ~ E 用のテスト懸濁液を調製するための一般的なプロトコル：先ず、テスト化合物を最終体積の 3 % と等しい量でアセトン中に溶解し、次いで、250 ppm の界面活性剤 Trem (登録商標) 014 (多価アルコールエステル) を含有するアセトンおよび精製水 (体積基準で 50 / 50 混合物) 中に所望の濃度 (ppm) で懸濁させた。次いで、得られたテスト懸濁液をテスト A ~ E において用いた。サンプルを、10 ppm (**)、40 ppm、50 ppm (*) または 200 ppm (#) テスト溶液として、テスト植物の流出点まで、それぞれ、40 g ai / ha、160 g ai / ha、200 g ai / ha または 800 g ai / ha に等しい量で植物に適用した。

20

【0364】

テスト A

テスト懸濁液をトマト実生に流出点まで噴霧した。次の日、この実生に、ボトリチスシネレア (*Botrytis cinerea*) (多くの作物における灰色かび病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中に 20 で 48 時間インキュベートし、27 のグロースチャンバに 2 日間移し、その後、視認による病害評価を行った。

【0365】

テスト B

テスト懸濁液をコムギ実生に流出点まで噴霧した。次の日、この実生に、スタゴノスポラノドルム (*Stagonospora nodorum*) (セプトリアノドルム (*Septoria nodorum*) としても公知である)；コムギふ枯病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中に 20 で 48 時間インキュベートし、次いで、20 のグロースチャンバに 6 日間移し、その後、視認による病害評価を行った。

30

【0366】

テスト C

テスト懸濁液をコムギ実生に流出点まで噴霧した。次の日、この実生に、セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*) (コムギ葉枯病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中に 24 で 48 時間インキュベートし、次いで、20 のグロースチャンバに 21 日間移し、その後、視認による病害評価を行った。

40

【0367】

テスト D

テスト懸濁液をコムギ実生に流出点まで噴霧した。次の日、この実生に、ブッシニアレコンディタ (*Puccinia recondita f. sp. tritici*)；(コムギ葉さび病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中に 20 で 24 時間インキュベートし、次いで、20 のグロースチャンバに 6 日間移し、その後、視認による病害評価を行った。

【0368】

テスト E

テスト懸濁液をコムギ実生に流出点まで噴霧した。次の日、この実生に、エリシフェグ

50

ラミニス (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) (コムギうどんこ病の病因) の芽胞粉剤を播種し、20 のグロースチャンバで7または8日間インキュベートし、その後、視認による病害評価を行った。

テストA～Eの結果が表Aに記載されている。この表において、100の格付けは100%の病害防除を示し、0の格付けは病害が防除されなかった(対照と比して)ことを示す。ダッシュ(-)はテスト結果が存在しないことを示す。

【0369】

【表 5 0】

化合物 No	表A					
	テストA	テストB	テストC	テストD	テストE	
1	0	0	86	0	96	
1#	0	69	93	28	98	
2	0	0	43	0	0	
2#	0	0	96	0	43	
3	0	100	100	99	99	10
4	0	0	42	0	0	
4#	0	0	46	28	27	
5	0	0	17	0	0	
5#	0	0	80	28	0	
6	0	0	9	0	0	
6#	0	98	67	28	13	
7	0	0	0	0	0	
7#	0	0	18	0	0	
8	0	0	27	0	0	20
8#	0	0	88	74	0	
9	9	93	96	9	81	
9#	39	99	100	74	96	
10	0	99	38	86	0	
11	0	89	100	54	43	
12	0	100	100	99	97	
13	0	0	0	32	0	
14	0	42	83	32	92	30
16*	-	-	100	67	56	
17	0	100	99	23	92	
18	0	100	99	98	98	
19	0	99	75	85	64	
20	32	99	94	79	40	
21	0	0	-	0	64	
22	0	90	-	55	81	
23	0	98	-	99	98	
24	0	100	-	99	90	40
25	0	100	-	100	98	
26	0	99	-	0	81	
27	0	92	38	31	21	
28	11	99	45	45	59	
29	0	94	83	68	48	

【表 5 1】

化合物 No	テストA	テストB	テストC	テストD	テストE	
30	0	60	87	31	64	
31	0	0	42	98	0	
32	0	0	-	0	97	
33	0	98	-	68	94	
34	23	100	94	100	95	
35	0	0	89	9	0	10
36	0	99	-	99	90	
37	0	100	-	97	99	
38	14	0	-	41	69	
39	0	0	-	55	72	
40	-	99	99	99	89	
41	0	0	94	23	40	
42	-	0	39	0	0	
43	-	0	6	0	0	
44	-	78	87	0	0	20
45	-	100	96	9	90	
46	-	100	99	94	98	
47	-	100	99	98	99	
48	-	100	98	0	73	
49	-	98	99	9	69	
50	-	0	28	0	0	
51	-	100	88	0	84	
52	-	100	99	93	99	30
53	-	100	97	74	96	
54*	-	-	96	99	93	
55	-	100	97	61	87	
56	-	100	97	86	92	
57	-	-	-	-	-	
58	-	-	-	-	-	
59	-	-	-	-	-	
60	-	-	-	-	-	
61	-	0	90	9	21	40
62	-	99	99	99	94	
63	-	-	-	-	-	
64	-	100	98	100	97	
65	-	87	98	0	0	
66	-	97	94	28	0	

【表 5 2】

化合物 No	テストA	テストB	テストC	テストD	テストE	
67	-	0	99	0	0	
68	-	100	97	91	99	
69	-	60	98	0	69	
70	-	100	99	80	97	
71	-	92	99	0	91	
72	-	100	100	99	99	10
73	-	-	99	85	90	
74	-	-	99	27	93	
75**	-	-	24	45	0	
76	-	-	-	-	-	
77**	-	-	82	9	64	
78**	-	-	100	94	92	
79*	-	-	99	74	98	
80*	-	-	94	98	73	
81**	-	-	94	98	81	20
82*	-	-	88	0	87	
84*	-	100	98	89	94	
85*	-	100	99	-	95	
86*	-	100	99	68	95	
87*	-	-	98	80	92	
88*	-	-	94	99	98	
89**	-	-	100	99	81	
90**	-	-	99	99	86	30
91**	-	-	100	98	73	
92**	-	-	-	67	0	
93**	-	-	100	99	69	
94**	-	-	88	73	40	
95**	-	-	87	67	27	
96**	-	-	100	99	73	
97**	-	100	97	94	94	
98**	-	64	94	86	84	
99**	-	59	96	97	89	40
100**	-	0	6	0	0	
101**	-	-	96	82	79	
102**	-	-	100	98	13	
103**	-	-	98	98	94	
104	-	-	-	-	-	

【表 5 3】

化合物 No	テストA	テストB	テストC	テストD	テストE	
105	-	100	98	99	98	
106	-	100	96	99	97	
107	-	0	31	19	89	
108	-	0	66	0	40	
109	-	0	75	0	40	
110*	-	-	90	94	40	10
111*	-	-	14	9	0	
112*	-	-	94	54	40	
113*	-	-	100	99	97	
114**	-	-	100	100	92	
115**	-	-	27	93	40	
116**	-	-	-	98	69	
117	-	-	-	-	-	
118	-	-	-	-	-	
119	-	99	92	93	92	20
120	-	100	92	-	95	
121	-	100	95	100	99	
122**	-	-	96	99	87	
123*	-	-	100	92	93	
124	-	0	94	0	73	
125	-	100	99	100	92	
126	-	92	92	68	48	
127	-	100	99	100	98	30
128	-	100	92	0	93	
129	-	0	10	0	0	
130	-	93	28	68	72	
131*	-	-	100	100	99	
132	-	100	99	100	91	
133*	-	100	92	68	94	
134*	-	94	43	68	0	
135*	-	100	99	80	95	
136*	-	-	100	99	87	40
137*	-	-	94	98	87	
138	-	-	-	-	-	
139	-	-	-	-	-	
140	-	-	-	-	-	
141	-	-	-	-	-	

【表 5 4】

化合物 No	テストA	テストB	テストC	テストD	テストE	
142*	-	100	97	83	98	
143	-	100	99	99	99	
144	-	100	99	97	99	
145	-	95	95	0	0	
146	-	0	94	0	0	
147	-	0	93	0	0	10
148*	0	0	9	0	0	
149	0	0	43	0	0	
150	0	0	48	9	0	
151	23	0	87	23	0	
152	0	0	0	0	0	
153	-	-	-	-	-	
154	-	-	-	-	-	
155	-	-	-	-	-	
156	-	-	-	-	-	20
157	-	-	-	-	-	
158	-	-	-	-	-	
159	-	-	-	-	-	
160	-	-	-	-	-	
161	-	-	-	-	-	
162**	-	0	64	0	0	
163	-	-	-	-	-	
164**	-	0	46	0	0	30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2014/033766

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D403/12 C07D401/14 C07D231/14 C07D405/12 C07D409/12
 C07D417/12 A61K31/4155 A61K31/4427 A01N43/56 A01N43/707
 A01N43/78

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

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

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

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	WO 2013/156559 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG [DE]) 24 October 2013 (2013-10-24) I.89-I.99, I.106, I.110, I.118, I.143-I.145, I.151, I.152; claims 1-14, 22-26; examples I.34-I.36, I.40, I.41, I.46, I.50, I.65, I.83-I.85, -----	1-5, 8-10
A,P	WO 2014/004064 A1 (DU PONT [US]) 3 January 2014 (2014-01-03) the whole document -----	1-10
A	WO 2009/016220 A1 (BAYER CROPS SCIENCE SA [FR]; DESBORDES PHILIPPE [FR]; GARY STEPHANIE [FR]) 5 February 2009 (2009-02-05) the whole document ----- -/-	1-10

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier application or patent but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

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

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

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

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 July 2014

Date of mailing of the international search report

22/07/2014

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Von Daacke, Axel

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2014/033766

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2006/120224 A1 (BAYER CROPS SCIENCE SA [FR]; GARY STEPHANIE [FR]; HILL BRIAN [GB]; PEREZ) 16 November 2006 (2006-11-16) the whole document -----	1-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2014/033766

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2013156559	A1	24-10-2013	NONE
WO 2014004064	A1	03-01-2014	TW 201400462 A WO 2014004064 A1
WO 2009016220	A1	05-02-2009	AT 499835 T AU 2008281772 A1 CA 2692767 A1 CN 101820759 A CO 6160263 A2 EP 2182800 A1 ES 2359877 T3 JP 5356383 B2 JP 2010534715 A PT 2182800 E RU 2010107171 A US 2010144817 A1 US 2010189584 A1 WO 2009016220 A1 ZA 200908563 A
WO 2006120224	A1	16-11-2006	AR 057017 A1 AU 2006245728 A1 BR P10612945 A2 CA 2607917 A1 JP 4879973 B2 JP 2008545625 A KR 20080015435 A US 2010010048 A1 WO 2006120224 A1

フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I		テーマコード (参考)
C 0 7 D 403/12	(2006.01)	C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D 407/12	(2006.01)	C 0 7 D	407/12	
C 0 7 D 407/14	(2006.01)	C 0 7 D	407/14	
C 0 7 D 409/12	(2006.01)	C 0 7 D	409/12	
A 0 1 N 43/56	(2006.01)	A 0 1 N	43/56	D
A 0 1 N 47/02	(2006.01)	A 0 1 N	47/02	
A 0 1 N 43/647	(2006.01)	A 0 1 N	43/647	
A 0 1 N 43/653	(2006.01)	A 0 1 N	43/653	G
A 0 1 N 43/60	(2006.01)	A 0 1 N	43/60	
A 0 1 N 43/78	(2006.01)	A 0 1 N	43/78	B
A 0 1 P 3/00	(2006.01)	A 0 1 N	43/78	A
		A 0 1 P	3/00	

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

(72) 発明者 ジェームズ・フランシス・ベレズナク

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 0 7 3 . ニュータウンスクエア . ソウミルロード 3 2 3 1

(72) 発明者 アンドリュー・エドマンド・タギー

アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 7 1 1 . ニューアーク . トレモントコート 2 1

(72) 発明者 キンバリー・キャサリン・マーカス

アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 0 6 3 . メディア . ゲイリーストリート 4 0 6

(72) 発明者 ラヴィシカラ・ピー・レディ

インド国アーンドラプラデーシュ 5 0 0 0 9 4 . シカンデラバード . セーニクプリ . マダバプリコロニー . ディーエルアールアंकレーブ . セイブルンダバンアパートメント 5 0 2

F ターム (参考) 4C063 AA01 AA03 BB01 BB09 CC22 CC41 CC42 CC62 CC72 CC75

CC92 DD12 DD22

4H011 AA01 AA03 BB09 BB10 BB11 DA02 DA03 DA15 DA16

【要約の続き】

菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除する方法もまた開示されている。