(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第4153033号
(P4153033)

(45)発行日　平成20年9月17日(2008.9.17)　(24)登録日　平成20年7月11日(2008.7.11)

(51)Int.Cl.		F I	
C07D 207/38	(2006.01)	C07D 207/38	
C07D 209/54	(2006.01)	C07D 209/54	
C07D 209/96	(2006.01)	C07D 209/96	
C07D 279/06	(2006.01)	C07D 279/06	
C07D 307/60	(2006.01)	C07D 307/60	Z

請求項の数 35　(全 141 頁)　最終頁に続く

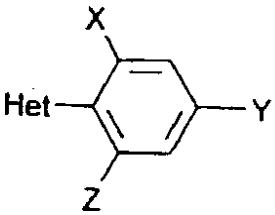
(21)出願番号　特願平8-533707
(86)(22)出願日　平成8年4月29日(1996.4.29)
(65)公表番号　特表平11-505220
(43)公表日　平成11年5月18日(1999.5.18)
(86)国際出願番号　PCT/EP1996/001781
(87)国際公開番号　WO1996/035664
(87)国際公開日　平成8年11月14日(1996.11.14)
審査請求日　平成15年2月26日(2003.2.26)
(31)優先権主張番号　195 16 258.7
(32)優先日　平成7年5月9日(1995.5.9)
(33)優先権主張国　ドイツ(DE)
(31)優先権主張番号　195 45 467.7
(32)優先日　平成7年12月6日(1995.12.6)
(33)優先権主張国　ドイツ(DE)

(73)特許権者　591063187
バイエル　アクチェンゲゼルシャフト
Ｂａｙｅｒ　Ａｋｔｉｅｎｇｅｓｅｌｌｓｃｈａｆｔ
ドイツ連邦共和国　レーフエルクーゼン（番地なし）
Ｄ－５１３６８　Ｌｅｖｅｒｋｕｓｅｎ，Ｇｅｒｍａｎｙ
(74)代理人　110000741
特許業務法人小田島特許事務所
(74)代理人　100060782
弁理士　小田島　平吉

最終頁に続く

(54)【発明の名称】有害生物防除剤及び除草剤として有用なアルキルジハロゲン化フェニル置換ケトエノール

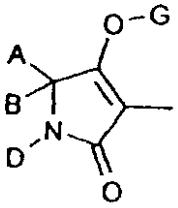
(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）
【化１】



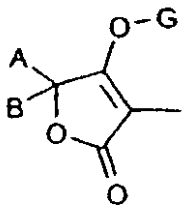
(I)

式中、Ｘがハロゲンを表し、
Ｙがハロゲンまたは$Ｃ_1$～$Ｃ_6$－アルキルを表し、
Ｚがハロゲンまたは$Ｃ_1$～$Ｃ_6$－アルキルを表し、ここに常に置換基Ｙ及びＺの１つがハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表し、
Ｈｅｔが基

【化２】

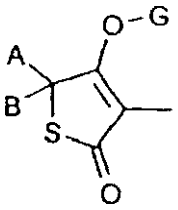


(1),



(2),

【化３】

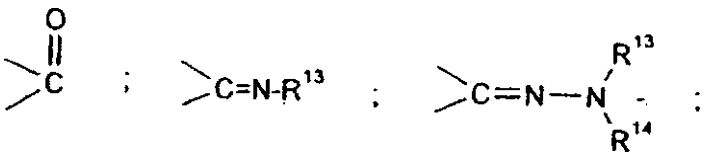


(3),

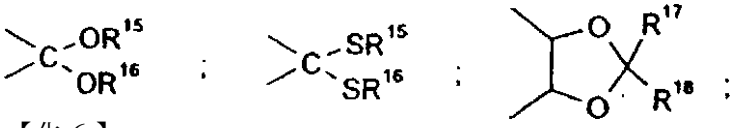
の１つを表し、
Ａが水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_{12}$－アルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_8$－アルケニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_{10}$－アルコキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキル、ポリ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_{10}$－アルキルチオ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルを表すか、随時ハロゲン、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_8$－シクロアルキルを表すか、或いはフェニル、ナフチル、フェニル－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ナフチル－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、あるいは環原子５または６個を有し且つ酸素、硫黄及び窒素よりなる群からのヘテロ原子３個を有するヘタリールを表し、各々の場合に随時ハロゲン、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよく、
Ｂが水素、Ｃ$_1$～Ｃ$_{12}$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルを表すか、
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、メチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_{10}$－シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルチオ、ハロゲンまたはフェニルで置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_{10}$－シクロアルキルまたはＣ$_5$～Ｃ$_{10}$－シクロアルケニルを表すか、
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、随時酸素及び／または硫黄原子１または２個を含んでいてもよいアルキレンジイル或いはアルキレンジオキシまたはアルキレンジチオイル基で置換され、ここに該基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～８員の環を形成するＣ$_5$～Ｃ$_6$－シクロアルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々随時Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシまたはハロゲンで置換されていてもよく、かつ各々の場合に１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_6$－アルカンジイル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－アルケンジイルまたはＣ$_4$～Ｃ$_6$－アルカンジエンジイルを表すＣ$_3$～Ｃ$_8$－シクロアルキルまたはＣ$_5$～Ｃ$_8$－シクロアルケニルを表し、
Ｄが水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_{12}$－アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_8$－アルケニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_8$－アルキニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_{10}$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_8$－アルキル、ポリ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_8$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_{10}$－アルキルチオ－Ｃ$_2$～Ｃ$_8$－アルキルを表すか、随時ハロゲン、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシまたはＣ$_1$～Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_8$－シクロアルキルを表すか、或いはフェニル、環原子５～６個を有し且つ酸素、硫黄

及び窒素よりなる群からのヘテロ原子１または２個を有するヘタリール、フェニル－C_1～C_6－アルキル或いは環原子５～６個を有し且つ酸素、硫黄及び窒素よりなる群からのヘテロ原子１または２個を有するヘタリール－C_1～C_6－アルキルを表し、各々の場合に随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいか、
Ａ及びＤが一緒になって、１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ各々の場合に随時ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{10}－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルチオ、C_3～C_7－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシ、或いは更に融合環を形成し、かつ各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時C_1～C_6－アルキルで置換されていてもよいか、または２個の隣接する置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時更に５または６環原子を有する飽和もしくは不飽和の炭素環を形成してもよいC_3～C_6－アルカンジイル、C_3～C_6－アルケンジイルまたはC_4～C_6－アルカンジエンジイル基で置換されていてもよいC_3～C_6－アルカンジイル、C_3～C_6－アルケンジイルまたはC_4～C_6－アルカンジエンジイル基を表すか、或いは
Ａ及びＤが一緒になって各々次の基

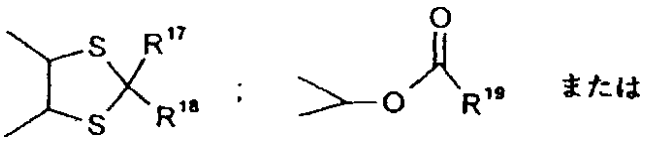
【化４】



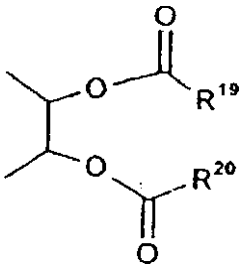
【化５】



【化６】

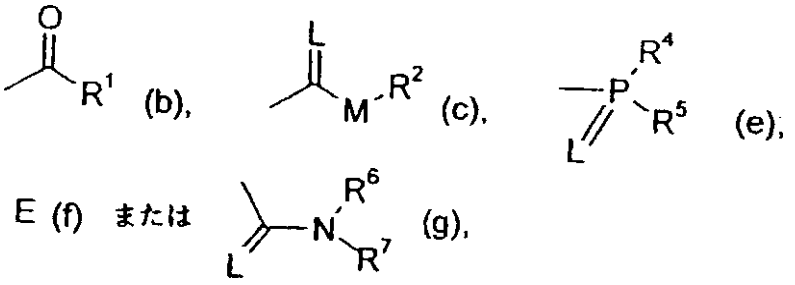


【化７】



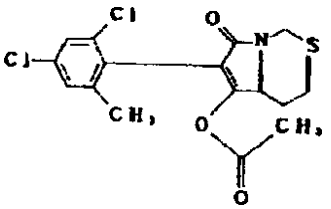
の１つが随時存在していてもよいC_3～C_6－アルカンジイルまたはC_3～C_6－アルケンジイル基を表し、
ＧがＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に基

【化８】



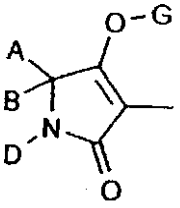
の１つを表し、ここに
Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、
Ｌは酸素または硫黄を表し、そして
Ｍは酸素または硫黄を表し、
R^1が各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{20}－アルキル、C_2～C_{20}－アルケニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルキルチオ－C_1～C_8－アルキルまたはポリ－C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルキルを表すか、或いは随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、随時ハロゲン、シアノ、ニトロ、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－ハロゲノアルコキシ、C_1～C_6－アルキルチオまたはC_1～C_6－アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、
随時ハロゲン、ニトロ、シアノ、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_6－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニル－C_1～C_6－アルキルを表すか、
随時ハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよい酸素、硫黄及び窒素よりなる群からの１または２個のヘテロ原子を有する５または６員のヘタリールを表すか、
随時ハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよいフェノキシ－C_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
随時ハロゲン、アミノまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよい酸素、硫黄及び窒素よりなる群からの１または２個のヘテロ原子を有する５または６員のヘタリールオキシ－C_1～C_6－アルキルを表し、
R^2が随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{20}－アルキル、C_2～C_{20}－アルケニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルまたはポリ－C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルを表すか、
随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシで置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時ハロゲン、シアノ、ニトロ、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_6－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^3が随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは各々随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表し、
R^4及びR^5が相互に独立して各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルキルアミノ、ジ－（C_1～C_8－アルキル）アミノ、C_1～C_8－アルキルチオまたはC_2～C_8－アルケニルチオを表すか、各々随時ハロゲン、ニトロ、シアノ、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオ、C_1～C_4－ハロゲノアルキルチオ、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－ハロゲノアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチ

オを表し、
R^6及びR^7が相互に独立して水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルコキシ、C_3～C_8－アルケニルまたはC_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルを表すか、各々随時ハロゲン、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_8－アルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時C_1～C_6－アルキルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－アルキレン基を表し、
R^{13}が水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルまたはC_1～C_8－アルコキシを表すか、随時ハロゲン、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－C_1～C_4－アルキルまたはフェニル－C_1～C_4－アルコキシを表し、
R^{14}が水素またはC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}が一緒になってC_4～C_6－アルカンジイルを表し、
R^{15}及びR^{16}が同一もしくは相異なり、かつC_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}が一緒になって随時C_1～C_6－アルキル或いは随時ハロゲン、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_4－アルカンジイル基を表し、
R^{17}及びR^{18}が相互に独立して水素を表すか、随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは
R^{17}及びR^{18}がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_5～C_7－シクロアルキルを表し、そして
R^{19}及びR^{20}が相互に独立してC_1～C_{10}－アルキル、C_2～C_{10}－アルケニル、C_1～C_{10}－アルコキシ、C_1～C_{10}－アルキルアミノ、C_3～C_{10}－アルケニルアミノ、ジ－（C_1～C_{10}－アルキル）アミノまたはジ－（C_3～C_{10}－アルケニル）アミノを表す、式（Ｉ）の化合物であって、
ただし、以下の式
【化９】

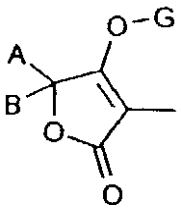


の化合物を除く上記化合物。
【請求項２】
Ｘがフッ素、塩素または臭素を表し、
Ｙがフッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルを表し、
Ｚがフッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルを表し、ここに常に基Ｙ及びＺの１つがハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表し、
Ｈｅｔが基

【化１０】

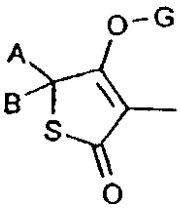


(1).



(2).

【化１１】

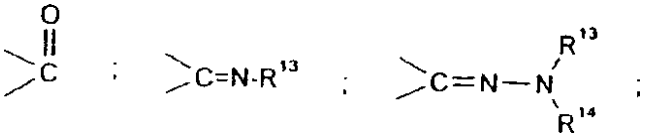


(3).

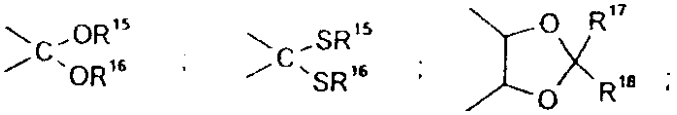
の１つを表し、
Ａが水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{10}－アルキル、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ポリ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_8－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピラゾリル、インドリル、チアゾリル、チエニルまたはフェニル－C_1～C_4－アルキルを表し、
Ｂが水素、C_1～C_{10}－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_3－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルチオ、フッ素、塩素またはフェニルで置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルまたはC_5～C_8－シクロアルケニルを表すか、
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、随時酸素または硫黄原子１または２個を含んでいてもよいアルキレンジイル或いはアルキレンジオキシまたはアルキレンジチオイル基で置換され、ここに該基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～７員の環を形成するC_5～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々随時C_1～C_5－アルキル、C_1～C_5－アルコキシ、フッ素、塩素または臭素で置換されていてもよく、かつ各々の場合に１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_5－アルカンジイル、C_3～C_5－アルケンジイルまたはブタジエンジイルを表すC_3～C_6－シクロアルキルまたはC_5～C_6－シクロアルケニルを表し、
Ｄが水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{10}－アルキル、C_3～C_6－アルケニル、C_3～C_6－アルキニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_6－アルキル、ポリ－C_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルまたはC_1～C_8－アルキルチオ－C_2～C_6－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシまたはC_1～C_2－ハロゲノアルキルで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロ

ゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、イミダゾリル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピロリル、チエニル、トリアゾリルまたはフェニル－C_1～C_4－アルキルを表すか、
A及びDが一緒になって、各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メルカプト、或いは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオ、C_3～C_6－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシで置換されていてもよいC_3～C_5－アルカンジイルまたはC_3～C_5－アルケンジイル基を表すか、或いは各々の場合に随時次の基

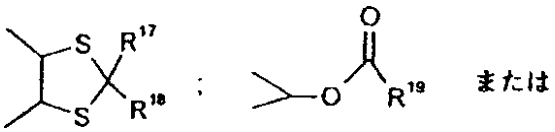
【化１２】



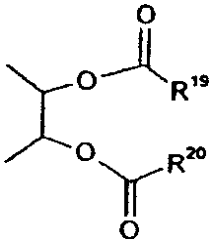
【化１３】



【化１４】

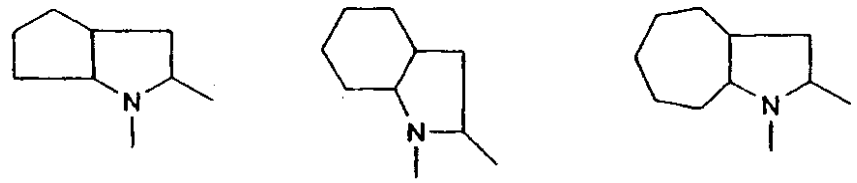


【化１５】



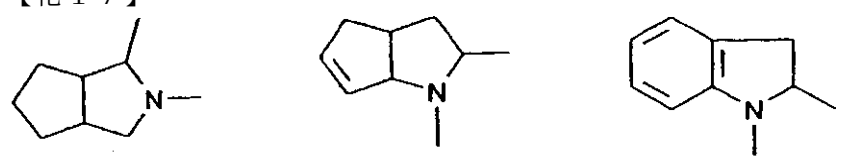
の１つが存在するか；或いは
A及びDが［式（Ｉ－１）の化合物の場合］これらのものが結合する原子と一緒になって基ＡＤ－１～ＡＤ－２７

【化１６】



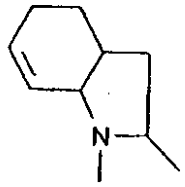
AD-1 AD-2 AD-3

【化１７】

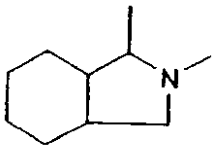


AD-4 AD-5 AD-6

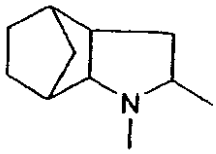
【化１８】



AD-7

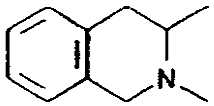


AD-8

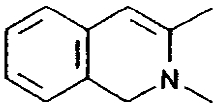


AD-9

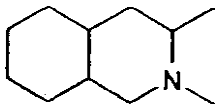
【化１９】



AD-10

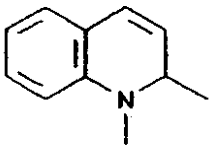


AD-11

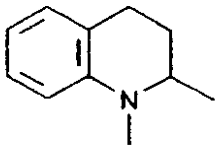


AD-12

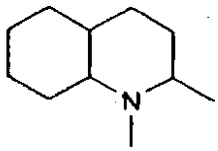
【化２０】



AD-13

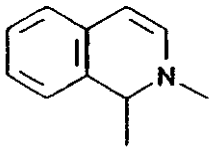


AD-14

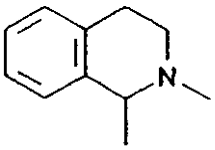


AD-15

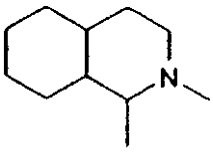
【化２１】



AD-16

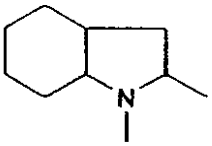


AD-17

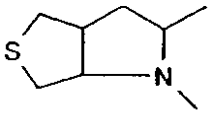


AD-18

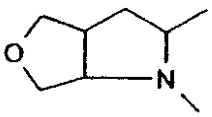
【化２２】



AD-19

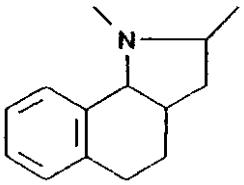


AD-20

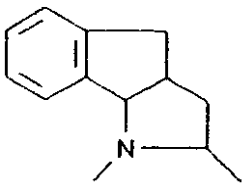


AD-21

【化２３】



AD-22

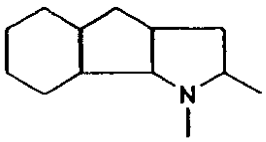


AD-23



AD-24

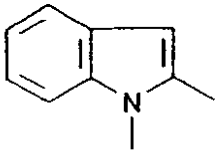
【化２４】



AD-25

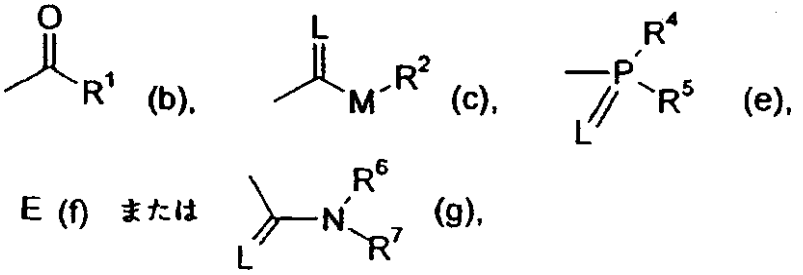


AD-26



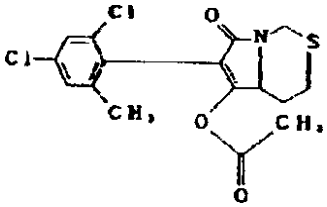
AD-27

の１つを表し、
ＧがＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に基
【化２５】



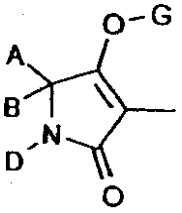
の１つを表し、ここに
Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、
Ｌは酸素または硫黄を表し、そして
Ｍは酸素または硫黄を表し、
R^1が各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{16}－アルキル、C_2～C_{16}－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルまたはポリ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、C_1～C_5－アルキルまたはC_1～C_5－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_3－ハロゲノアルキル、C_1～C_3－ハロゲノアルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオまたはC_1～C_4－アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_3－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_3－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニル－C_1～C_4－アルキルを表すか、
各々随時フッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルで置換されていてもよいピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニルまたはチエニルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルで置換されていてもよいフェノキシ－C_1～C_5－アルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、臭素、アミノまたはC_1～C_4－アルキルで置換されていてもよいピリジルオキシ－C_1～C_5－アルキル、ピリミジルオキシ－C_1～C_5－アルキルまたはチアゾリルオキシ－C_1～C_5－アルキルを表し、
R^2が各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{16}－アルキル、C_2～C_{16}－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルまたはポリ－C_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルを表すか、
随時はフッ素、塩素、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_3－アルコキシ、C_1～C_3－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_3－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^3が随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_5－アルキル、C_1～C_5－アルコキシ、C_1～C_3－ハロゲノアルキル、C_1～C_3－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^4及びR^5が相互に独立して各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－（C_1～C_6－アルキル）アミノ、C_1～C_6－アルキルチオまたはC_3～C_4－アルケニルチオを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、C_1～C_3－アルコキシ、C_1～C_3－ハロゲノ

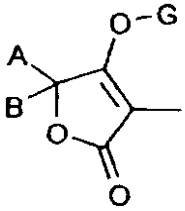
アルコキシ、C_1～C_3－アルキルチオ、C_1～C_3－ハロゲノアルキルチオ、C_1～C_3－アルキルまたはC_1～C_3－ハロゲノアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、
R^6及びR^7が相互に独立して水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_3～C_6－アルケニルまたはC_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_5－ハロゲノアルキル、C_1～C_5－アルキルまたはC_1～C_5－アルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時C_1～C_4－アルキルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－アルキレン基を表し、
R^{13}が水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシを表すか、随時フッ素、C_1～C_2－アルキルまたはC_1～C_2－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_5－アルキル、C_1～C_5－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－C_1～C_3－アルキルまたはフェニル－C_1～C_2－アルコキシを表し、
R^{14}が水素またはC_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}が一緒になってC_4～C_6－アルカンジイルを表し、
R^{15}及びR^{16}が同一もしくは相異なり、かつC_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}が一緒になって随時C_1～C_4－アルキル或いは随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_2－アルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_3－アルカンジイル基を表し、
R^{17}及びR^{18}が相互に独立して水素を表すか、随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは
R^{17}及びR^{18}がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時C_1～C_3－アルキルまたはC_1～C_3－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のアルキレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_5～C_6－シクロアルキルを表し、そして
R^{19}及びR^{20}が相互に独立してC_1～C_6－アルキル、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、C_3～C_6－アルケニルアミノ、ジ－（C_1～C_6－アルキル）アミノまたはジ－（C_3～C_6－アルケニル）アミノを表す、請求の範囲第１項記載の式（Ｉ）の化合物であって、
ただし、以下の式
【化２６】



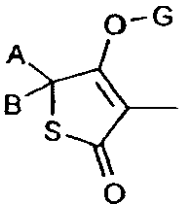
の化合物を除く上記化合物。
【請求項３】
Ｘがフッ素、塩素または臭素を表し、
Ｙがフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピルまたはイソ－プロピルを表し、
Ｚがフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピルまたはイソ－プロピルを表し、
ここに常に基Ｙ及びＺの１つがハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表し、
Ｈｅｔが基

【化２７】


(1),


(2),

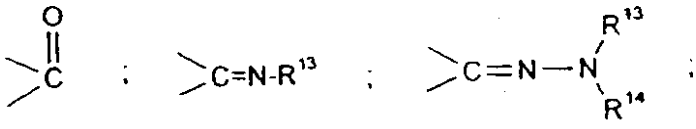
【化２８】

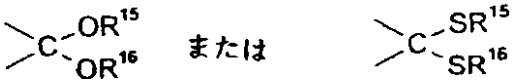

(3),

の１つを表し、
Ａが水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ８－アルキル、Ｃ２～Ｃ４－アルケニル、Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ１～Ｃ４－アルキル、ポリ－Ｃ１～Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１～Ｃ４－アルキルまたはＣ１～Ｃ６－アルキルチオ－Ｃ１～Ｃ４－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、メチルまたはメトキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ３～Ｃ６－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、ピリジルまたはベンジルを表し、
Ｂが水素、Ｃ１～Ｃ８－アルキルまたはＣ１～Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１～Ｃ２－アルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、ブチル、イソ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、シクロヘキシル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソ－プロポキシ、ブトキシ、イソ－ブトキシ、ｓ－ブトキシ、ｔ－ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、フッ素、塩素またはフェニルで置換されていてもよいＣ３～Ｃ８－シクロアルキルまたはＣ５～Ｃ８－シクロアルケニルを表すか、
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、随時酸素または硫黄原子を含んでいてもよいアルキレンジイル基或いはアルキレンジオキシ基で置換され、ここに該アルキレンジイルまたはアルキレンジオキシ基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～６員の環を形成するＣ５～Ｃ６－シクロアルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子が、２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいＣ３～Ｃ４－アルカンジイル、Ｃ３～Ｃ４－アルケンジイルまたはブタジエンジイルを表す、Ｃ３～Ｃ６－シクロアルキルまたはＣ５～Ｃ６－シクロアルケニルを表し、
Ｄが水素を表すか、直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよく、且つ各々の場合に随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ８－アルキル、Ｃ３～Ｃ４－アルケニル、Ｃ３～Ｃ４－アルキニル、Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ２～Ｃ４－アルキル、ポリ－Ｃ１～Ｃ４－アルコキシ－Ｃ２～Ｃ４－アルキル、Ｃ１～Ｃ４－アルキルチオ－Ｃ２～Ｃ４－アルキルまたはＣ３～Ｃ６－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、チエニルまたはベンジルを表すか、

Ａ及びＤが一緒になって各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メルカプト、或いは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオ、C_3～C_6－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシで置換されていてもよいC_3～C_5－アルカンジイルまたはC_3～C_5－アルケンジイル基を表すか、或いは各々の場合に随時次の基

【化２９】

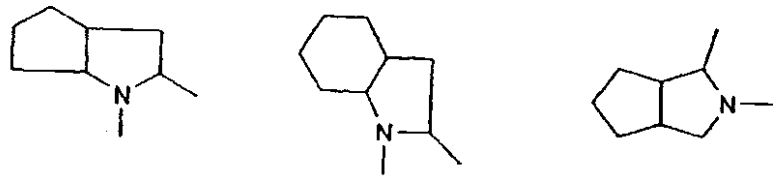




の１つが存在するか、或いは

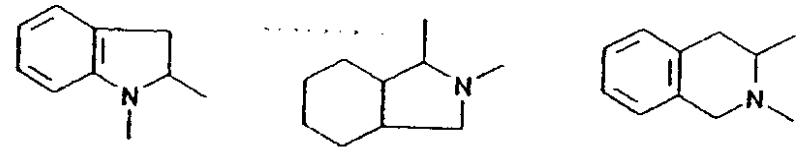
Ａ及びＤが式（Ｉ－１）の化合物の場合に、これらのものが結合する原子と一緒になって次の基

【化３０】



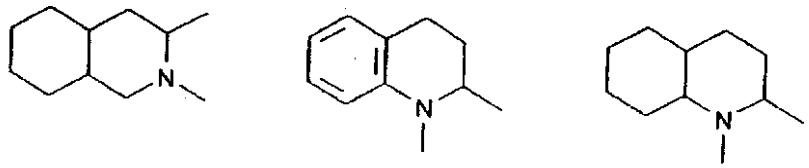
AD-1　　AD-2　　AD-4

【化３１】



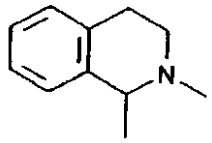
AD-6　　AD-8　　AD-10

【化３２】

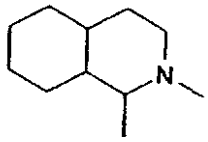


AD-12　　AD-14　　AD-15

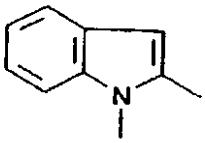
【化３３】



AD-17



AD-18

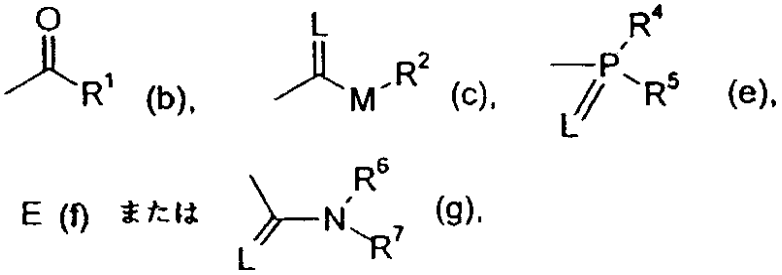


AD-27

の１つを表し、

ＧがＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）または（３）の１つを表す場合に基

【化３４】



(b), (c), (e), E (f) または (g),

の１つを表し、ここに

Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、

Ｌは酸素または硫黄を表し、そして

Ｍは酸素または硫黄を表し、

R^1が各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{14}－アルキル、C_2～C_{14}－アルケニル、C_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_4－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルまたはポリ－C_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_4－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシまたはイソ－プロポキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－シクロアルキルを表すか、

随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニルまたはエチルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、

随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいベンジルを表すか、

各々随時フッ素、塩素、臭素、メチルまたはエチルで置換されていてもよいフラニル、チエニルまたはピリジルを表すか、

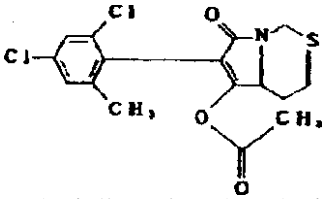
随時フッ素、塩素、臭素、メチルまたはエチルで置換されていてもよいフェノキシ－C_1～C_4－アルキルを表すか、或いは

各々随時フッ素、塩素、アミノ、メチルまたはエチルで置換されていてもよいピリジルオキシ－C_1～C_4－アルキル、ピリミジルオキシ－C_1～C_4－アルキルまたはチアゾリルオキシ－C_1～C_4－アルキルを表し、

R^2が各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{14}－アルキル、C_2～C_{14}－アルケニル、C_1～C_4－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルまたはポリ－C_1～C_4－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルを表すか、

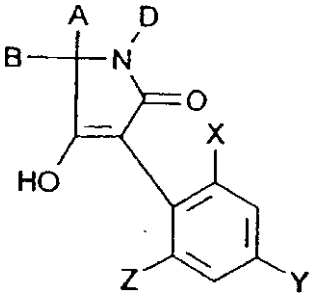
随時フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていて

もよいC_3～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、シアノ、ニトロ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^3が随時フッ素または塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、プロピル、イソ－プロピル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ｔ－ブトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^4及びR^5が相互に独立して各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－アルキルアミノ、ジ－（C_1～C_4－アルキル）アミノまたはC_1～C_4－アルキルチオを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、
R^6及びR^7が相互に独立して水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_4－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_3～C_4－アルケニルまたはC_1～C_4－アルコキシ－C_2～C_4－アルキルを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシまたはトリフルオロメチルで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時メチルまたはエチルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_5～C_6－アルキレン基を表し、
R^{13}が水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシを表すか、C_3～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソ－プロピル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、イソ－プロポキシ、ｔ－ブトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－C_1～C_2－アルキルまたはベンジルを表し、
R^{14}が水素またはC_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}が一緒になってC_4～C_6－アルカンジイルを表し、
R^{15}及びR^{16}が同一もしくは相異なり、かつメチルまたはエチルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}が一緒になって随時メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、ｎ－ブチル、イソ－ブチル、ｓ－ブチルまたはｔ－ブチル、或いは随時フッ素、塩素、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_3－アルカンジイル基を表す、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物であって、
ただし、以下の式
【化３５】



の化合物を除く上記化合物。
【請求項４】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造法であって、
式（Ｉ－１－ａ）

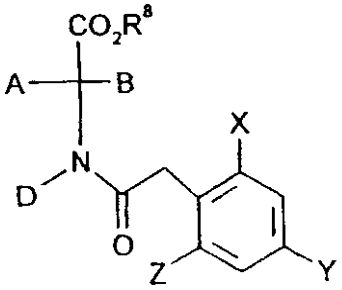
【化３６】



(I-1-a)

式中Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物が、式（ＩＩ）

【化３７】



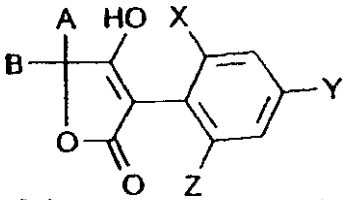
(II)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
R^8はアルキルを表す、
の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させて得られることを特徴とする、上記方法。

【請求項５】

請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
式（Ｉ－２－ａ）

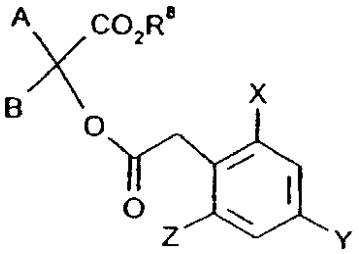
【化３８】



(I-2-a)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物が、式（ＩＩＩ）

【化３９】



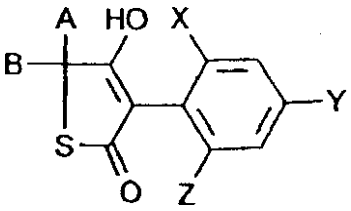
(III)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、ＹおよびＺは請求項１に記載の意味を有し、
そしてR^8はアルキルを表す
の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させて得られることを特徴とする、上記方法。

【請求項６】

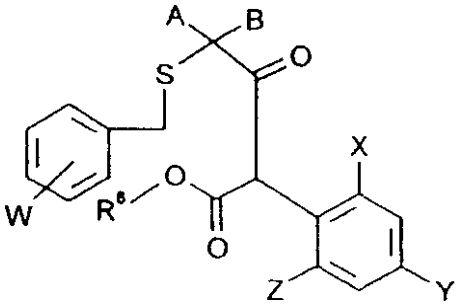
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
式（Ｉ－３－ａ）

【化４０】



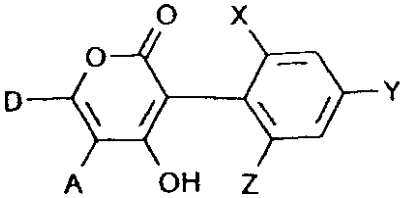
(I-3-a)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物が、式（ＩＶ）
【化４１】



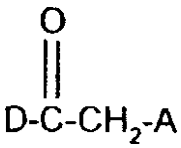
(IV)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、ＹおよびＺは請求項１に記載の意味を有し、
R^8はアルキルを表し、そして
Ｗは水素、ハロゲン、アルキルまたはアルコキシを表す、
の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び酸の存在下で分子内環化させて得られることを特徴とする、上記方法。
【請求項７】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
式（Ｉ－５－ａ）
【化４２】



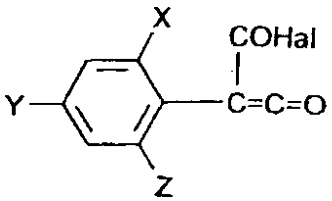
(I-5-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物が、式（ＶＩＩＩ）
【化４３】



(VIII)

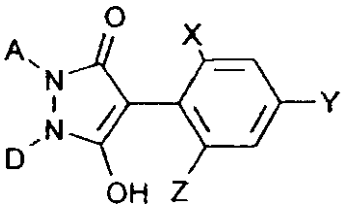
式中、Ａ及びＤは上記の意味を有する、
の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸受容体の存在下で式（Ｖ）
【化４４】



(V)

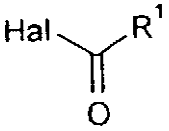
式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲンを表す、
と反応させて得られることを特徴とする、上記方法。

【請求項８】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）
【化４５】



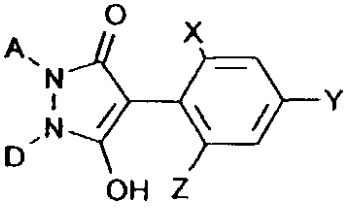
(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で
α）式（Ｘ）
【化４６】



(X)

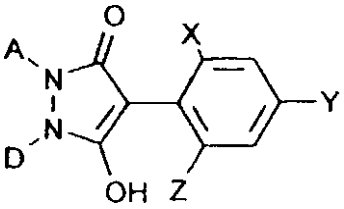
式中、R^1は請求項１に記載の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲンを表す、
の化合物または
β）式（ＸＩ）
$R^1-CO-O-CO-R^1$　　（ＸＩ）
式中、R^1は上記の意味を有する、
の無水カルボン酸と反応させることを特徴とする、上記方法。
【請求項９】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）
【化４７】



(I-4-a)

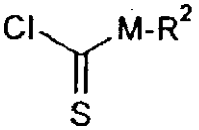
式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＩＩ）
$R^2-M-CO-Cl$　　（ＸＩＩ）
式中、R^2及びＭは請求項１に記載の意味を有する、
のクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステルと反応させることを特徴とする、上記方法。
【請求項１０】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）

【化４８】



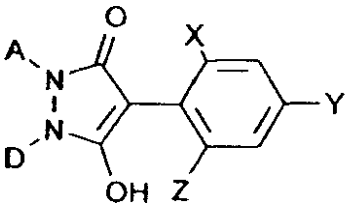
(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
α）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＩＩＩ）
【化４９】



(XIII)

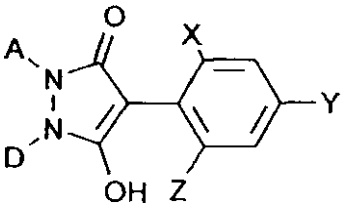
式中、M及びR^2は請求項１に記載の意味を有する、
のクロロモノチオギ酸エステルまたはクロロジチオギ酸エステルと反応させるか、または
β）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば塩基の存在下で二硫化炭素及び続いて式（ＸＩＶ）
R^2－Ｈａｌ　　（ＸＩＶ）
式中、R^2は上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素、臭素またはヨウ素を表す、
の化合物と反応させることを特徴とする、上記方法。
【請求項１１】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）
【化５０】



(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶ）
R^3－SO_2－Ｃｌ　　（ＸＶ）
式中、R^3は請求項１に記載の意味を有する、
の塩化スルホニルと反応させることを特徴とする、上記方法。
【請求項１２】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）

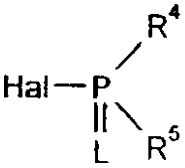
【化５１】



(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶＩ）

【化５２】



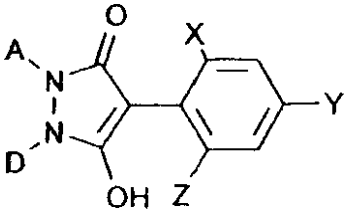
(XVI)

式中、Ｌ、R^4及びR^5は請求項１に記載の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲンを表す、
のリン化合物と反応させることを特徴とする、上記方法。

【請求項１３】

請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）

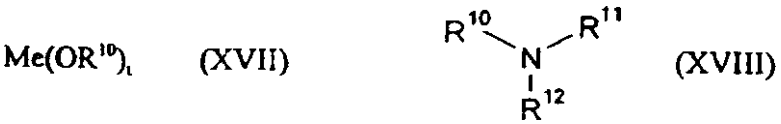
【化５３】



(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
適当ならば希釈剤の存在下で式（ＸＶＩＩ）または（ＸＶＩＩＩ）

【化５４】



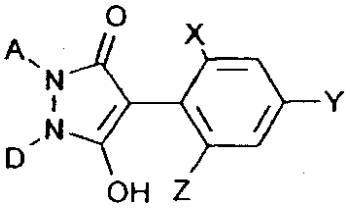
(XVII) (XVIII)

式中、Ｍｅは１または２価の金属を表し、
ｔは１または２の数を表し、そして
R^{10}、R^{11}及びR^{12}は相互に独立して水素またはアルキルを表す、
の金属化合物またはアミンと反応させることを特徴とする、上記方法。

【請求項１４】

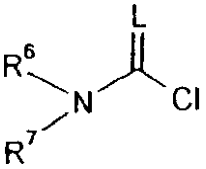
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
請求項４～７に記載の生じた式（Ｉ－１－ａ）、（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）または式（Ｉ－４－ａ）

【化５５】



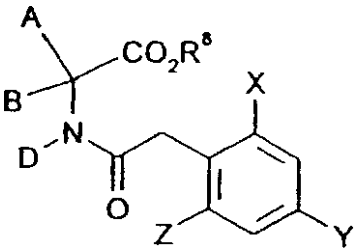
(I-4-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物を各々の場合に、
α）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば触媒の存在下で式（ＸＩＸ）
$R^6-N=C=L$　　（ＸＩＸ）
式中、R^6及びＬは請求項１に記載の意味を有する、
のイソシアネートまたはイソチオシアネートと反応させるか、または
β）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＸ）
【化５６】



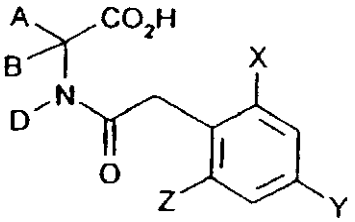
(XX)

式中、Ｌ、R^6及びR^7は請求項１に記載の意味を有する、
の塩化カルバモイルまたは塩化チオカルバモイルと反応させて得ることを特徴とする、上記方法。
【請求項１５】
式（ＩＩ）
【化５７】



(II)

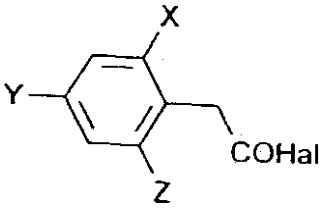
式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、
そして、
R^8はアルキルを表す、
の化合物。
【請求項１６】
式（ＸＸＩＩＩ）
【化５８】



(XXIII)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物。
【請求項１７】
式（ＸＸＩＩ）

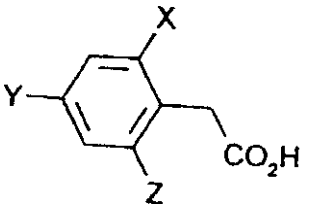
【化５９】



(XXII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素または臭素を表す、
の化合物。

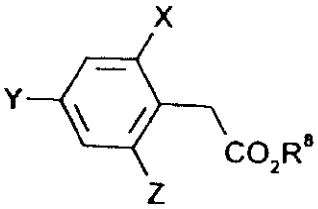
【請求項１８】
２，４－ジクロロ－６－メチルフェニル酢酸以外の式（ＸＸＶ）
【化６０】



(XXV)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物。

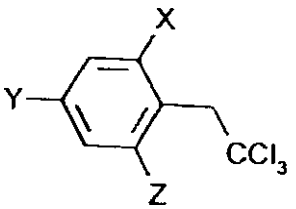
【請求項１９】
式（ＸＸＶＩ）
【化６１】



(XXVI)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、そして
R^8はアルキルを表す、
の化合物。

【請求項２０】
式（ＸＸＶＩＩ）
【化６２】

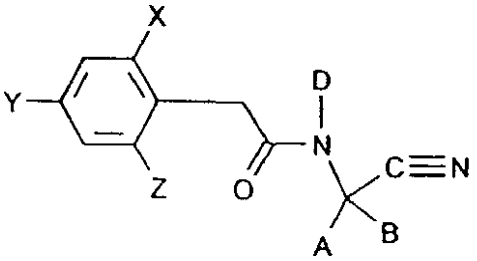


(XXVII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物。

【請求項２１】
式（ＸＸＸＩ）

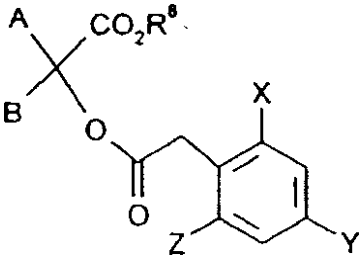
【化６３】



(XXXI)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物。

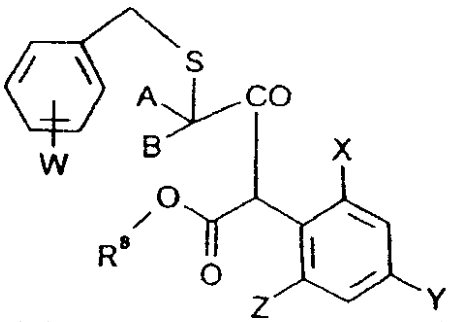
【請求項２２】
式（ＩＩＩ）
【化６４】



(III)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、
そして
R^8はアルキルを表す、
の化合物。

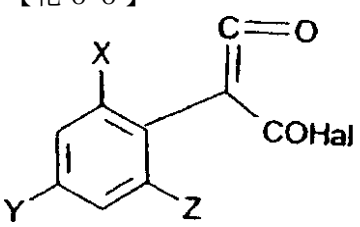
【請求項２３】
式（ＩＶ）
【化６５】



(IV)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、
Ｗは水素、ハロゲン、アルキルまたはアルコキシを表し、そして
R^8はアルキルを表す、
の化合物。

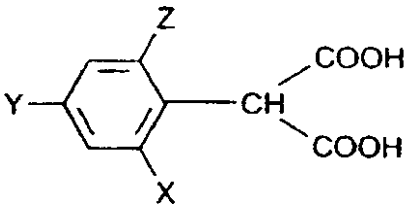
【請求項２４】
式（Ｖ）
【化６６】



(V)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素または臭素を表す、

の化合物。
【請求項２５】
式（ＸＸＸＶ）
【化６７】



(XXXV)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは請求項１に記載の意味を有する、
の化合物。
【請求項２６】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の少なくとも１種を含んでなることを特徴とする、有害生物防除剤。
【請求項２７】
有害生物を防除するための請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項２８】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を有害生物及びまたはその環境上に作用させることを特徴とする、有害生物の防除方法。
【請求項２９】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を増量剤及び／または表面活性剤と混合することを特徴とする、有害生物防除剤の製造方法。
【請求項３０】
有害生物防除剤を製造するための請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項３１】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の少なくとも１種を含んでなることを特徴とする、除草剤。
【請求項３２】
雑草を防除するための請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項３３】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を雑草及び／またはその環境上に作用させることを特徴とする、雑草の防除方法。
【請求項３４】
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を増量剤及び／または表面活性剤と混合することを特徴とする、除草剤の製造方法。
【請求項３５】
除草剤を製造するための請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【発明の詳細な説明】
本発明は、新規なフェニル置換された環式ケトエノール、その複数の製造方法及び中間体、並びにその有害生物防除剤及び除草剤としての使用に関する。
３－アシル－ピロリジン－２，４－ジオンは製薬学的特性を有するものとして既に開示されている［S.Suzuki et al.Chem.Pharm.Bull.15 1120（1967）］。更に、Ｎ－フェニルピロリジン－２，４－ジオンはR.Schmierer及びH.Mildenbergerにより合成された（Liebigs Ann.Chem.1985,1095）が、これらの化合物の生物学的活性は記載されていない。
ヨーロッパ特許出願公開第０，２６２，３９９号及び英国特許出願公第２，２６６，８８８号に同様の構造の化合物（３－アリール－ピロリジン－２，４－ジオン）が開示されているが、除草、殺虫または殺ダニ（acaricidal）作用を有するものとしては開示されていない。除草、殺虫または殺ダニ作用を有する未置換の、二環式の３－アリール－ピロリジン－２，４－ジオン誘導体（ヨーロッパ特許出願公開第３５５，５９９号及び同第４１５

，２１１号）及び置換された一環式の３－アリール－ピロリジン－２，４－ジオン誘導体（ヨーロッパ特許出願公開第３７７，８９３号及び同第４４２，０７７号）は公知である。

また多環式の３－アリールピロリジン－２，４－ジオン誘導体（ヨーロッパ特許出願公開第４４２，０７３号）及び１Ｈ－アリールピロリジン－ジオン誘導体（ヨーロッパ特許出願公開第４５６，０６３号、同第５２１，３３４号、同第５９６，２９８号、同第６１３，８８４号、同第６１３，８８５号、ＷＯ　９４／０１，９９７、ＷＯ　９３／２６，９５４及びＷＯ　９５／０１，３５８）も公知である。

ある種の置換された$\triangle^3$－ジヒドロフラン－２－オン誘導体が除草特性を有することは公知である（ドイツ国特許出願公開第４，０１４，４２０号参照）。また出発化合物として用いるテトロン酸誘導体［例えば３－（２－メチル－フェニル）－４－ヒドロキシ－５－（４－フルオロフェニル）－$\triangle^3$－ジヒドロフラン－２－オン］の合成はドイツ国特許出願公開第４，０１４，４２０号に開示されている。類似の構造の化合物がCampbell et al.,J.Chem.Soc.,Perkin Trans.1,1985,（8）1567～76の刊行物から公知であるが、殺虫及び／または殺ダニ活性については開示されていない。更に除草、殺ダニ及び殺虫特性を有する３－アリール－$\triangle^3$－ジヒドロフラノン誘導体はヨーロッパ特許出願公開第５２８，１５６号から公知であるが、この刊行物に記載された作用は必ずしも十分ではない。チオテトロン酸はＷＯ　９５／２６３４５から公知である。

更に、ある３Ｈ－ピラゾール誘導体、例えば１，２－ジエチル－１，２－ジヒドロ－５－ヒドロキシ－４－フェニル－３Ｈ－ピラゾル－３－オン、｛［５－オキソ－１，２－ジフェニル－４－（ｐ－スルホフェニル）－３－ピラゾリン－３－イル］－オキシ｝二ナトリウム塩またはｐ－（３－ヒドロキシ－５－オキソ－１，２－ジフェニル－３－ピラゾリン－４－イル）－ベンゼンスルホン酸は文献［J.Heterocycl.Chem.,25（5）,1301～1305,1988またはJ.Heterocycl.Chem.,25（5）,1307～1310,1988またはZh.Obshch.Khim.,34（7）,2397～2402,1964参照］から公知である。しかしながら、これらの化合物の生物学的作用は開示されていない。

更に４，４’，４”－（５－ヒドロキシ－３－オキソ－１Ｈ－ピラゾル－１，２，４（３Ｈ）－トリイル）－トリス－ベンゼンスルホン酸の三ナトリウム塩が薬学的特性を有することは公知である［Farmakol.Tokisikol.（Moscow）,38（2）,180～186,1976参照］。しかしながら、その植物保護における使用は公知ではない。

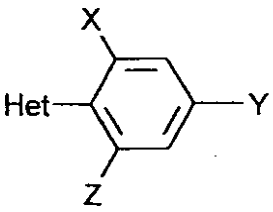
更に、除草、殺ダニ及び殺虫特性を有する４－アリールピラゾリジン－３，５－ジオンはヨーロッパ特許出願公開第５０８，１２６号及びＷＯ　９２／１６，５１０に開示されている。

フェニル環において未置換である、ある種のフェニル－ピロン誘導体は既に開示されているが［A.M.Chirazi,T.Kappe and E.Ziegler,Arch.Pharm.309,558（1976）及びK.-H.Boltze and K.Heidenbluth,Chem.Ber.91,2849参照］、これらの化合物の有害生物防除剤としての有能な使用は開示されていない。フェニル環において置換され、そして除草、殺ダニ及び殺虫特性を有するフェニル－ピロン誘導体はヨーロッパ特許出願公開第５８８，１３７号に開示されている。

フェニル環において未置換である、ある種の５－フェニル－１，３－チアジン誘導体は既に開示されているが［E.Ziegler and E.Steiner,Monatsh.95,147（1964）R.Ketcham,T.Kappe and E.Ziegler,J.Heterocycl.Chem.10,223（1973）］、これらの化合物の有害生物防除剤としての使用の可能性は記載されていない。フェニル環において置換され、そして除草、殺ダニ及び殺虫特性を有する５－フェニル－１，３－チアジン誘導体はＷＯ　９４／１４，７８５に開示されている。

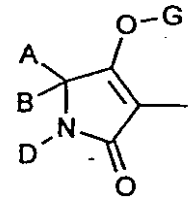
しかしながら、これらの化合物の作用の活性及びスペクトルは殊に低い施用割合及び濃度では必ずしも完全には満足できるものではない。更に、公知の化合物の植物による許容性も必ずしも十分ではない。

式（Ｉ）

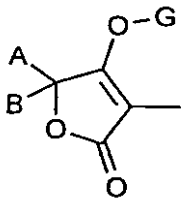


(I)

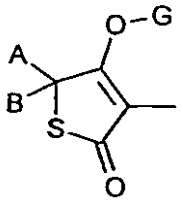
式中、Ｘはハロゲンを表し、
Ｙはハロゲンまたはアルキルを表し、
Ｚはハロゲンまたはアルキルを表し、
但し、常に基Ｙ及びＺの１つはハロゲンを表し、そして他のものはアルキルを表し、
Ｈｅｔは基



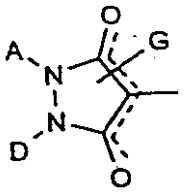
(1),



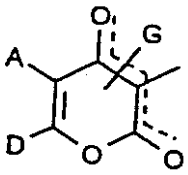
(2),



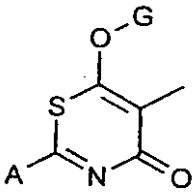
(3),



(4),

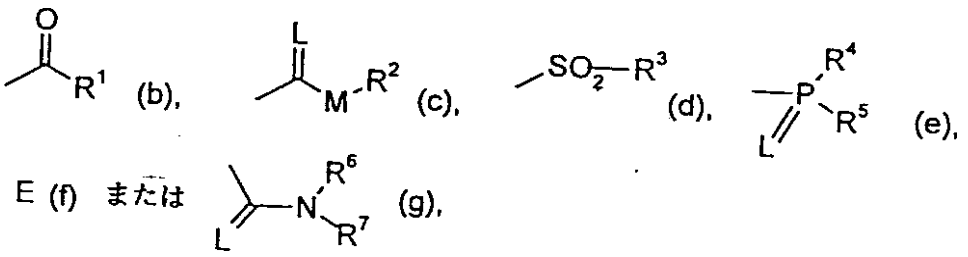


(5),

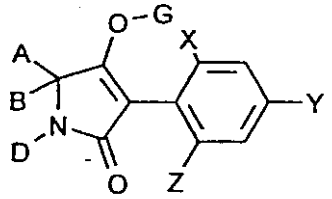


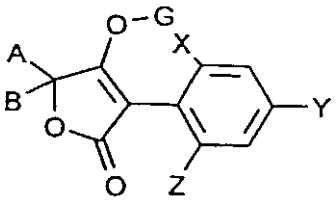
(6),

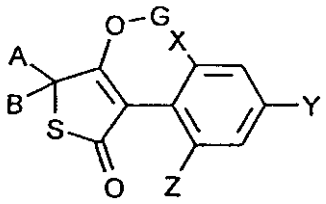
の１つを表し、ここに
Ａは水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、ポリアルコキシアルキルまたはアルキルチオアルキルを表すか、各々の場合に飽和もしくは不飽和の、随時置換されていてもよいシクロアルキルまたは複素環を表すか、或いは各々随時ハロゲン、アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいアリール、アリールアルキルまたはヘタリールを表し、
Ｂは水素、アルキルまたはアルコキシアルキルを表すか、或いは
Ａ及びＢはこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって飽和もしくは不飽和の、随時置換されていてもよい炭素環または複素環を表し、
Ｄは水素或いはアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、ポリアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、飽和もしくは不飽和のシクロアルキル、飽和もしくは不飽和の複素環、アリールアルキル、アリール、ヘタリールアルキルまたはヘタリールよりなる群から選ばれる、随時置換されていてもよい基を表すか或いは
Ａ及びＤはこれらのものが結合する原子と一緒になって飽和もしくは不飽和の、随時置換されていてもよい炭素環または複素環を表し、
ＧはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（５）または（６）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（４）、（５）または（６）の１つを表す場合に基

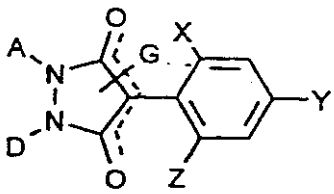


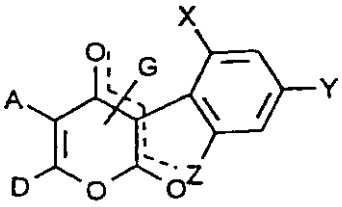
の１つを表し、ここに
Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、
Ｌは酸素または硫黄を表し、
Ｍは酸素または硫黄を表し、
R^1は各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキルまたはポリアルコキシアルキルを表すか、各々随時ハロゲン、アルキルまたはアルコキシで置換されていてもよいシクロアルキルまたは複素環を表すか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、フェニルアルキル、ヘタリール、フェノキシアルキルまたはヘタリールオキシアルキルを表し、
R^2は各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキルまたはポリアルコキシアルキルを表すか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいシクロアルキル、フェニルまたはベンジルを表し、
R^3、R^4及びR^5は相互に独立して各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、アルケニルチオまたはシクロアルキルチオを表すか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ベンジル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、
R^6及びR^7は相互に独立して水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルコキシまたはアルコキシアルキルを表すか、各々の場合に随時置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いはこれらのものが結合するＮ原子と一緒になって随時酸素または硫黄を含んでいてもよい随時置換されていてもよい環を表す、
の新規な化合物が見いだされた。
置換基の特性に依存して、式（Ｉ）の化合物は必要に応じて常法により分離し得る幾何及び／または光学異性体または種々の構成の異性体混合物として存在し得る。純粋な異性体及び異性体混合物、その製造及び使用、並びにこのものからなる組成物は全て本発明の目的である。しかしながら、簡単のために次の教示においては常に純粋な化合物を意味するものと理解されるが式（Ｉ）の化合物及び適当ならばまた種々の比率の異性体化合物を含む混合物が挙げられる。
基Ｈｅｔの意味（１）～（６）を考慮して、次の主な構造式（Ｉ－１）～（Ｉ－６）が生じる：

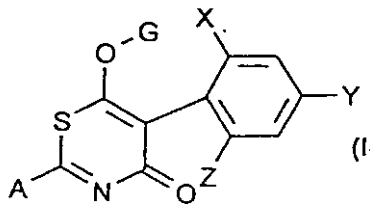

(I-1),


(I-2),


(I-3),


(I-4),

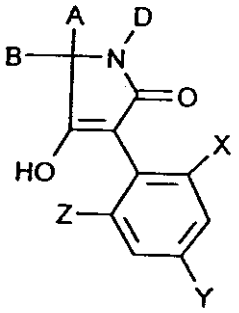

(I-5),


(I-6),

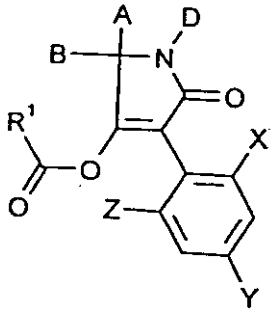
式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｇ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する。

基Ｇの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（１）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－１－ｇ）が生じる：

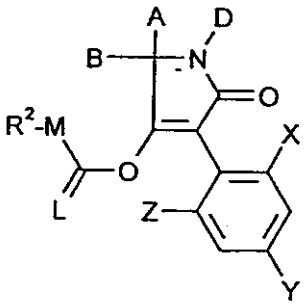
(I-1-a):



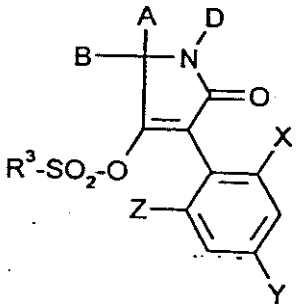
(I-1-b):



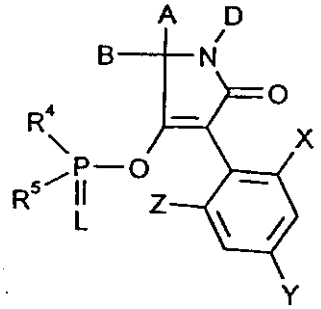
(I-1-c):



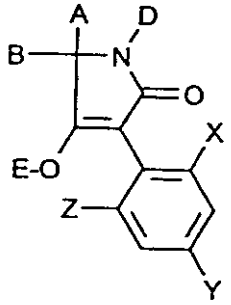
(I-1-d):



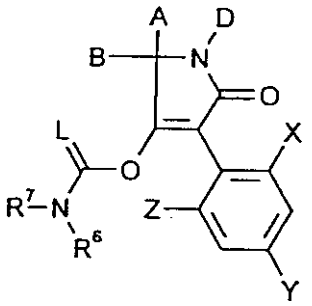
(I-1-e):



(I-1-f):



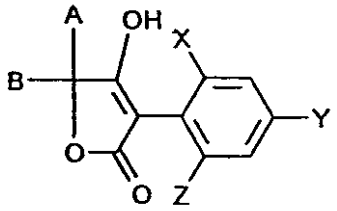
(I-1-g):



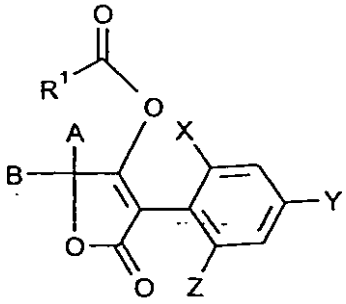
式中、A、B、D、E、L、M、X、Y、Z、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は上記の意味を有する。

基Gの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（２）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－２－ａ）～（Ｉ－２－ｇ）が生じる：

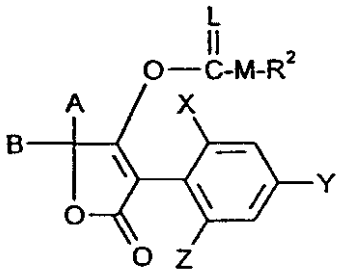
(I-2-a):



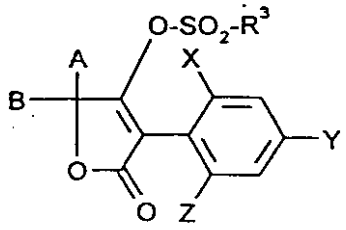
(I-2-b):



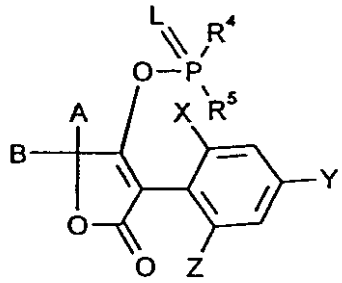
(I-2-c):



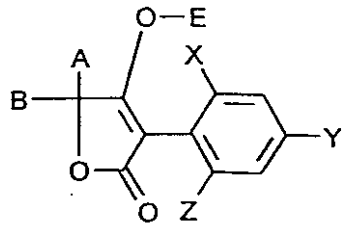
(I-2-d):



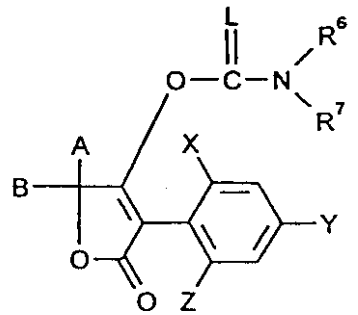
(I-2-e):



(I-2-f):



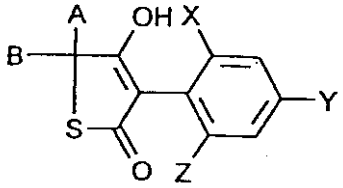
(I-2-g):



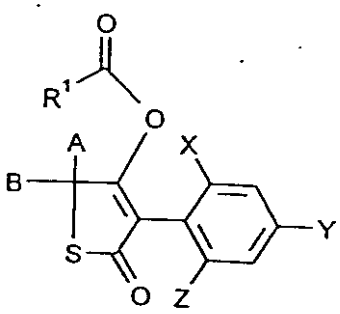
式中、A、B、E、L、M、X、Y、Z、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は上記の意味を有する。

基Gの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（３）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－３－ａ）～（Ｉ－３－ｇ）が生じる：

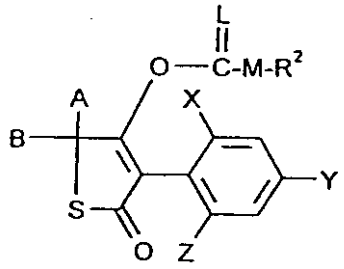
(I-3-a):



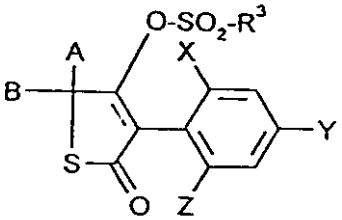
(I-3-b):



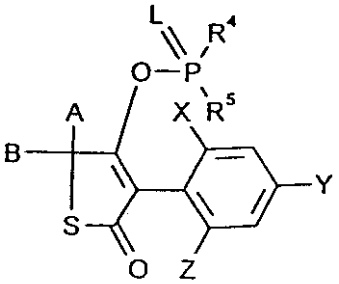
(I-3-c):



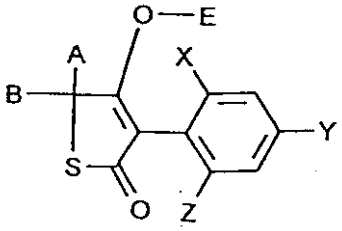
(I-3-d):



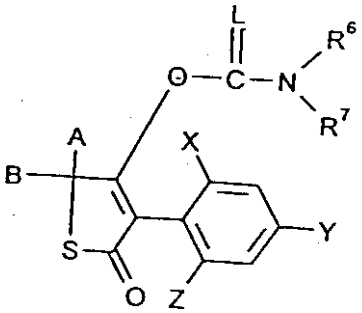
(I-3-e):



(I-3-f):

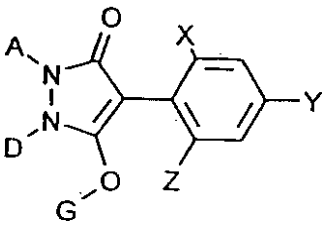


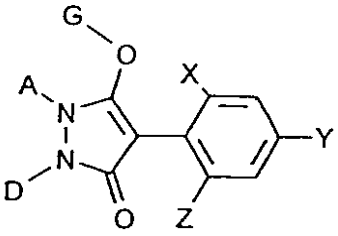
(I-3-g):



式中、A、B、E、L、M、X、Y、Z、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は上記の意味を有する。

置換基Gの位置に依存して、式（Ｉ－４）の化合物は式（Ｉ－４）において破線により示される式（Ｉ－４）$_a$及び（Ｉ－４）$_b$


(I-4)a


(I-4)b,

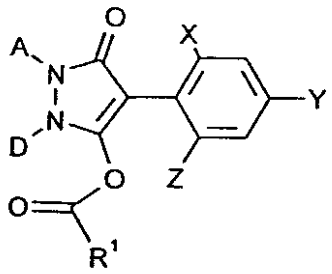
の２つの異性体形で存在し得る。

式（Ｉ－４）$_a$及び（Ｉ－４）$_b$の化合物は混合物及びまたその純粋な異性体の形態で存在し得る。適当ならば、式（Ｉ－４）$_a$及び（Ｉ－４）$_b$の化合物の混合物はそれ自体公知であるような物理的方法、例えばクロマトグラフィー法により分離し得る。

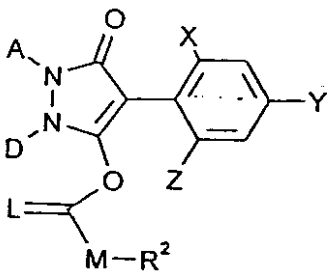
簡単のために、各々の場合に可能である異性体の１つのみを次の教示に与える。このことは適当ならば、化合物が異性体混合物の形態またはそれぞれの他の異性体形で存在し得ることを排除するものではない。

基Ｇの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（４）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－４－ｂ）～（Ｉ－４－ｇ）が生じる：

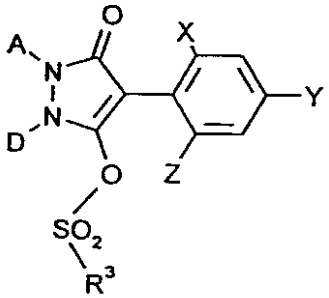
(I-4-b):



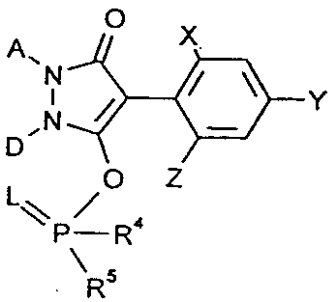
(I-4-c):



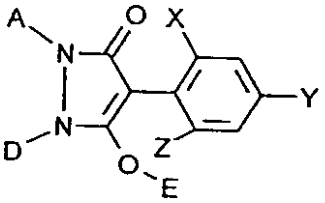
(I-4-d):



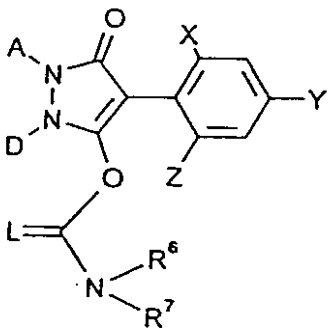
(I-4-e):



(I-4-f):

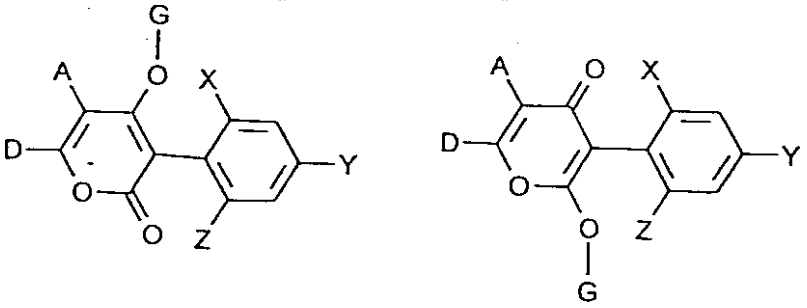


(I-4-g):



式中、Ａ、Ｄ、Ｅ、Ｌ、Ｍ、Ｘ、Ｙ、Ｚ、Ｒ^1、Ｒ^2、Ｒ^3、Ｒ^4、Ｒ^5、Ｒ^{6}及びＲ^{7}は上記の意味を有する。

置換基Ｇの位置に依存して、式（Ｉ－５）の化合物は式（Ｉ－５）において破線により示される式（Ｉ－５）$_a$及び（Ｉ－５）$_b$



$(I\text{-}5)_a$ $(I\text{-}5)_b$

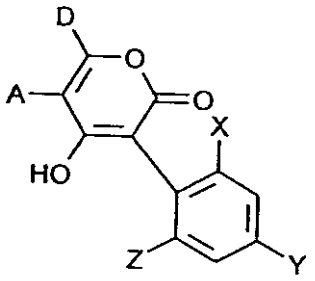
の２つの異性体形で存在し得る。

式（Ｉ－５）$_a$及び（Ｉ－５）$_b$の化合物は混合物及びまたその純粋な異性体の形態で存在し得る。適当ならば、式（Ｉ－５）$_a$及び（Ｉ－５）$_b$の化合物の混合物はそれ自体公知であるような物理的方法、例えばクロマトグラフィー法により分離し得る。

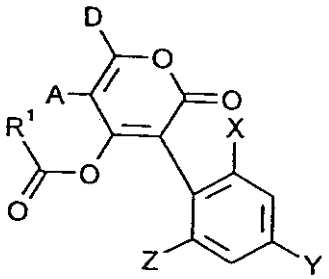
簡単のために、各々の場合に可能である異性体の１つのみを次の教示に与える。このことは適当ならば、化合物が異性体混合物の形態またはそれぞれの他の異性体形で存在し得ることを排除するものではない。

基Ｇの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（５）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－５－ａ）～（Ｉ－５－ｇ）が生じる：

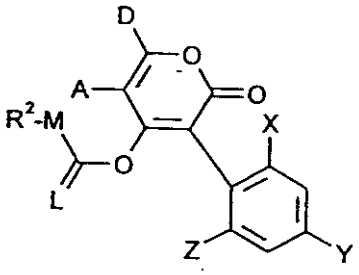
(I-5-a):



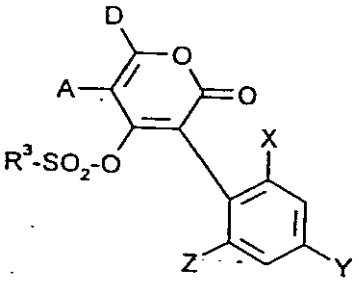
(I-5-b):



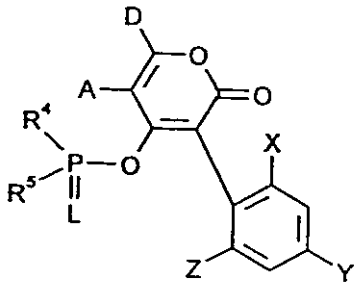
(I-5-c):



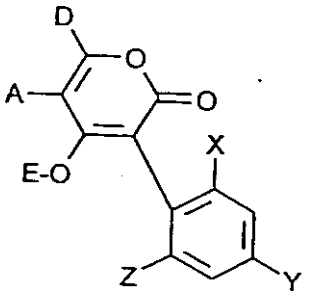
(I-5-d):



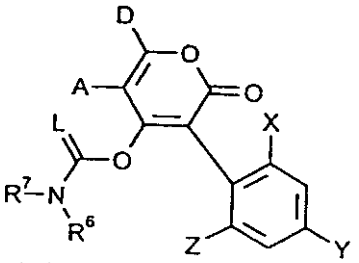
(I-5-e):



(I-5-f):



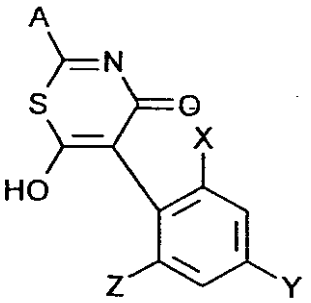
(I-5-g):



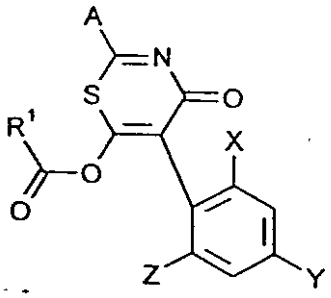
式中、A、D、E、L、M、X、Y、Z、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は上記の意味を有する。

基Gの種々の意味（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）を考慮して、Ｈｅｔがグループ（６）を表す場合、次の主な構造式（Ｉ－６－ａ）～（Ｉ－６－ｇ）が生じる：

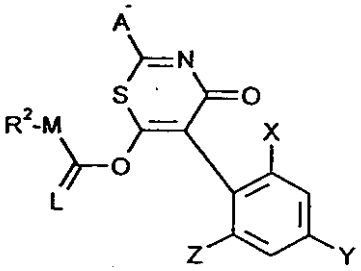
(I-6-a):



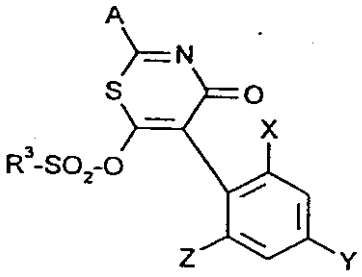
(I-6-b):



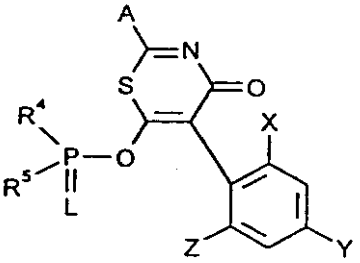
(I-6-c):



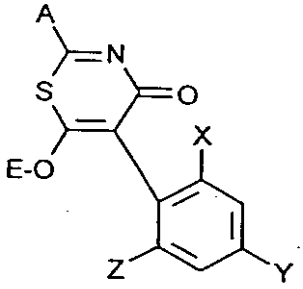
(I-6-d):



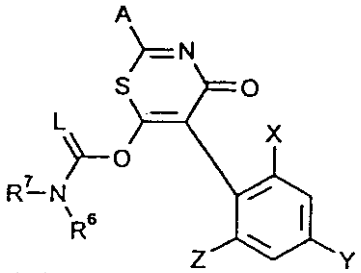
(I-6-e):



(I-6-f):



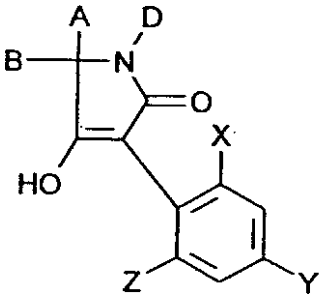
(I-6-g):



式中、A、E、L、M、X、Y、Z、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は上記の意味を有する。

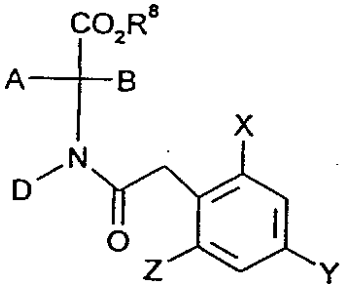
更に、式（Ｉ）の新規な化合物が下記の方法の１つにより得られることが見いだされた：

（Ａ）式（Ｉ－１－ａ）



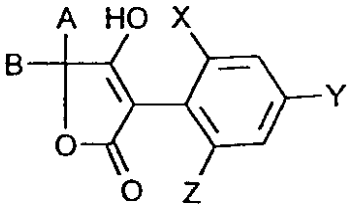
(I-1-a)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物が式（ＩＩ）



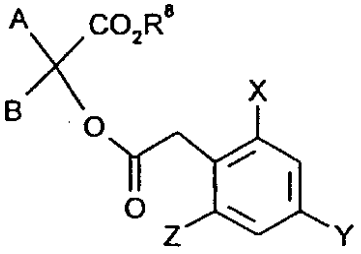
(II)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そしてＲ^{8}はアルキル（好ましくはメチル）を表す、
の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させる場合に得られる。
（Ｂ）更に、式（Ｉ－２－ａ）



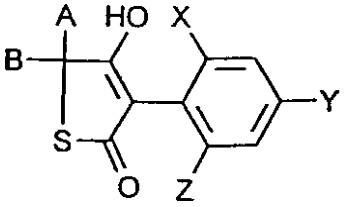
(I-2-a)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物が式（ＩＩＩ）



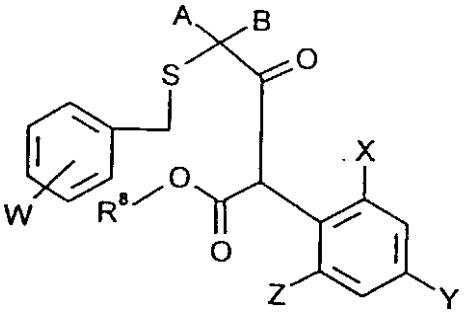
(III)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びＲ^{8}は上記の意味を有する、
の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させる場合に得られることが見いだされた。
（Ｃ）更に、式（Ｉ－３－ａ）



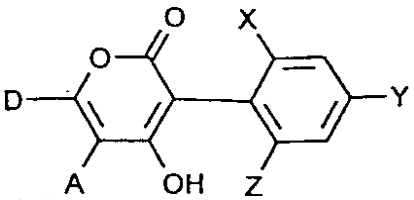
(I-3-a)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物が式（ＩＶ）



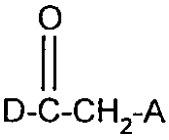
(IV)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有し、そして
Ｗは水素、ハロゲン、アルキル（好ましくはC_1～C_6－アルキル）またはアルコキシ（好ましくはC_1～C_8－アルコキシ）を表す、
の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び酸の存在下で分子内環化させる場合に得られることが見いだされた。
（Ｅ）更に、式（Ｉ－５－ａ）



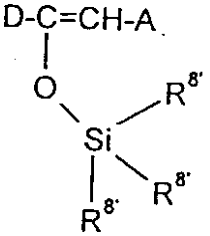
(I-5-a)

式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物が式（ＶＩＩＩ）



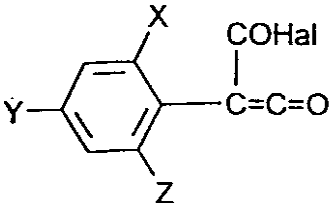
(VIII)

式中、Ａ及びＤは上記の意味を有する、
の化合物または式（ＶＩＩＩａ）



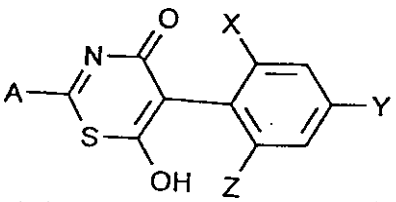
(VIIIa)

式中、Ａ及びＤは上記の意味を有し、そして
R^8はアルキル（好ましくはメチル）を表す、
のそのシリルエノールエーテルを適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸受容体の存在下で式（Ｖ）



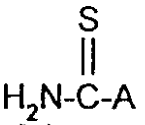
(V)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲン（好ましくは塩素または臭素）を表す、
と反応させる場合に得られることが見いだされた。
（Ｆ）更に、式（Ｉ－６－ａ）



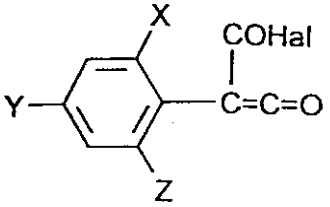
(I-6-a)

式中、Ａ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物が式（ＩＸ）



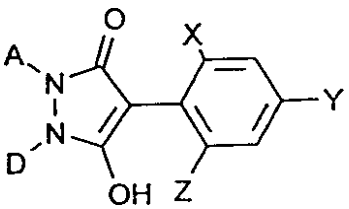
(IX)

式中、Ａは上記の意味を有する、
の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸受容体の存在下で式（Ｖ）



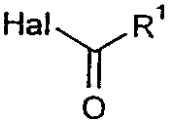
(V)

式中、Ｈａｌ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物と反応させる場合に得られることが見いだされた。
更に、
（Ｇ）Ａ、Ｂ、Ｄ、R^1、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ｂ）～（Ｉ－３－ｂ）、（Ｉ－５－ｂ）及び（Ｉ－６－ｂ）の化合物が、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－３－ａ）、（Ｉ－５－ａ）及び（Ｉ－６－ａ）の化合物を、そしてＡ、Ｄ、R^1、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－４－ｂ）の化合物が式（Ｉ－４－ａ）



(I-4-a)

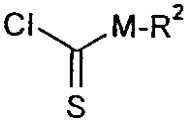
式中、Ａ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で
α）式（Ｘ）



(X)

式中、R^1は上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲン（殊に塩素または臭素）を表す、
の化合物または
β）式（ＸＩ）
R^1－ＣＯ－Ｏ－ＣＯ－R^1　　（ＸＩ）
式中、R^1は上記の意味を有する、
の無水カルボン酸と反応させる場合に得られるか；
（Ｈ）Ａ、Ｂ、Ｄ、R^2、Ｍ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有し、そしてＬが酸素を表す上記の式（Ｉ－１－ｃ）～（Ｉ－６－ｃ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＩＩ）
R^2－Ｍ－ＣＯ－Ｃｌ　　（ＸＩＩ）

式中、R^2及びMは上記の意味を有する、
のクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステルと反応させる場合に得られるか；
（Ｉ）Ａ、Ｂ、Ｄ、R^2、Ｍ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有し、そしてＬが酸素を表す上記の式（Ｉ－１－ｃ）～（Ｉ－６－ｃ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に
α）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＩＩＩ）



(XIII)

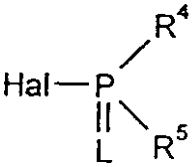
式中、Ｍ及びR^2は上記の意味を有する、
のクロロモノチオギ酸エステルまたはクロロジチオギ酸エステルとか、または
β）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば塩基の存在下で二硫化炭素及び続いて式（ＸＩＶ）

R^2－Ｈａｌ　　（ＸＩＶ）

式中、R^2は上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素、臭素またはヨウ素を表す、
の化合物と反応させる場合に得られるか、
（Ｊ）Ａ、Ｂ、Ｄ、R^3、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ｄ）～（Ｉ－６－ｄ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶ）

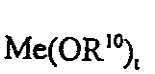
R^3－SO_2－Ｃｌ　　（ＸＶ）

式中、R^3は上記の意味を有する、
の塩化スルホニルと反応させる場合に得られるか、
（Ｋ）Ａ、Ｂ、Ｄ、R^4、R^5、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ｅ）～（Ｉ－６－ｅ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶＩ）

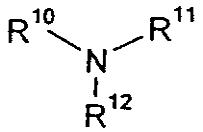


(XVI)

式中、Ｌ、R^4及びR^5は上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲン（殊に塩素または臭素）を表す、
のリン化合物と反応させる場合に得られるか、
（Ｌ）Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｅ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ｆ）～（Ｉ－６－ｆ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下で式（ＸＶＩＩ）または（ＸＶＩＩＩ）



(XVII)



(XVIII)

式中、Ｍｅは１または２価の金属（好ましくはアルカリ金属またはアルカリ土金属例えばリチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウムまたはカルシウム）を表し、
ｔは１または２の数を表し、そして
R^{10}、R^{11}及びR^{12}は相互に独立して水素またはアルキル（好ましくはC_1～C_8－アルキル）を表す、
の金属化合物またはアミンと反応させる場合に得られるか、

（Ｍ）Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｌ、R^6、R^7、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する上記の式（Ｉ－１－ｇ）～（Ｉ－６－ｇ）の化合物がＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺが上記の意味を有する式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に

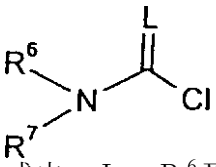
α）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば触媒の存在下で式（ＸＩＸ）

$R^6-N=C=L$　　（ＸＩＸ）

式中、R^6及びＬは上記の意味を有する、

のイソシアネートまたはイソチオシアネートとか、または

β）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＸ）



(XX)

式中、Ｌ、R^6及びR^7は上記の意味を有する、

の塩化カルバモイルまたは塩化チオカルバモイルと反応させる場合に得られることが見いだされた。

更に、式（Ｉ）の新規な化合物は有害生物防除剤、好ましくは殺虫剤、殺ダニ剤（acaricides）及びまた除草剤としての極めて良好な活性を有する。

式（Ｉ）は本発明の化合物の一般的定義を与える。上記及び下記の式中に示される好適な置換基または基の範囲を次に示す：

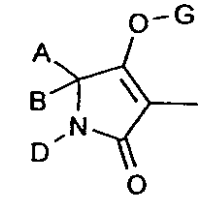
Ｘは好ましくはハロゲンを表す。

Ｙは好ましくはハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルを表す。

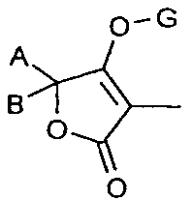
Ｚは好ましくはハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルを表す。

置換基Ｙ及びＺの１つは常にハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表す。

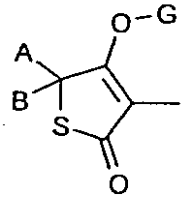
Ｈｅｔは好ましくは基



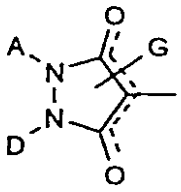
(1),



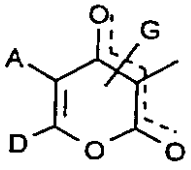
(2),



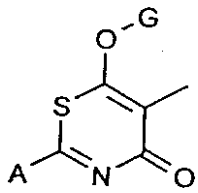
(3),



(4),



(5),



(6).

の１つを表す。

Ａは好ましくは水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{12}－アルキル、C_2～C_8－アルケニル、C_1～C_{10}－アルコキシ－C_1～C_8－アルキル、ポリ－C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルキルまたはC_1～C_{10}－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルを表すか、随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いはフェ

ニル、ナフチル、フェニル－C_1～C_6－アルキル、ナフチル－C_1～C_6－アルキル、あるいは環原子５または６個を有し且つ酸素、硫黄及び窒素よりなる群からのヘテロ原子３個を有するヘタリールを表し、各々の場合に随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよい。

Ｂは好ましくは水素、C_1～C_{12}－アルキルまたはC_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルを表すか、

Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、好ましくはメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時C_1～C_8－アルキル、C_3～C_{10}－シクロアルキル、C_1～C_8－ハロゲノアルキル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルキルチオ、ハロゲンまたはフェニルで置換されていてもよいC_3～C_{10}－シクロアルキルまたはC_5～C_{10}－シクロアルケニルを表すか、

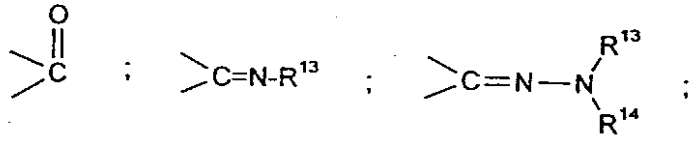
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、好ましくは随時酸素及び／または硫黄原子１または２個を含んでいてもよいアルキレンジイル或いはアルキレンジオキシまたはアルキレンジチオイル基で置換され、ここに該基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～８員の環を形成するC_5～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは

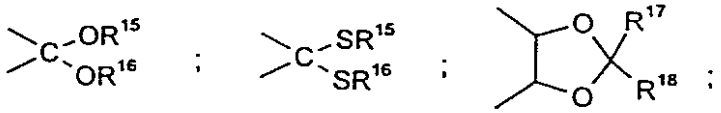
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、好ましくは２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々随時C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシまたはハロゲンで置換されていてもよく、かつ各々の場合に１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－アルカンジイル、C_3～C_6－アルケンジイルまたはC_4～C_6－アルカンジエンジイルを表すC_3～C_8－シクロアルキルまたはC_5～C_8－シクロアルケニルを表す。

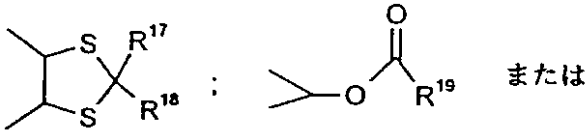
Ｄは好ましくは水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{12}－アルキル、C_3～C_8－アルケニル、C_3～C_8－アルキニル、C_1～C_{10}－アルコキシ－C_2～C_8－アルキル、ポリ－C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルまたはC_1～C_{10}－アルキルチオ－C_2～C_8－アルキルを表すか、随時ハロゲン、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシまたはC_1～C_4－ハロゲノアルキルで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いはフェニル、環原子５～６個を有しかつ酸素、硫黄及び窒素よりなる群からのヘテロ原子１または２個を有するヘタリール、フェニル－C_1～C_6－アルキル或いは環原子５～６個を有しかつ酸素、硫黄及び窒素よりなる群からのヘテロ原子１または２個を有するヘタリール－C_1～C_6－アルキルを表し、各々の場合に随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいか、

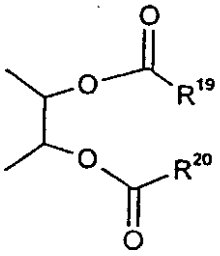
Ａ及びＤは一緒になって、好ましくは１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ各々の場合に随時ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{10}－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルチオ、C_3～C_7－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシ、或いは更に融合環を形成し、かつ各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時C_1～C_6－アルキルで置換されていてもよいか、または２個の隣接する置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時更に５または６環原子を有する飽和もしくは不飽和の炭素環を形成してもよいC_3～C_6－アルカンジイル、C_3～C_6－アルケンジイルまたはC_4～C_6－アルカンジエンジイル基で置換されていてもよいC_3～C_6－アルカンジイル、C_3～C_6－アルケンジイルまたはC_4～C_6－アルカンジエンジイル基を表すか、或いは

Ａ及びＤは一緒になって各々次の基



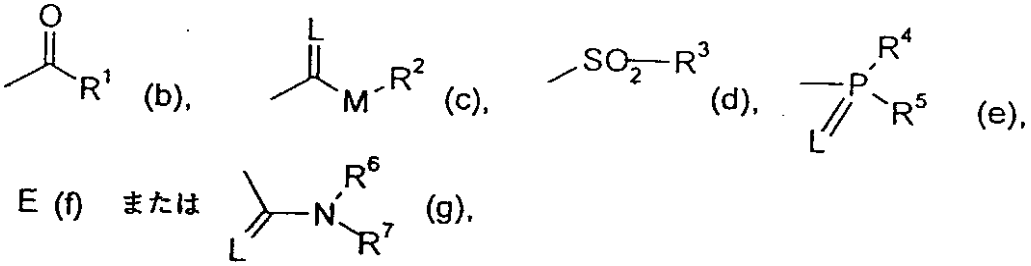






の１つが随時存在していてもよいＣ$_3$～Ｃ$_6$－アルカンジイルまたはＣ$_3$～Ｃ$_6$－アルケンジイル基を表す。

Ｇは好ましくはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（５）または（６）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（４）、（５）または（６）の１つを表す場合に基



の１つを表し、ここに

Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、

Ｌは酸素または硫黄を表し、そして

Ｍは酸素または硫黄を表す。

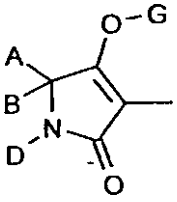
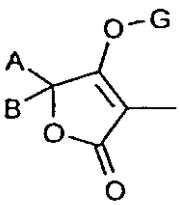
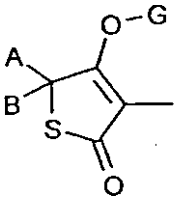
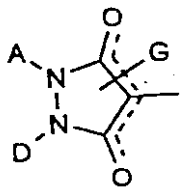
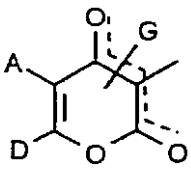
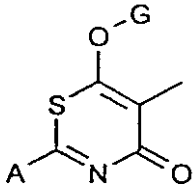
Ｒ^{1}は好ましくは各々随時ハロゲンで置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_{20}$－アルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_{20}$－アルケニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルチオ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルまたはポリ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルを表すか、或いは随時ハロゲン、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_8$－シクロアルキルを表すか、

随時ハロゲン、シアノ、ニトロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルチオまたはＣ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、

随時ハロゲン、ニトロ、シアノ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_6$－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニル－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルキルを表すか、

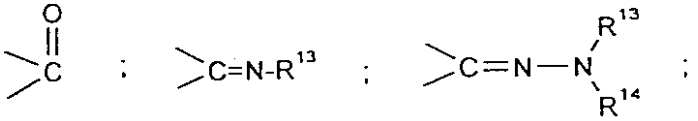
随時ハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよい酸素、硫黄及び窒素よりなる群からの１または２個のヘテロ原子を有する５または６員のヘタリールを表すか、
随時ハロゲンまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよいフェノキシ－C_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
随時ハロゲン、アミノまたはC_1～C_6－アルキルで置換されていてもよい酸素、硫黄及び窒素よりなる群からの１または２個のヘテロ原子を有する５または６員のヘタリールオキシ－C_1～C_6－アルキルを表す。
R^2は好ましくは随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_{20}－アルキル、C_2～C_{20}－アルケニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルまたはポリ－C_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルを表すか、
随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシで置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時ハロゲン、シアノ、ニトロ、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_6－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、
R^3は好ましくは随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは各々随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表す。
R^4及びR^5は相互に独立して好ましくは各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルキルアミノ、ジ－（C_1～C_8－アルキル）アミノ、C_1～C_8－アルキルチオまたはC_2～C_8－アルケニルチオを表すか、各々随時ハロゲン、ニトロ、シアノ、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオ、C_1～C_4－ハロゲノアルキルチオ、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－ハロゲノアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。
R^6及びR^7は相互に独立して好ましくは水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルコキシ、C_3～C_8－アルケニルまたはC_1～C_8－アルコキシ－C_2～C_8－アルキルを表すか、各々随時ハロゲン、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－ハロゲノアルキルまたはC_1～C_8－アルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時C_1～C_6－アルキルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－アルキレン基を表す。
R^{13}は好ましくは水素を表すか、各々随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルまたはC_1～C_8－アルコキシを表すか、随時ハロゲン、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－C_1～C_4－アルキルまたはフェニル－C_1～C_4－アルコキシを表す。
R^{14}は好ましくは水素またはC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}が一緒になってC_4～C_6－アルカンジイルを表す。
R^{15}及びR^{16}は同一もしくは相異なり、かつ好ましくはC_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}は一緒になって好ましくは随時C_1～C_6－アルキル或いは随時ハロゲン、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_4－アルカンジイル基を表す。
R^{17}及びR^{18}は相互に独立して好ましくは水素を表すか、随時ハロゲンで置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは随時ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～

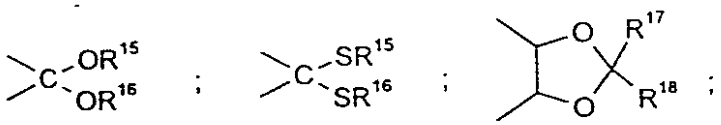
C_6－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルキル、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは
R^{17}及びR^{18}はこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_5～C_7－シクロアルキルを表す。
R^{19}及びR^{20}は相互に独立して好ましくはC_1～C_{10}－アルキル、C_2～C_{10}－アルケニル、C_1～C_{10}－アルコキシ、C_1～C_{10}－アルキルアミノ、C_3～C_{10}－アルケニルアミノ、ジ－（C_1～C_{10}－アルキル）アミノまたはジ－（C_3～C_{10}－アルケニル）アミノを表す。
Ｘは殊に好ましくはフッ素、塩素または臭素を表す。
Ｙは殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルを表す。
Ｚは殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素またはC_1～C_4－アルキルを表す。
基Ｙ及びＺの１つは常にハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表す。
Ｈｅｔは殊に好ましくは基

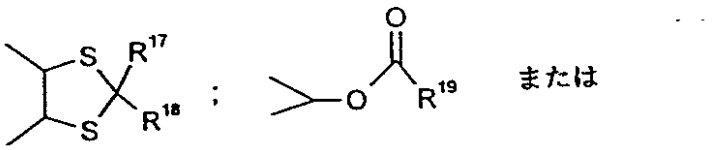

(1),

(2),

(3),

(4),

(5),

(6).

の１つを表す。
Ａは殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{10}－アルキル、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ポリ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_8－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4ハロゲノアルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピラゾリル、インドリル、チアゾリル、チエニルまたはフェニル－C_1～C_4－アルキルを表す。
Ｂは殊に好ましくは水素、C_1～C_{10}－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、殊に好ましくは各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_3－ハロゲノアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルチオ、フッ素、塩素またはフェニルで置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルまたはC_5～C_8－シクロアルケニルを表すか、

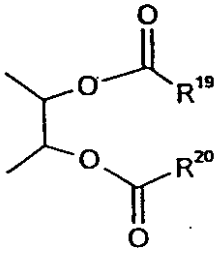
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、殊に好ましくは随時酸素または硫黄原子１または２個を含んでいてもよいアルキレンジイル或いはアルキレンジオキシまたはアルキレンジチオイル基で置換され、ここに該基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～７員の環を形成するＣ$_5$～Ｃ$_6$－シクロアルキルを表すか、或いは
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、殊に好ましくは２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々随時Ｃ$_1$～Ｃ$_5$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_5$－アルコキシ、フッ素、塩素または臭素で置換されていてもよく、かつ各々の場合に１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_5$－アルカンジイル、Ｃ$_3$～Ｃ$_5$－アルケンジイルまたはブタジエンジイルを表すＣ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキルまたはＣ$_5$～Ｃ$_6$－シクロアルケニルを表す。
Ｄは殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_{10}$－アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－アルケニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－アルキニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_8$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_6$－アルキル、ポリ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_6$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_8$－アルキルチオ－Ｃ$_2$～Ｃ$_6$－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシまたはＣ$_1$～Ｃ$_2$－ハロゲノアルキルで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_7$－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、イミダゾリル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピロリル、チエニル、トリアゾリルまたはフェニル－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルを表すか、
Ａ及びＤは一緒になって、殊に好ましくは各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メルカプト、或いは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルチオ、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシで置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_5$－アルカンジイルまたはＣ$_3$～Ｃ$_5$－アルケンジイル基を表すか、或いは各々の場合に随時次の基



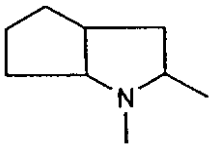




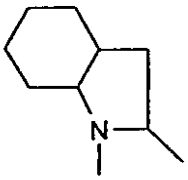
または



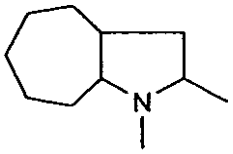
の１つが存在するか；或いは
Ａ及びＤは［式（Ｉ－１）の化合物の場合］これらのものが結合する原子と一緒になって基ＡＤ－１～ＡＤ－２７



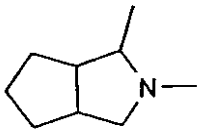
AD-1



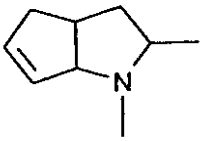
AD-2



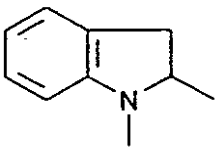
AD-3



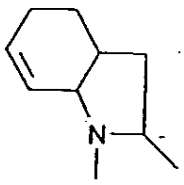
AD-4



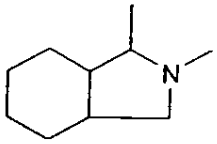
AD-5



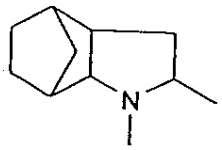
AD-6



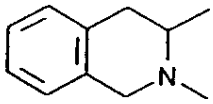
AD-7



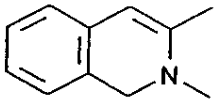
AD-8



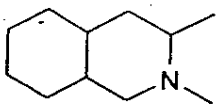
AD-9



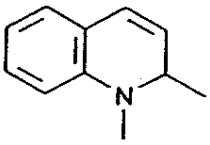
AD-10



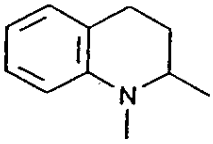
AD-11



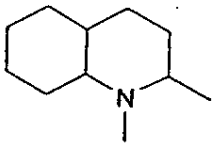
AD-12



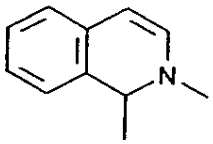
AD-13



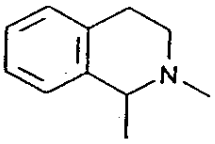
AD-14



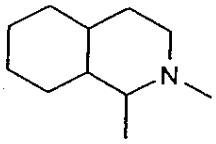
AD-15



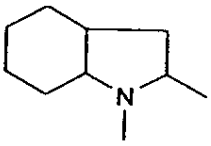
AD-16



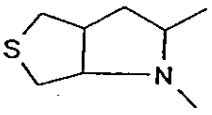
AD-17



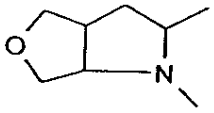
AD-18



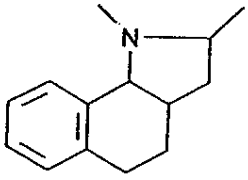
AD-19



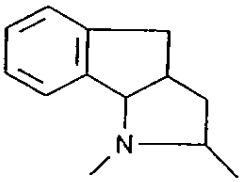
AD-20



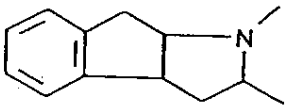
AD-21



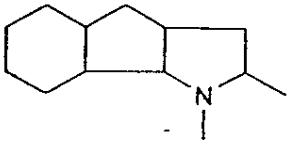
AD-22



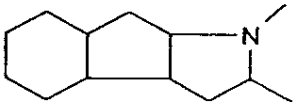
AD-23



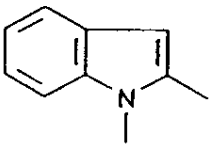
AD-24



AD-25



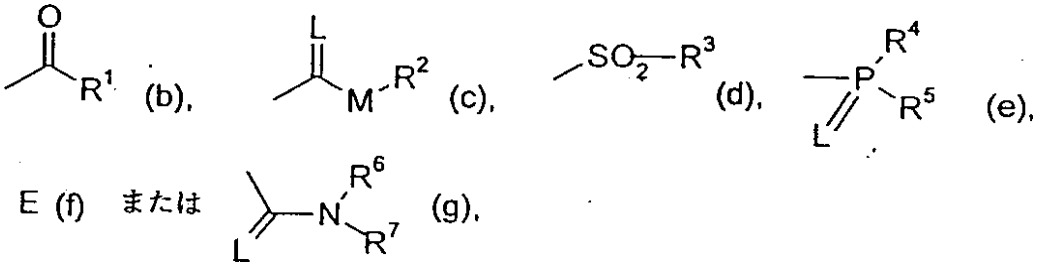
AD-26



AD-27

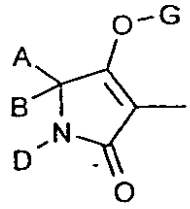
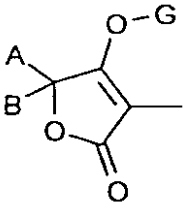
の１つを表す。

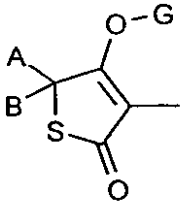
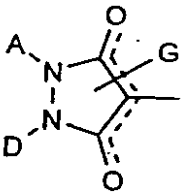
Ｇは殊に好ましくはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（５）または（６）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（４）、（５）または（６）の１つを表す場合に基

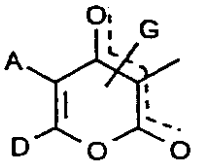
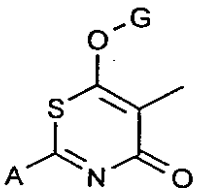


の１つを表し、ここに
Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、
Ｌは酸素または硫黄を表し、そして
Ｍは酸素または硫黄を表す。
Ｒ[1]は殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ１６－アルキル、Ｃ２～Ｃ１６－アルケニル、Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ１～Ｃ６－アルキル、Ｃ１～Ｃ６－アルキルチオ－Ｃ１～Ｃ６－アルキルまたはポリ－Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ１～Ｃ６－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、Ｃ１～Ｃ５－アルキルまたはＣ１～Ｃ５－アルコキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ３～Ｃ７－シクロアルキルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、Ｃ１～Ｃ４－アルキル、Ｃ１～Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルキル、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１～Ｃ４－アルキルチオまたはＣ１～Ｃ４－アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、Ｃ１～Ｃ４－アルキル、Ｃ１～Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルキルまたはＣ１～Ｃ３－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニル－Ｃ１～Ｃ４－アルキルを表すか、
各々随時フッ素、塩素、臭素またはＣ１～Ｃ４－アルキルで置換されていてもよいピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニルまたはチエニルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素またはＣ１～Ｃ４－アルキルで置換されていてもよいフェノキシ－Ｃ１～Ｃ５－アルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、臭素、アミノまたはＣ１～Ｃ４－アルキルで置換されていてもよいピリジルオキシ－Ｃ１～Ｃ５－アルキル、ピリミジルオキシ－Ｃ１～Ｃ５－アルキルまたはチアゾリルオキシ－Ｃ１～Ｃ５－アルキルを表す。
Ｒ[2]は殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ１６－アルキル、Ｃ２～Ｃ１６－アルケニル、Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ２～Ｃ６－アルキルまたはポリ－Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ－Ｃ２～Ｃ６－アルキルを表すか、
随時はフッ素、塩素、Ｃ１～Ｃ４－アルキルまたはＣ１～Ｃ４－アルコキシで置換されていてもよいＣ３～Ｃ７－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、Ｃ１～Ｃ４－アルキル、Ｃ１～Ｃ３－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルキルまたはＣ１～Ｃ３－ハロゲノアルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。
Ｒ[3]は殊に好ましくは随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ６－アルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、Ｃ１～Ｃ５－アルキル、Ｃ１～Ｃ５－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルキル、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルコキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。
Ｒ[4]及びＲ[5]は相互に独立して殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ１～Ｃ６－アルキル、Ｃ１～Ｃ６－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６－アルキルアミノ、ジ－（Ｃ１～Ｃ６－アルキル）アミノ、Ｃ１～Ｃ６－アルキルチオまたはＣ３～Ｃ４－アルケニルチオを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、Ｃ１～Ｃ３－アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３－アルキルチオ、Ｃ１～Ｃ３－ハロゲノアルキルチ

オ、C_1～C_3－アルキルまたはC_1～C_3－ハロゲノアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。
R^6及びR^7は相互に独立して殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル、C_1～C_6－アルコキシ、C_3～C_6－アルケニルまたはC_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_6－アルキルを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_5－ハロゲノアルキル、C_1～C_5－アルキルまたはC_1～C_5－アルコキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時C_1～C_4－アルキルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－アルキレン基を表す。
R^{13}は殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキルまたはC_1～C_6－アルコキシを表すか、随時フッ素、C_1～C_2－アルキルまたはC_1～C_2－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_7－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_5－アルキル、C_1～C_5－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－C_1～C_3－アルキルまたはフェニル－C_1～C_2－アルコキシを表す。
R^{14}は殊に好ましくは水素またはC_1～C_6－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}は一緒になって殊に好ましくはC_4～C_6－アルカンジイルを表す。
R^{15}及びR^{16}は同一もしくは相異なり、かつ殊に好ましくはC_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}は一緒になって殊に好ましくは随時C_1～C_4－アルキル或いは随時フッ素、塩素、臭素、C_1～C_2－アルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_3－アルカンジイル基を表す。
R^{17}及びR^{18}は相互に独立して殊に好ましくは水素を表すか、随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_8－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_2－ハロゲノアルキル、C_1～C_2－ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは
R^{17}及びR^{18}は殊に好ましくはこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって随時C_1～C_3－アルキルまたはC_1～C_3－アルコキシで置換されていてもよく、かつ１個のアルキレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_5～C_6－シクロアルキルを表す。
R^{19}及びR^{20}は相互に独立して殊に好ましくはC_1～C_6－アルキル、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、C_3～C_6－アルケニルアミノ、ジ－（C_1～C_6－アルキル）アミノまたはジ－（C_3～C_6－アルケニル）アミノを表す。
Ｘは極めて殊に好ましくはフッ素、塩素または臭素を表す。
Ｙは極めて殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピルまたはイソ－プロピルを表す。
Ｚは極めて殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピルまたはイソ－プロピルを表す。
基Ｙ及びＺの１つは常にハロゲンを表し、一方他のものはアルキルを表す。
Ｈｅｔは極めて殊に好ましくは基


(1),

(2),


(3),

(4),


(5),

(6).

の１つを表す。

Ａは極めて殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_2～C_4－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_4－アルキル、ポリ－C_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_4－アルキルまたはC_1～C_6－アルキルチオ－C_1～C_4－アルキルを表すか、随時フッ素、塩素、メチルまたはメトキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、ピリジルまたはベンジルを表す。

Ｂは極めて殊に好ましくは水素、C_1～C_8－アルキルまたはC_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_2－アルキルを表すか、或いは

Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、極めて殊に好ましくは各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、ブチル、イソ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、シクロヘキシル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソ－プロポキシ、ブトキシ、イソ－ブトキシ、ｓ－ブトキシ、ｔ－ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、フッ素、塩素またはフェニルで置換されていてもよいC_3～C_8－シクロアルキルまたはC_5～C_8－シクロアルケニルを表すか、

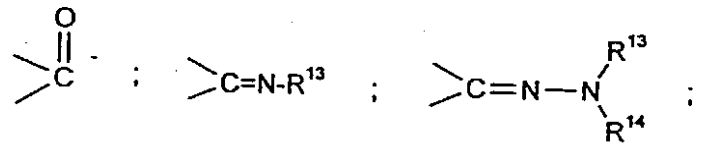
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、極めて殊に好ましくは随時酸素または硫黄原子を含んでいてもよいアルキレンジイル基或いはアルキレンジオキシ基で置換され、ここに該アルキレンジイルまたはアルキレンジオキシ基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって更に５～６員の環を形成するC_5～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは

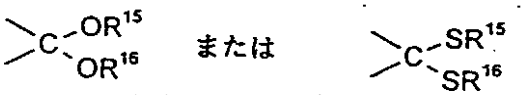
Ａ、Ｂ及びこれらのものが結合する炭素原子は、極めて殊に好ましくは２個の置換基がこれらのものが結合する炭素原子と一緒になって各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいC_3～C_4－アルカンジイル、C_3～C_4－アルケンジイルまたはブタジエンジイルを表すC_3～C_6－シクロアルキルまたはC_5～C_6－シクロアルケニルを表す。

Ｄは極めて殊に好ましくは水素を表すか、直接隣接していない１または２個のメチレン基

が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよく、かつ各々の場合に随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_8－アルキル、C_3～C_4－アルケニル、C_3～C_4－アルキニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_2～C_4－アルキル、ポリ－C_1～C_4－アルコキシ－C_2～C_4－アルキル、C_1～C_4－アルキルチオ－C_2～C_4－アルキルまたはC_3～C_6－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、チエニルまたはベンジルを表すか、

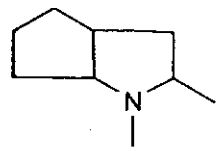
Ａ及びＤは一緒になって極めて殊に好ましくは各々１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよく、かつ随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メルカプト、或いは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_6－アルキル、C_1～C_4－アルコキシ、C_1～C_4－アルキルチオ、C_3～C_6－シクロアルキル、フェニルまたはベンジルオキシで置換されていてもよいC_3～C_5－アルカンジイルまたはC_3～C_5－アルケンジイル基を表すか、或いは各々の場合に随時次の基



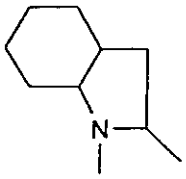


の１つが存在するか、或いは

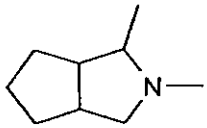
Ａ及びＤは式（Ｉ－１）の化合物の場合に、これらのものが結合する原子と一緒になって次の基



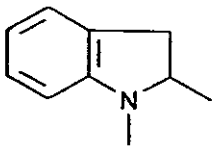
AD-1



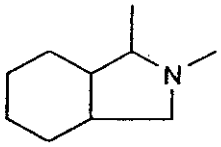
AD-2



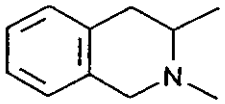
AD-4



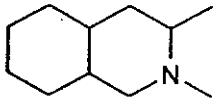
AD-6



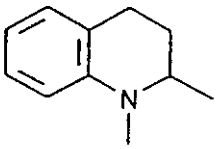
AD-8



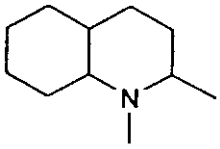
AD-10



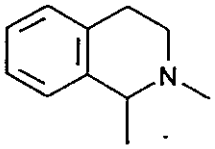
AD-12



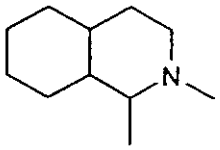
AD-14



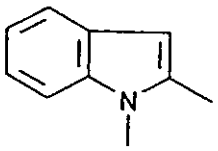
AD-15



AD-17



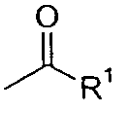
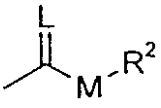
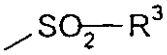
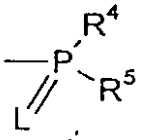
AD-18

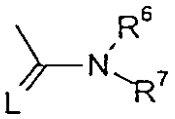


AD-27

の１つを表す。

Ｇは極めて殊に好ましくはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（５）または（６）の１つを表す場合に水素（ａ）を表すか、或いはＨｅｔが基（１）、（２）、（３）、（４）、（５）または（６）の１つを表す場合に基


(b),

(c),

(d),

(e),

Ｅ (f) または

(g),

の１つを表し、ここに

Ｅは金属イオン等価物またはアンモニウムイオンを表し、

Ｌは酸素または硫黄を表し、そして

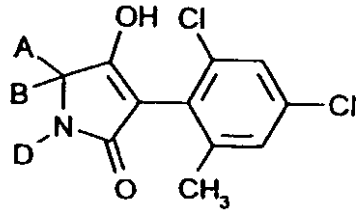
Ｍは酸素または硫黄を表す。

R^1は極めて殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいC_1～C_{14}－アルキル、C_2～C_{14}－アルケニル、C_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_4－アルキルチオ－C_1～C_6－アルキルまたはポリ－C_1～C_4－アルコキシ－C_1～C_4－アルキルを表すか、或いは随時フッ素、塩素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ

またはイソ－プロポキシで置換されていてもよく、かつ直接隣接していない１または２個のメチレン基が随時酸素及び／または硫黄で置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニルまたはエチルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいベンジルを表すか、
各々随時フッ素、塩素、臭素、メチルまたはエチルで置換されていてもよいフラニル、チエニルまたはピリジルを表すか、
随時フッ素、塩素、臭素、メチルまたはエチルで置換されていてもよいフェノキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、アミノ、メチルまたはエチルで置換されていてもよいピリジルオキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、ピリミジルオキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルまたはチアゾリルオキシ－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルを表す。
Ｒ^{2}は極めて殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_{14}$－アルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_{14}$－アルケニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_6$－アルキルまたはポリ－Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_6$－アルキルを表すか、
随時フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいＣ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキルを表すか、或いは
各々随時フッ素、塩素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、メトキシ、シアノ、ニトロ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。
Ｒ^{3}は極めて殊に好ましくは随時フッ素または塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、プロピル、イソ－プロピル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ｔ－ブトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。
Ｒ^{4}及びＲ^{5}は相互に独立して極めて殊に好ましくは各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルアミノ、ジ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル）アミノまたはＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルチオを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は相互に独立して極めて殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_3$～Ｃ$_4$－アルケニルまたはＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_2$～Ｃ$_4$－アルキルを表すか、各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシまたはトリフルオロメチルで置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表すか、或いは一緒になって随時メチルまたはエチルで置換されていてもよく、かつ１個のメチレン基が随時酸素または硫黄で置換されていてもよいＣ$_5$～Ｃ$_6$－アルキレン基を表す。
Ｒ^{13}は極めて殊に好ましくは水素を表すか、各々随時フッ素または塩素で置換されていてもよいＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルキルまたはＣ$_1$～Ｃ$_4$－アルコキシを表すか、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$－シクロアルキルを表すか、或いは各々随時フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソ－プロピル、ｔ－ブチル、メトキシ、エトキシ、イソ－プロポキシ、ｔ－ブトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル－Ｃ$_1$～Ｃ$_2$－アルキルまたはベンジルを表す。

R^{14}は極めて殊に好ましくは水素またはC_1～C_4－アルキルを表すか、或いは
R^{13}及びR^{14}は一緒になって極めて殊に好ましくはC_4～C_6－アルカンジイルを表す。
R^{15}及びR^{16}は同一もしくは相異なり、かつ極めて殊に好ましくはメチルまたはエチルを表すか、或いは
R^{15}及びR^{16}は一緒になって極めて殊に好ましくは随時メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソ－プロピル、ｎ－ブチル、イソ－ブチル、ｓ－ブチルまたはｔ－ブチル、或いは随時フッ素、塩素、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロまたはシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよいC_2～C_3－アルカンジイル基を表す。
一般にか、または好適な範囲が与えられた上記の基の定義または図は必要に応じて相互に組み合わせることができ、即ちまたそれぞれの範囲及び好適な範囲間の組合せも可能である。これらのものは最終生成物並びに同様に先駆体及び中間体に適用される。
本発明による好適なものは好ましい（好適な）ものとしての上記の組合せが存在する式（Ｉ）の化合物である。
本発明による殊に好適なものは殊に好適なものとしての上記の組合せが存在する式（Ｉ）の化合物である。
本発明による極めて殊に好適なものは極めて殊に好適なものとしての上記の組合せが存在する式（Ｉ）の化合物である。
飽和もしくは不飽和の炭化水素例えばアルキルまたはアルケニル、またヘテロ原子に関して例えばアルコキシは可能な限り各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状であり得る。
随時置換されていてもよい基は一置換または多置換されることができ、ここに複数置換における置換基は同一もしくは相異なることができる。
製造実施例に挙げられる化合物に加えて挙げ得る式（Ｉ－１－ａ）の個々の化合物は次のものである：

表１



A	B	D
CH_3	H	H
C_2H_5	H	H
C_3H_7	H	H
i-C_3H_7	H	H
C_4H_9	H	H
i-C_4H_9	H	H
s-C_4H_9	H	H
t-C_4H_9	H	H
CH_3	CH_3	H
C_2H_5	CH_3	H
C_3H_7	CH_3	H
i-C_3H_7	CH_3	H
C_4H_9	CH_3	H
i-C_4H_9	CH_3	H
s-C_4H_9	CH_3	H
-C_4H_9	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H

表1続:

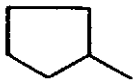
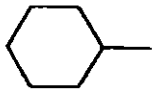
A	B	D
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$		H

表1続:

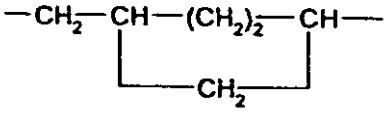
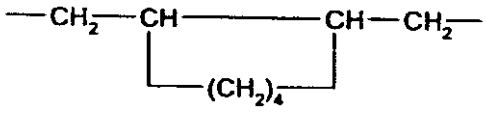
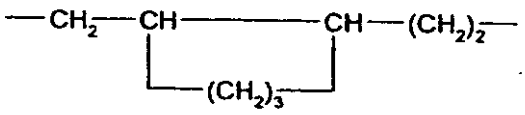
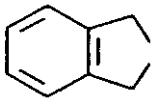
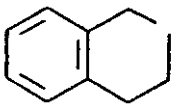
A	B	D
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$		H
		H
		H
		H
		H
		H

表1続:

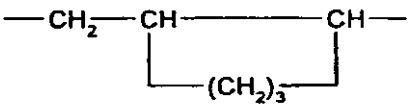
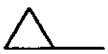
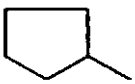
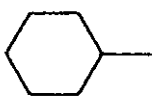
A	D	B
$-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$		H
$-CH_2-CH_2-CHCH_3-$		H
$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$		H
$-CH_2-S-CH_2-$		H
$-CH_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-S-CH_2-$		H
		H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-}C_3H_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H

表1続:

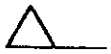
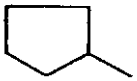
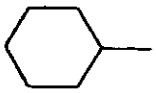
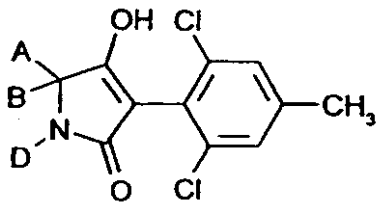
A	D	B
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	i-C_3H_7	H
CH_3		H
CH_3		H
CH_3		H
C_2H_5	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H

表2



A	B	D
CH_3	H	H
C_2H_5	H	H
C_3H_7	H	H
i-C_3H_7	H	H
C_4H_9	H	H
i-C_4H_9	H	H
s-C_4H_9	H	H
t-C_4H_9	H	H
CH_3	CH_3	H
C_2H_5	CH_3	H
C_3H_7	CH_3	H
i-C_3H_7	CH_3	H
C_4H_9	CH_3	H
i-C_4H_9	CH_3	H
s-C_4H_9	CH_3	H

表2続:

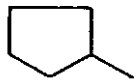
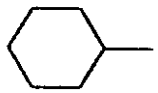
A	B	D
t-C_4H_9	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H

表２続：

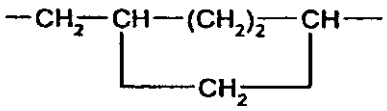
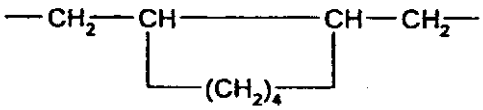
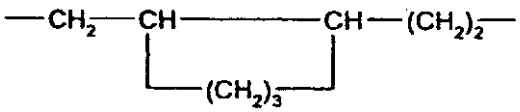
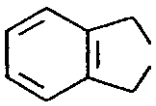
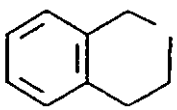
A	B	D
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	H
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	H
		H
		H
		H
		H
		H

表2続:

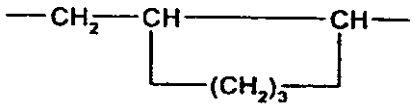
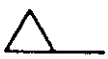
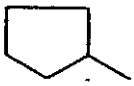
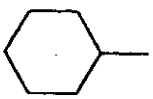
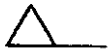
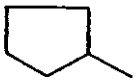
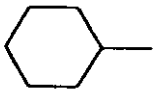
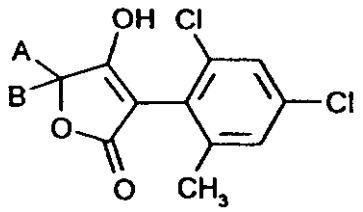
A	D	B
$-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-CH_2-CHCH_3-CH_2-$		H
$-CH_2-CH_2-CHCH_3-$		H
$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$		H
$-CH_2-S-CH_2-$		H
$-CH_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-S-CH_2-$		H
		H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-}C_3H_7$	H
H		H
H		H
H		H

表2続:

A	D	B
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i\text{-}C_3H_7$	H
CH_3		H
CH_3		H
CH_3		H
C_2H_5	CH_3	H
C_2H_5	C_2H_5	H

製造実施例に挙げられる化合物に加えて挙げ得る式（I-2-a）の個々の化合物は次のものである：

表3



A	B
CH_3	H
C_2H_5	H
C_3H_7	H
i-C_3H_7	H
C_4H_9	H
i-C_4H_9	H
s-C_4H_9	H
t-C_4H_9	H
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
i-C_3H_7	CH_3
C_4H_9	CH_3
i-C_4H_9	CH_3
s-C_4H_9	CH_3

表3続:

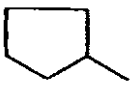
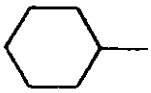
A	B
$-C_4H_9$	CH_3
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	

表3続:

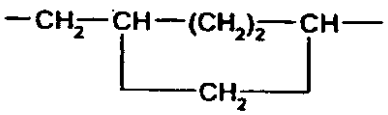
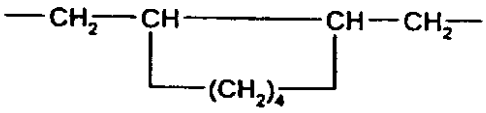
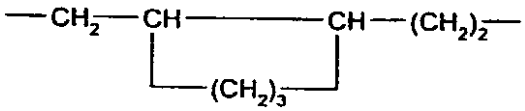
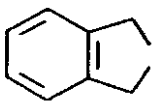
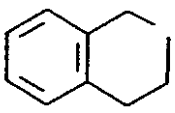
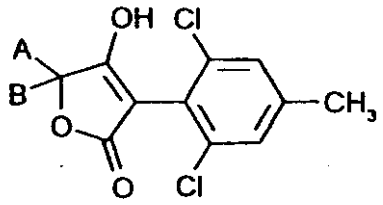
A	B
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$
	
	
	
	
	

表4



A	B
CH_3	H
C_2H_5	H
C_3H_7	H
i-C_3H_7	H
C_4H_9	H
i-C_4H_9	H
s-C_4H_9	H
t-C_4H_9	H
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
i-C_3H_7	CH_3
C_4H_9	CH_3
i-C_4H_9	CH_3
s-C_4H_9	CH_3

表４続：

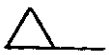
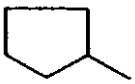
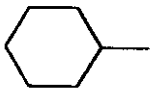
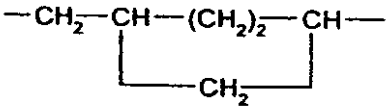
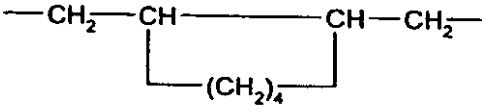
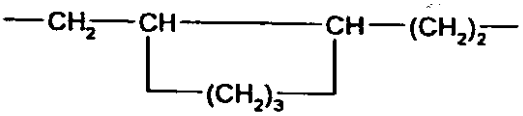
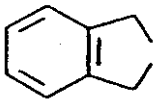
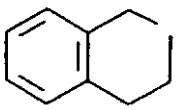
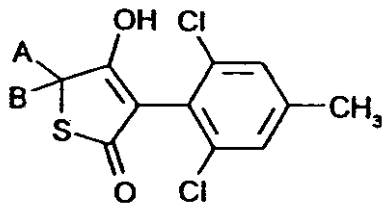
A	B
$-C_4H_9$	CH_3
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	

表4続:

A	B
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$
	
	
	
	
	

製造実施例に挙げられる化合物に加えて挙げ得る式（I-3-a）の個々の化合物は次のものである：

表5



A	B
CH_3	H
C_2H_5	H
C_3H_7	H
i-C_3H_7	H
C_4H_9	H
i-C_4H_9	H
s-C_4H_9	H
t-C_4H_9	H
CH_3	CH_3
C_2H_5	CH_3
C_3H_7	CH_3
i-C_3H_7	CH_3
C_4H_9	CH_3
i-C_4H_9	CH_3
s-C_4H_9	CH_3

表5続:

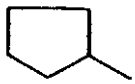
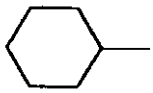
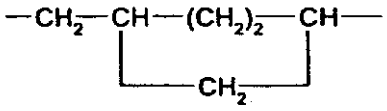
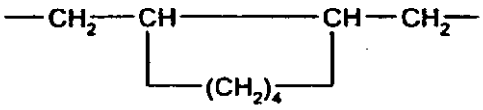
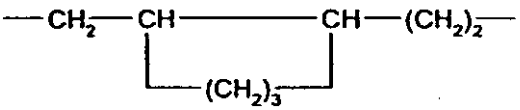
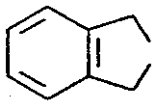
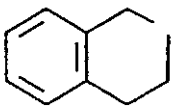
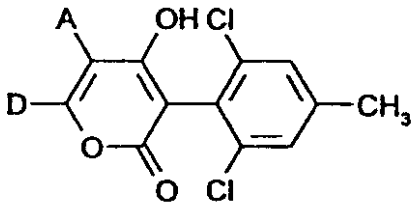
A	B
t-C_4H_9	CH_3
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	

表5続:

A	B
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$	
	
	
	
	
	

製造実施例に挙げられる化合物に加えて挙げ得る式（I-5-a）の個々の化合物は次のものである：

表6



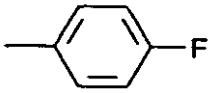
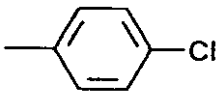
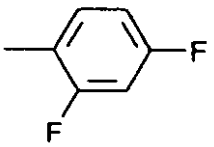
A	D
H	CH_3
H	$C(CH_3)_3$
H	$C(CH_3)_2CH_2Cl$
CH_3	CH_3
CH_3	$CH_2CHCH_3CH_2CH_3$
H	$CH=C(CH_3)_2$
CH_3	
CH_3	
CH_3	

表6続:

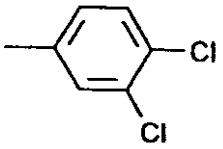
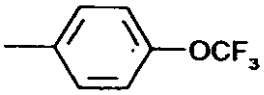
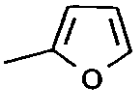
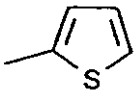
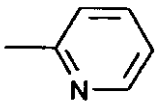
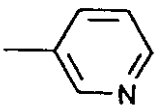
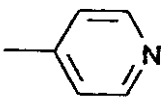
A	D
CH_3	
CH_3	
	CH_3
H	
CH_3	
CH_3	
CH_3	
CH_3	

表6続:

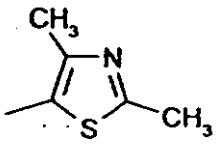
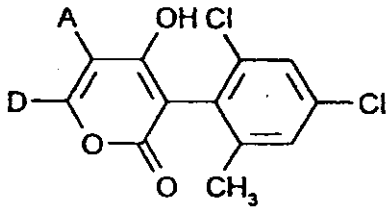
A	D
H	
CH_3	C_5H_9
CH_3	C_3H_5
H	C_3H_4Cl
$(CH_2)_3$	
$(CH_2)_4$	
$C(CH_3)_2OC(CH_3)_2$	

表7



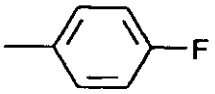
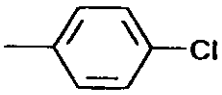
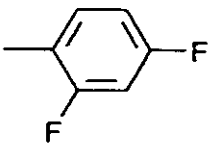
A	D
H	CH_3
H	$C(CH_3)_3$
H	$C(CH_3)_2CH_2Cl$
CH_3	CH_3
CH_3	$CH_2CHCH_3CH_2CH_3$
H	$CH=C(CH_3)_2$
CH_3	
CH_3	
CH_3	

表7續：

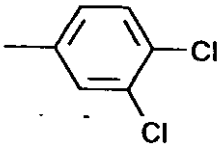
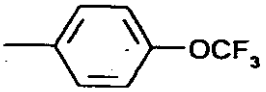
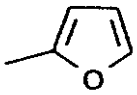
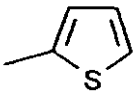
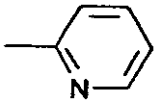
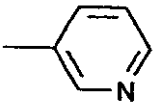
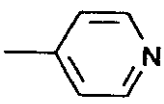
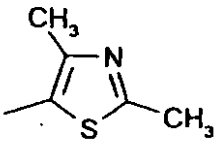
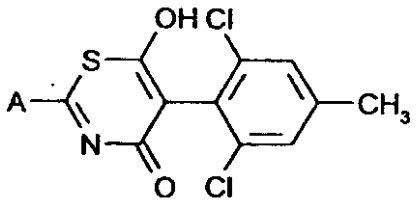
A	D
CH_3	
CH_3	
	CH_3
H	
CH_3	
CH_3	
CH_3	
CH_3	

表7続:

A	D
H	
CH_3	C_5H_9
CH_3	C_3H_5
H	C_3H_4Cl
$(CH_2)_3$	
$(CH_2)_4$	
$C(CH_3)_2OC(CH_3)_2$	

製造実施例に挙げられる化合物に加えて挙げ得る式（I-6-a）の個々の化合物は次のものである：

表8



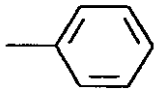
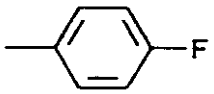
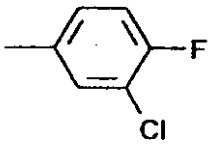
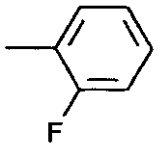
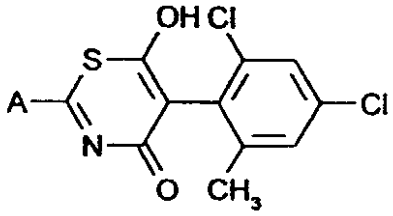
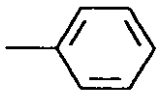
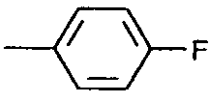
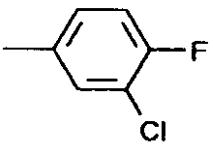
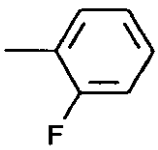
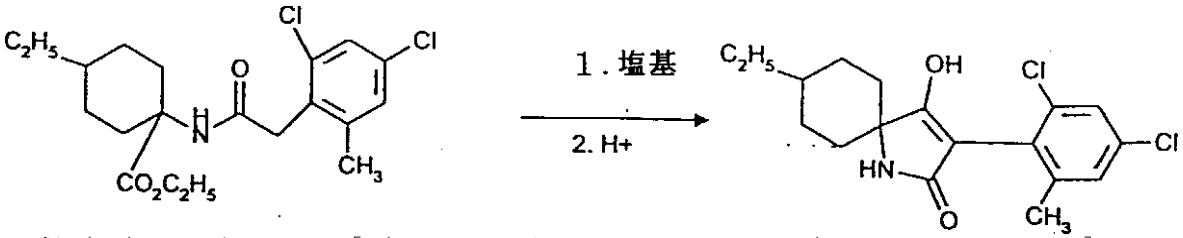
A
CH_3
$CH(CH_3)_2$





表９



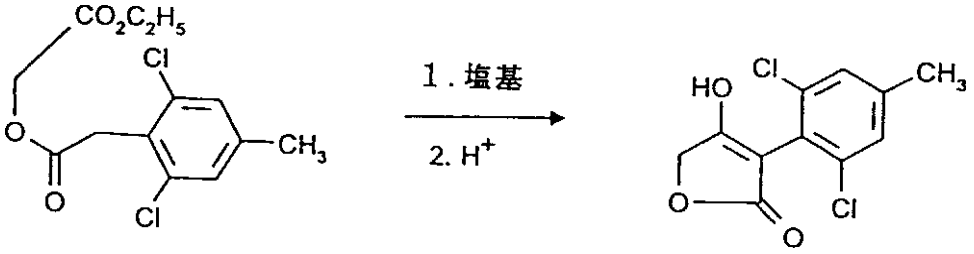
A
CH_3
$CH(CH_3)_2$





工程（Ａ）により、出発物質としてＮ－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニルアセチル］－１－アミノ－４－エチル－シクロヘキサン－カルボン酸エチルを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：

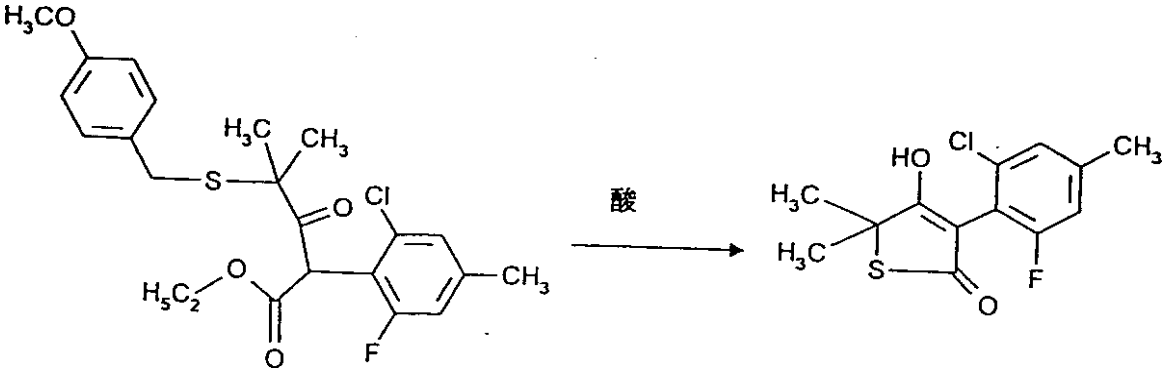


工程（Ｂ）により、Ｏ－［（２，６－ジクロロ－４－メチル）フェニルアセチル］－ヒド

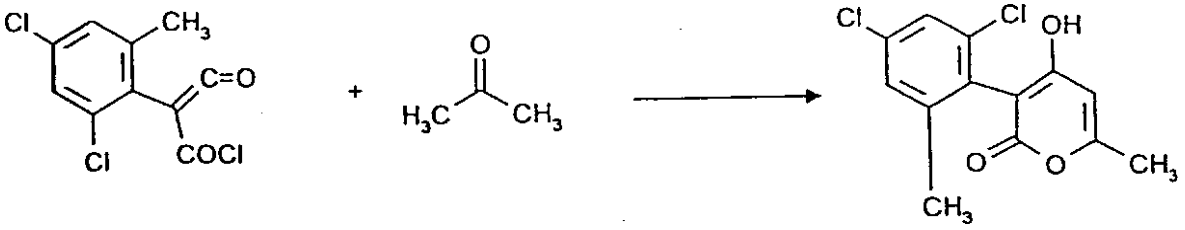
ロキシ酢酸エチルを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



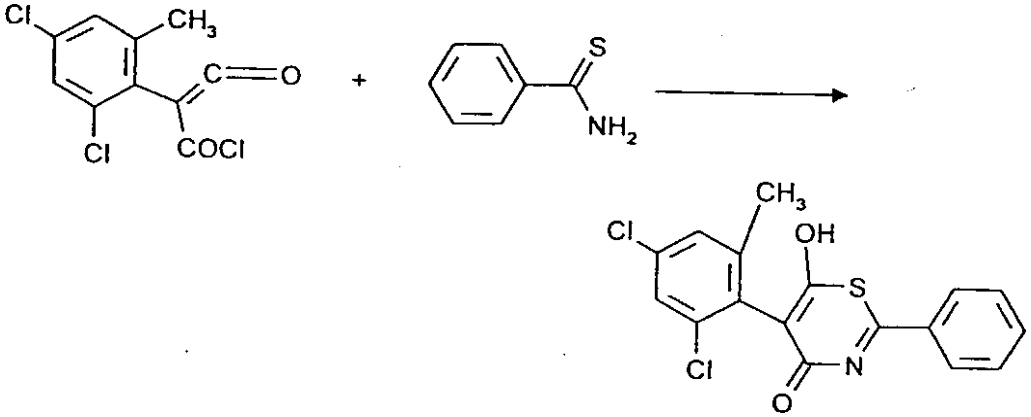
工程（Ｃ）により、２－［（２－クロロ－６－フルオロ－４－メチル）－フェニル］－４－（４－メトキシ）－ベンジルメルカプト－４－メチル－３－オキソ－吉草酸エチルを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



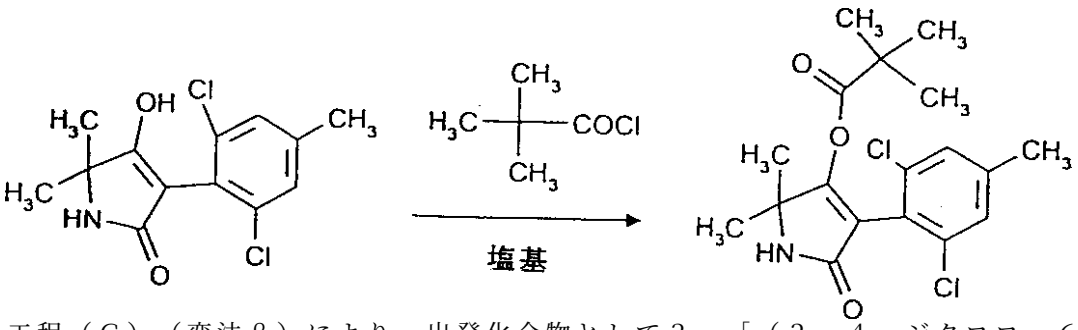
例えば工程（Ｅ）により、出発化合物として２－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニル］ケテンクロロカルボニル及びアセトンを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



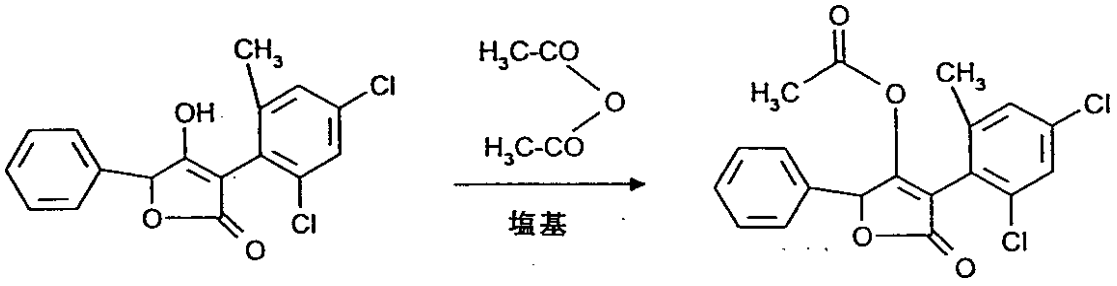
例えば工程（Ｆ）により、出発化合物として２－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニル］ケテンクロロカルボニル及びチオベンズアミドを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



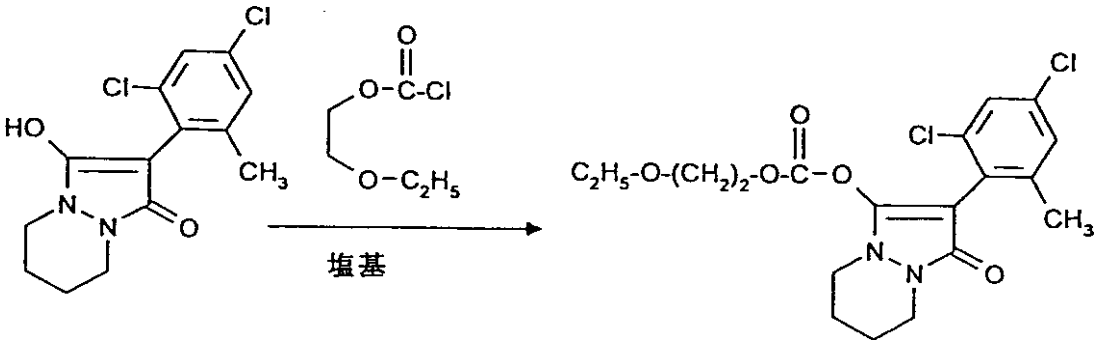
工程（Ｇα）により、出発物質として３－［（２，６－ジクロロ－４－メチル）－フェニル］－５，５－ジメチル－ピロリジン－２，４－ジオン及び塩化ピバロイルを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



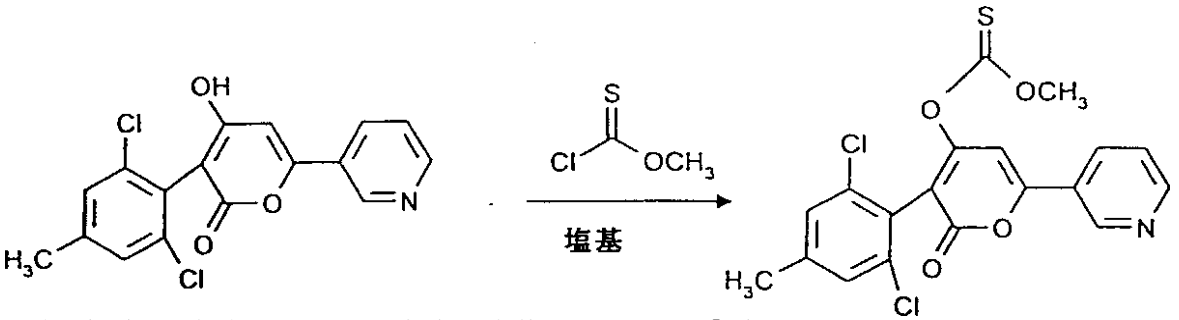
工程（G）（変法β）により、出発化合物として３－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニル］－４－ヒドロキシ－５－フェニル－△^{3}－ジヒドロフラン－２－オン及び無水酢酸を用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



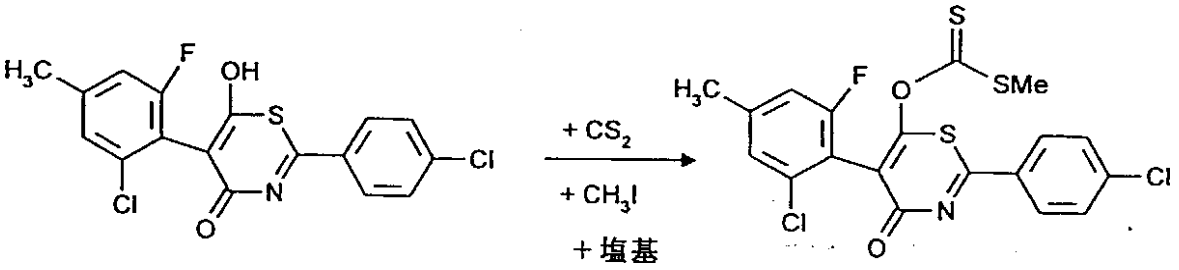
工程（H）により、出発化合物として８－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニル］－１，６－ジアザビシクロ－（４，３，０^{1,6}）－ノナン－７，９－ジオン及びクロロギ酸エトキシエチルを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：



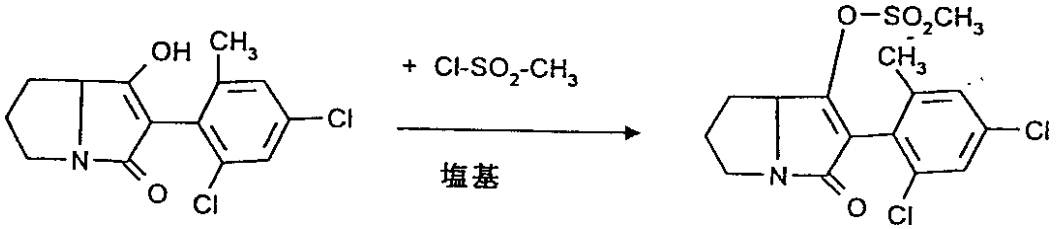
工程（Ｉ）、変法αにより、出発物質として３－［（２，６－ジクロロ－４－メチル）－フェニル］－４－ヒドロキシ－６－（３－ピリジル）－ピロン及びクロロモノチオギ酸メチルを用いる場合、反応の経路は次のように表し得る：



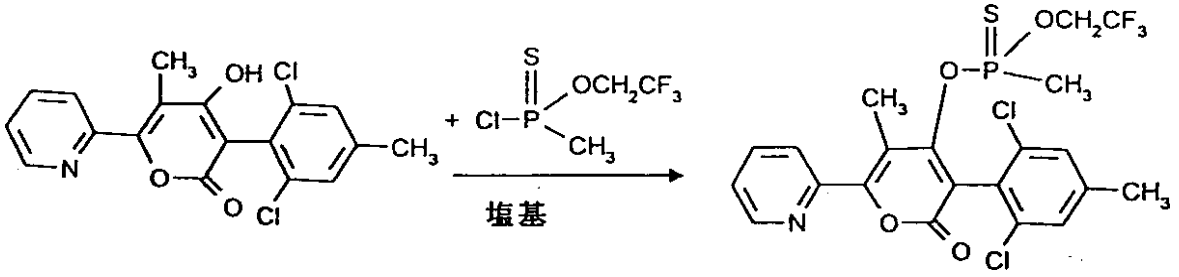
工程（K）、変法βにより、出発反応体として５－［（２－クロロ－６－フルオロ－４－メチル）－フェニル］－６－ヒドロキシ－２－（４－クロロフェニル）－チアジン－４－オン、二硫化炭素及びヨウ化メチルを用いる場合、反応の経路は次のように表し得る：



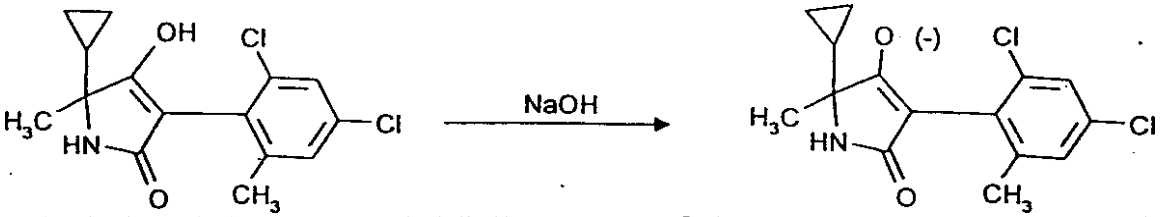
工程（Ｊ）により、出発物質として２－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）フェニル］－１，５－トリメチレン－ピロリジン－２，４－ジオン及び塩化メタンスルホニルを用いる場合、反応の経路は次式により表し得る：



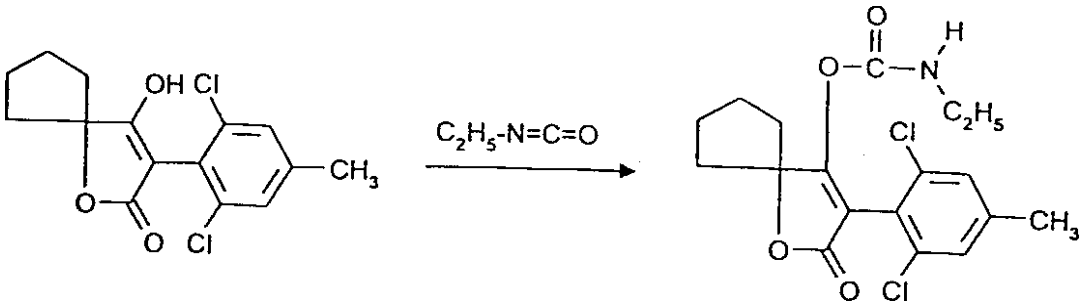
工程（Ｋ）により、出発物質として２－［（２，６－ジクロロ－４－メチル）－フェニル］－４－ヒドロキシ－５－メチル－６－（２－ピリジル）－ピロン及びメタンチオクロロホスホン酸２，２，２－トリフルオロエチルを用いる場合、反応の経路は次式により表し得る：



工程（Ｌ）により、成分として３－［（２，４－ジクロロ－６－メチル）－フェニル］－５－シクロプロピル－５－メチル－ピロリジン－２，４－ジオン及びＮａＯＨを用いる場合、本発明による工程の経路は次式により表し得る：

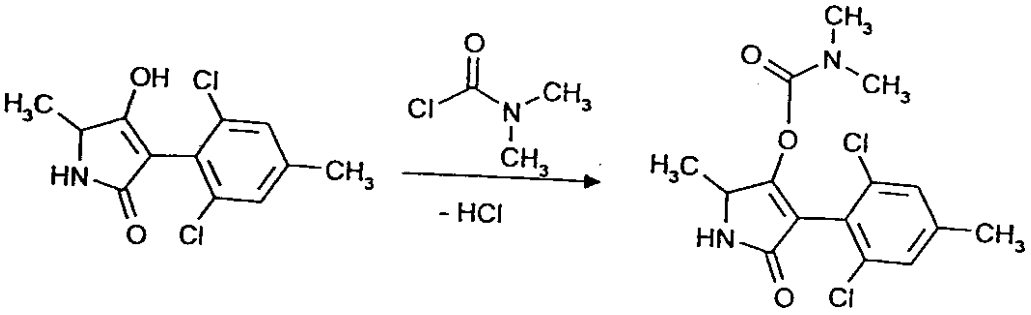


工程（Ｍ）、変法αにより、出発物質として３－［（２，６－ジクロロ－４－メチル）－フェニル］－４－ヒドロキシ－５，５－テトラメチレン－△^{3}－ジヒドロ－フラン－２－オン及びエチルイソシアネートを用いる場合、反応の経路は次式により表し得る：

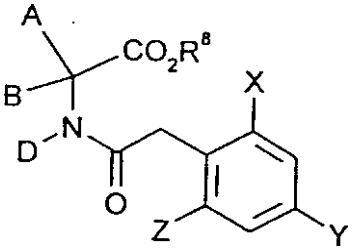


工程（Ｍ）、変法βにより、出発物質として３－［（２，６－ジヒドロ－４－メチル）－

フェニル］－５－メチル－ピロリジン－２，４－ジオン及び塩化ジメチルカルバモイルを用いる場合、反応の経路は次式により表し得る：

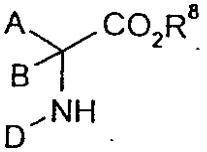


本発明による工程（Ａ）において出発物質として必要とされる式（ＩＩ）



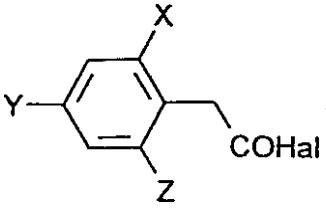
(II)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有する、
の化合物は新規である。
式（ＩＩ）のアシルアミノ酸エステルは例えば式（ＸＸＩ）



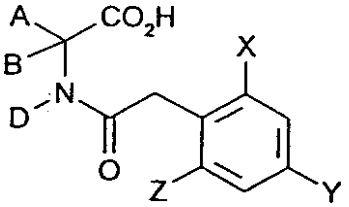
(XXI)

式中、Ａ、Ｂ、R^8及びＤは上記の意味を有する、
のアミノ酸誘導体を式（ＸＸＩＩ）



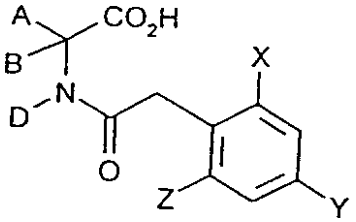
(XXII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素または臭素を表す、
の置換されたハロゲン化フェニルアセチルでアシル化するか［Chem.Reviews 52,237～416（1953）;Bhattacharya,Indian J.Chem.6,341～5,1968］、または式（ＸＸＩＩＩ）



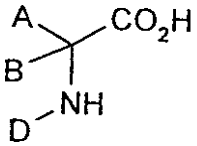
(XXIII)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
のアシルアミノ酸をエステル化する［Chem.Ind.（London）1568（1968）］場合に得られる。
式（ＸＸＩＩＩ）



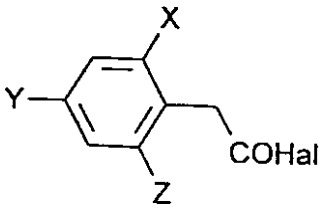
(XXIII)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物は新規である。
式（ＸＸＩＩＩ）の化合物は式（ＸＸＩＶ）



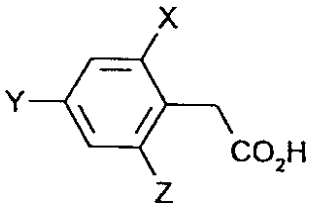
(XXIV)

式中、Ａ、Ｂ及びＤは上記の意味を有する、
のアミノ酸をショッテン－バウマン（Schotten-Baumann）反応において式（ＸＸＩＩ）



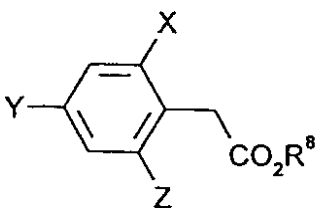
(XXII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素及び臭素を表す、
の置換されたハロゲン化フェニルアセチルでアシル化する場合に得られる［Organikum（Laboratory Practical in Organic Chemistry）,VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften,Berlin 1977,p.505］。
式（ＸＸＩＩ）の化合物は新規である。
式（ＸＸＩＩ）の化合物は例えば式（ＸＸＶ）



(XXV)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の置換されたフェニル酢酸を適当ならば希釈剤（例えば随時塩素化されていてもよい脂肪族または芳香族の炭化水素例えばトルエンまたは塩化メチレン）の存在下にて－２０～１５０℃、好ましくは－１０～１００℃の温度でハロゲン化剤（例えば塩化チオニル、臭化チオニル、塩化オキサリル、ホスゲン、三塩化リン、三臭化リンまたは五塩化リン）と反応させることにより得られる。
式（ＸＸＶ）の化合物は２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸以外は新規である［Crosby et al.,J.Agric.Food Chem.33,569～73（1985）参照］。
式（ＸＸＶ）の化合物は例えば式（ＸＸＶＩ）



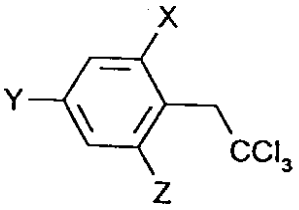
(XXVI)

式中、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有する、

の置換されたフェニル酢酸エステルを０乃至１５０℃間、好ましくは２０乃至１００℃間の温度で、酸（例えば無機酸例えば塩酸）または塩基（例えばアルカリ金属水酸化物例えば水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウム）の存在下及び適当ならば希釈剤（例えば水性アルコール例えばメタノールまたはエタノール）の存在下で加水分解することにより得られる。

式（ＸＸＶＩ）の化合物は新規である。

式（ＸＸＶＩ）の化合物は例えば式（ＸＸＶＩＩ）



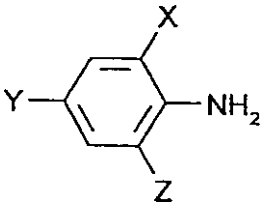
(XXVII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、

の置換された１，１，１－トリクロロ－２－フェニルエタンを最初に０乃至１５０℃間、好ましくは２０乃至１２０℃間の温度で、希釈剤（例えばアルコラートから誘導されるアルコール）の存在下でアルコラートと、そして続いて－２０乃至１５０℃間、好ましくは０乃至１００℃間の温度で酸（好ましくは無機酸例えば硫酸）と反応させることにより得られる。

式（ＸＸＶＩＩ）の化合物は新規である。

式（ＸＸＶＩＩ）の化合物は例えば式（ＸＸＶＩＩＩ）



(XXVIII)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、

のアニリンを－２０乃至８０℃間、好ましくは０乃至６０℃間の温度で、式（ＸＸＩＸ）

R^{21}－ＯＮＯ　　（ＸＸＩＸ）

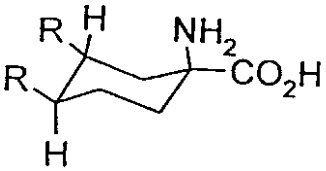
式中、R^{21}はアルキル、好ましくはC_1～C_6－アルキルを表す、

の亜硝酸アルキルの存在下、塩化銅（ＩＩ）の存在下及び適当ならば希釈剤（例えば脂肪族ニトリル例えばアセトニトリル）の存在下で塩化ビニリデン（CH_2＝CCl_2）と反応させる場合に得られる。

式（ＸＸＶＩＩＩ）及び（ＸＸＩＸ）の化合物は公知の有機化学の化合物である。塩化銅（ＩＩ）及び塩化ビニリデンは長く公知であり、そして市販されている。

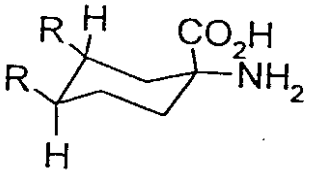
式（ＸＸＩ）及び（ＸＸＩＶ）の化合物のあるものは公知であり、そして／または公知の方法から合成される［例えばCompagnon,Miocque Ann.Chim.（Paris）［14］5,p.11～22,23～27（1970）参照］。

Ａ及びＢが環を形成する式（ＸＸＩＶａ）の置換された環式のアミノカルボン酸は一般にブヘラー－ベルグス（Bucherer Bergs）合成またはストレッカー（Strecker）合成により得られ、ここにこれらのものは各々の場合に種々の異性体形で得られる。かくて、ブヘラー－ベルグス合成により主に基Ｒ及びカルボキシル基が赤道位置にある異性体（簡単のために以下βと称する）が生じ、一方ストレッカー合成により主にアミノ基及び基Ｒが赤道位置にある異性体（簡単のために以下αと称する）が生じる。



ブヘラー－ベルグス合成

（β異性体）

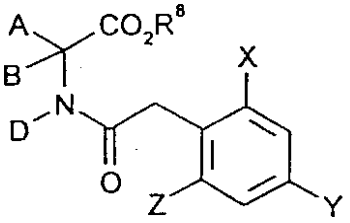


ストレッカー合成

（α異性体）

［L.Munday,J.Chem.Soc.4372（1961）;J.T.Eward,C.Jitrangeri,Can.J.Chem.53,3339（1975）］。

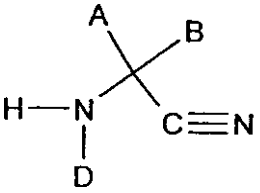
更に、上記の工程（Ａ）に用いられる式（ＩＩ）



(II)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有する、

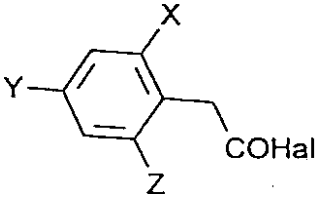
の出発物質は式（ＸＸＸ）



(XXX)

式中、Ａ、Ｂ及びＤは上記の意味を有する、

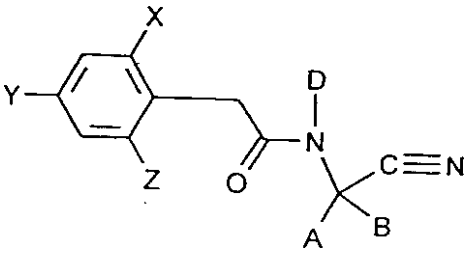
のアミノニトリルを式（ＸＸＩＩ）



(XXII)

式中、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びＨａｌは上記の意味を有する、

の置換されたフェニルアセチルハロゲン化合物と反応させ、式（ＸＸＸＩ）



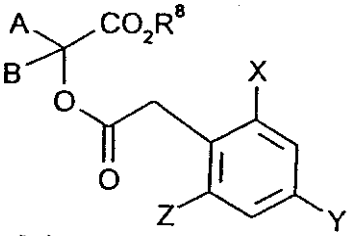
(XXXI)

式中、Ａ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、

の化合物を生成させ、そして続いてこれらの化合物を酸性条件下でアルコール分解させる場合に製造し得る。

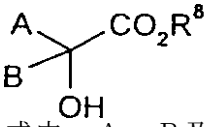
式（ＸＸＸＩ）の化合物は同様に新規である。

本発明による工程（Ｂ）において出発物質として必要とされる式（ＩＩＩ）



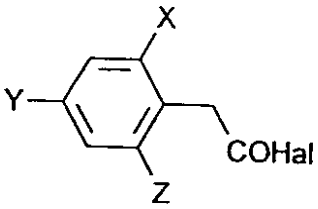
(III)

式中、Ａ、Ｂ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有する、
の化合物は新規である。
これらのものは原理的に公知の方法により簡単に製造し得る。
式（ＩＩＩ）の化合物は例えば式（ＸＸＸＩＩ）



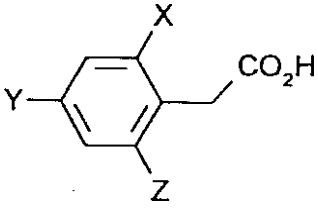
(XXXII)

式中、Ａ、Ｂ及びR^8は上記の意味を有する、
の２－ヒドロキシカルボン酸エステルを式（ＸＸＩＩ）



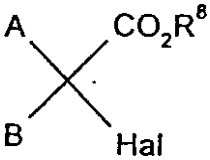
(XXII)

式中、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びＨａｌは上記の意味を有する、
の置換されたフェニルアセチルハロゲン化物でアシル化する場合に得られる［Chem.Reviews 52,237～416（1953）］。
更に、式（ＩＩＩ）の化合物は式（ＸＸＶ）



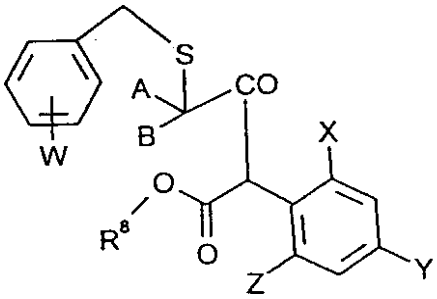
(XXV)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の置換されたフェニル酢酸を式（ＸＸＸＩＩＩ）



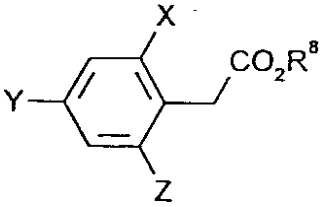
(XXXIII)

式中、Ａ、Ｂ及びR^8は上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素または臭素を表す、
のα－ハロゲノカルボン酸エステルと反応させ、そしてアルキル化する場合に得られる。
式（ＸＸＸＩＩＩ）の化合物は市販されるか、または公知の方法により簡単に製造し得る。
上記の工程（Ｃ）において出発物質として必要とされる式（ＩＶ）



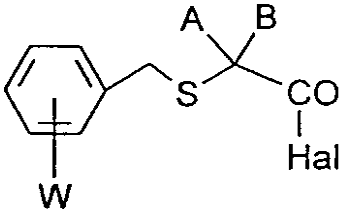
(IV)

式中、Ａ、Ｂ、Ｗ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8は上記の意味を有する、
の化合物は新規である。
これらのものは原理的に公知の方法により製造し得る。
式（ＩＶ）の化合物は例えば式（ＸＸＶＩ）



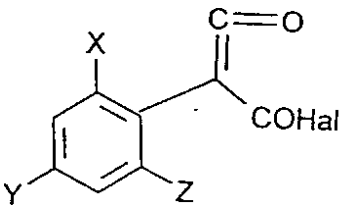
(XXVI)

式中、Ｘ、Ｙ、R^8及びＺは上記の意味を有する、
の置換されたフェニル酢酸エステルを強塩基の存在下で式（ＸＸＸＩＶ）



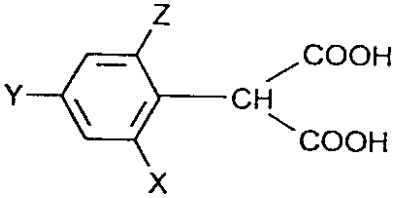
(XXXIV)

式中、Ａ、Ｂ及びＷは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲン（殊に塩素または臭素）を表す、
の２－ベンジルチオ－カルボニルハロゲン化物でアシル化する場合に得られる［例えばM.S.Chamber,E.J.Thomas,D.J.Williams,J.Chem.Soc.Chem.Commun.,（1987）,1228参照］。
式（ＸＸＸＩＶ）のベンジルチオ－カルボニルハロゲン化物のあるものは公知であり、そして／または公知の方法により製造し得る［J.Antibiotics（1983）,26,1589］。
工程（Ｅ）において出発物質として必要とされる式（Ｖ）のハロゲノカルボニルケテンは新規である。これらのものは原理的に公知の方法により簡単に製造し得る（例えばOrg.Prep.Proced.Int.,7,（4）,155～158,1975及びドイツ国特許第１，９４５，７０３号参照）。式（Ｖ）



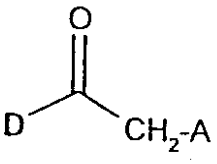
(V)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌは塩素または臭素を表す、
の化合物は式（ＸＸＸＶ）

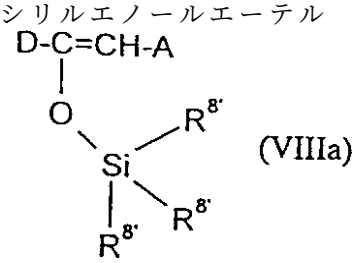


(XXXV)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の置換されたフェニルマロン酸を－２０乃至２００℃間、好ましくは０乃至１５０℃間の温度で、適当ならば触媒例えばジエチルホルムアミド、メチル－ステアリルホルムアミドまたはトリフェニルホスフィンの存在下、及び適当ならば塩基例えばピリジンまたはトリエチルアミンの存在下で酸ハロゲン化物例えば塩化チオニル、塩化リン（Ｖ）、塩化リン（ＩＩＩ）、塩化オキサリル、ホスゲンまたは臭化チオニルと反応させる場合に得られる。
式（ＸＸＸＶ）の置換されたフェニルマロン酸は新規である。しかしながら、これらのものは公知の方法により簡単に製造し得る［例えばOrganikum（Laboratory Practical in Organic Chemistry）,VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften,Berlin 1977,p.517以下参照］。
本発明による工程（Ｅ）に対して出発物質として必要とされる式（ＶＩＩＩ）のカルボニル化合物または式（ＶＩＩＩａ）のそのシリルエノールエーテル

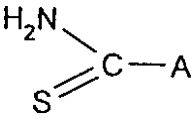


(VIII)



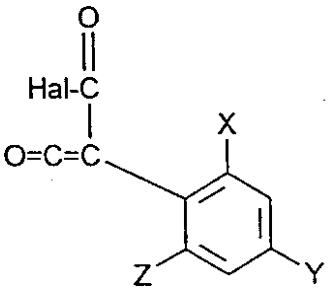
(VIIIa)

式中、Ａ、Ｄ及びR^8は上記の意味を有する、
は市販されるか、一般に公知であるか、または公知の方法により入手される。
本発明による工程（Ｆ）を行うために出発物質として必要とされる式（Ｖ）のケテン酸塩化物の製造は本発明による工程（Ｅ）において既に記載された。本発明による工程（Ｆ）を行うために必要とされる式（ＩＸ）



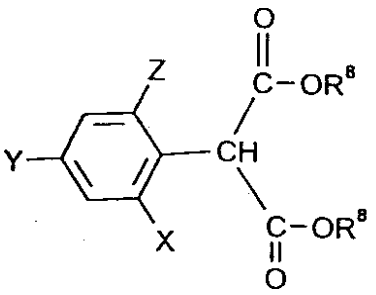
(IX)

式中、Ａは上記の意味を有する、
のチオアミドは有機化学において一般に公知である化合物である。
工程（Ｇ）において出発物質として必要とされる式（Ｉ－４－ａ）の化合物は公知であり、そして／または公知の方法により簡単に製造し得る（またＷＯ　９２／１６５１０参照）。
式（Ｉ－４－ａ）の化合物は例えば式（Ｖ）



(V)

式中、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有し、そして
Ｈａｌはハロゲン（殊に塩素または臭素）を表す、
の化合物または式（ＶＩ）



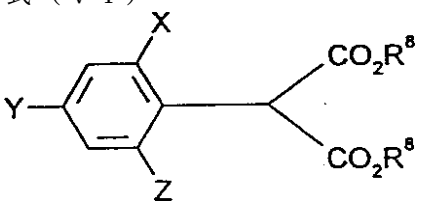
(VI)

式中、R^8、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
の化合物を－２０乃至２５０℃間、好ましくは０乃至１５０℃間の温度で、適当ならば希釈剤、適するものは炭化水素例えばトルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びＮ－メチル－ピロリドン、並びに式（ＶＩ）の化合物を用いる場合のみにアルコール例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソ－プロパノール、ブタノール、イソ－ブタノール及びｔ－ブタノールの存在下、並びに適当ならば塩基、適するものは式（Ｖ）の化合物を用いる場合は無機塩基、殊にアルカリ金属またはアルカリ土金属炭酸塩例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸カルシウム、及び有機塩基例えばピリジンまたはトリエチルアミン、並びに式（Ｖ）の化合物を用いる場合にアルカリ金属酸化物、アルカリ金属水酸化物及びアルカリ金属炭酸塩、アルカリ土金属酸化物、アルカリ土金属水酸化物及びアルカリ土金属炭酸塩例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウムの存在下で式（ＶＩＩ）

Ａ－ＮＨ－ＮＨ－Ｄ　　（ＶＩＩ）

式中、Ａ及びＤは上記の意味を有する、
のヒドラジンと反応させ、その際にその全ては相間移動触媒例えば塩化トリエチルベンジルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム、Adogen464［＝塩化メチルトリアルキル（C_8～C_{10}）アンモニウム］またはＴＤＡ１［＝トリス－（メトキシエトキシエチル）－アミン］、アルカリ金属例えばナトリウムまたはカリウム、アルカリ金属アミド、アルカリ金属水素化物、アルカリ土金属アミド及びアルカリ土金属水素化物例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウム、並びに、更にまたアルカリ金属アルコラート例えばナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート及びカリウムｔ－ブチラートの存在下で使用し得る。

式（ＶＩ）



(VI),

式中、R^8、Ｘ、Ｙ及びＺは上記の意味を有する、
のマロン酸エステルは新規である。これらのものは一般的に公知である有機化学の方法により合成し得る［例えばTetrahedron Lett.27,2763（1986）及びOrganikum（Laboratory Practical in Organic Chemistry）,VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften,Berlin 1977,p.587以下参照］。

式（ＶＩＩ）

Ａ－ＮＨ－ＮＨ－Ｄ　　（ＶＩＩ）

式中、Ａ及びＤは上記の意味を有する、
のヒドラジンはある場合に公知であり、そして／または文献から公知である方法により製造される［例えばLiebigs Ann.Chem.585,6（1957）;Reaktionen der organischen Synthese（有機合成における反応）、C.Ferri,212,513頁;Georg Thieme Verlag Stuttugart,197

8;Liebigs Ann.Chem.443,242（1925）;Chem.Ber.98,2551（1965）、ヨーロッパ特許第５０８，１２６号参照］。
その全てが本発明による工程（Ｇ）、（Ｈ）、（Ｉ）、（Ｊ）、（Ｋ）、（Ｌ）及び（Ｍ）を行うために出発物質として更に必要とされる式（Ｘ）の酸ハロゲン化物、式（ＸＩ）の無水カルボン酸、式（ＸＩＩ）のクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステル、式（ＸＩＩＩ）のクロロモノチオギ酸エステルまたはクロロジチオギ酸エステル、式（ＸＩＶ）のハロゲン化アルキル、式（ＸＶ）の塩化スルホニル、式（ＸＶＩ）のリン化合物、式（ＸＶＩＩ）及び（ＸＶＩＩＩ）の金属アルコラートまたはアミン、式（ＸＩＸ）のイソシアネート並びに式（ＸＸ）の塩化カルバモイルは一般に公知の有機または無機化学の化合物である。
更に、式（ＶＩＩ）、（ＶＩＩＩ）、（ＩＸ）～（ＸＸＩ）、（ＸＸＩＶ）及び（ＸＸＩＩ）～（ＸＸＸＩＶ）の化合物は初めに引用された特許出願に開示され、そして／またはこれらの出版物に記載される方法により製造し得る。
工程（Ａ）はＡ、Ｂ、Ｄ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8が上記の意味を有する式（ＩＩ）の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させることを特徴とする。
本発明による工程（Ａ）に使用し得る希釈剤は反応体に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばトルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びＮ－メチル－ピロリドン、並びにまたアルコール例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソ－プロパノール、ブタノール、イソ－ブタノール及びｔ－ブタノール。
本発明による工程（Ａ）を行うために使用し得る塩基（脱プロトン化剤）は全ての通常のプロトン受容体である。次のものを好適に使用し得る：その全てのものが相間移動触媒例えば塩化トリエチルベンジルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム、Adogen464［＝塩化メチルトリアルキル（C_8～C_{10}）アンモニウム］またはＴＤＡ１［＝トリス－（メトキシエトキシエチル）－アミン］の存在下で使用し得るアルカリ金属酸化物、アルカリ金属水酸化物及びアルカリ金属炭酸塩、アルカリ土金属酸化物、アルカリ土金属水酸化物及びアルカリ土金属炭酸塩例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム。アルカリ金属例えばナトリウムまたはカリウムを更に使用し得る。またアルカリ金属アミド、アルカリ金属水素化物、アルカリ土金属アミド及びアルカリ土金属水素化物例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウム、並びに更にまたアルカリ金属アルコラート例えばナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート及びカリウムｔ－ブチラートを用いることができる。
本発明による工程（Ａ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は０乃至２５０℃間、好ましくは５０乃至１５０℃間の温度で行う。
本発明による工程（Ａ）は一般に大気圧下で行う。
本発明による工程（Ａ）を行う場合、式（ＩＩ）の反応体及び脱プロトン化用塩基は一般に等モル量からほぼ等モル量の２倍までで用いる。しかしながらまた、あるまたは他の反応体を大過剰で（３モルまで）用いることができる。
工程（Ｂ）はＡ、Ｂ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8が上記の意味を有する式（ＩＩＩ）の化合物を希釈剤の存在下及び塩基の存在下で分子内縮合させる。
本発明による工程（Ｂ）に使用し得る希釈剤は反応体に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばトルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びＮ－メチル－ピロリドン。更にアルコール例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソ－プロパノール、ブタノール、イソ－ブタノール及びｔ－ブタノールを使用し得る。

本発明による工程（Ｂ）を行うために使用し得る塩基（脱プロトン化剤）は全ての通常のプロトン受容体である。次のものを好適に使用し得る：その全てのものが相間移動触媒例えば塩化トリエチルベンジルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム、Adogen464［＝塩化メチルトリアルキル（C_8～C_{10}）アンモニウム］またはＴＤＡ１［＝トリス－（メトキシエトキシエチル）－アミン］の存在下で使用し得るアルカリ金属酸化物、アルカリ金属水酸化物及びアルカリ金属炭酸塩、アルカリ土金属酸化物、アルカリ土金属水酸化物及びアルカリ土金属炭酸塩例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム。アルカリ金属例えばナトリウムまたはカリウムを更に使用し得る。またアルカリ金属アミド、アルカリ金属水素化物、アルカリ土金属アミド及びアルカリ土金属水素化物例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウム、並びに更にまたアルカリ金属アルコラート例えばナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート及びカリウムｔ－ブチラートを用いることができる。

本発明による工程（Ｂ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は０乃至２５０℃間、好ましくは５０乃至１５０℃間の温度で行う。

本発明による工程（Ｂ）は一般に大気圧下で行う。

本発明による工程（Ｂ）を行う場合、式（ＩＩＩ）の反応体及び脱プロトン化用塩基は一般に等モル量からほぼ等モル量の２倍までで用いる。しかしながらまた、あるまたは他の反応体を大過剰で（３モルまで）用いることができる。

工程（Ｃ）はＡ、Ｂ、Ｗ、Ｘ、Ｙ、Ｚ及びR^8が上記の意味を有する式（ＩＶ）の化合物を酸の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で分子内縮合させる。

本発明による工程（Ｃ）に使用し得る希釈剤は反応体に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばトルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びＮ－メチル－ピロリドン。更にアルコール例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソ－プロパノール、ブタノール、イソ－ブタノール及びｔ－ブタノールを使用し得る。

適当ならばまた、用いる酸は希釈剤として作用し得る。

本発明による工程（Ｃ）に使用し得る酸は全ての通常の無機及び有機酸例えばハロゲン化水素酸、硫酸、アルキル－、アリール－及びハロアルキルスルホン酸であり；殊に用いられる酸はハロゲン化されたアルキルカルボン酸例えばトリフルオロ酢酸である。

本発明による工程（Ｃ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は０乃至２５０℃間、好ましくは５０乃至１５０℃間の温度で行う。

本発明による工程（Ｃ）は一般に大気圧下で行う。

本発明による工程（Ｃ）を行う場合、式（ＩＶ）の反応体及び酸は一般に等モル量で用いる。しかしながらまた、適当ならば触媒量の酸を用いることができる。

本発明による工程（Ｅ）は式（ＶＩＩＩ）のカルボニル化合物または式（ＶＩＩＩａ）のそのシリルエノールエーテルを適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸受容体の存在下で式（Ｖ）のケテン酸ハロゲン化物と反応させることを特徴とする。

本発明による工程（Ｅ）に使用し得る希釈剤は反応体に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばトルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミドまたはＮ－メチル－ピロリドン。

本発明による工程（Ｅ）を行う場合に使用し得る酸受容体は全ての通常の酸受容体である。

次のものを好適に使用し得る：第三級アミン例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（ＤＡＢＣＯ）、ジアザビシクロウンデカン（ＤＢＵ）、ジアザビシクロノネン（ＤＢＮ）、ヒューニッヒ塩基またはＮ，Ｎ－ジメチル－アニリン。

本発明による工程（Ｅ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は０乃至２５０℃間、好ましくは５０乃至２２０℃間の温度で行う。
本発明による工程（Ｅ）は好ましくは大気圧下で行う。
本発明による工程（Ｅ）を行う場合、式（ＶＩＩＩ）または（ＶＩＩＩａ）及び（Ｖ）の反応体並びに適当ならば酸受容体は一般にほぼ等モル量で用いる。しかしながらまた、あるまたは他の反応体を大過剰で（５モルまで）用いることができる。
本発明による工程（Ｆ）は式（ＩＸ）のチオアミドを適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸受容体の存在下で式（Ｖ）のケテン酸ハロゲン化物と反応させることを特徴とする。
本発明による工程（Ｆ）に使用し得る希釈剤は反応体に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばｏ－ジクロロベンゼン、テトラリン、トルエン及びキシレン、更にエーテル例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、更に極性溶媒例えばジメチルスルホキド、スルホラン、ジメチルホルムアミドまたはＮ－メチル－ピロリドン。
本発明による工程（Ｆ）を行う場合に使用し得る酸受容体は全ての通常の酸受容体である。
次のものを好適に使用し得る：第三級アミン例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（ＤＡＢＣＯ）、ジアザビシクロウンデカン（ＤＢＵ）、ジアザビシクロノネン（ＤＢＮ）、ヒューニッヒ塩基またはＮ，Ｎ－ジメチル－アニリン。
本発明による工程（Ｆ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。便利には、本法は０乃至２５０℃間、好ましくは２０乃至２２０℃間の温度で行う。
本発明による工程（Ｆ）は好ましくは大気圧下で行う。
本発明による工程（Ｆ）を行う場合、式（ＩＸ）及び（Ｖ）の反応体並びに適当ならば酸受容体は一般にほぼ等モル量で用いる。しかしながらまた、あるまたは他の反応体を大過剰で（５モルまで）用いることができる。
本発明による工程（Ｇα）は式（Ｉ－１－ａ）の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で各々の場合に式（Ｘ）のカルボン酸ハロゲン化物と反応させることを特徴とする。
本発明による工程（Ｇα）に使用し得る希釈剤は酸ハロゲン化物に対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、更にハロゲン化された炭化水素例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びｏ－ジクロロベンゼン、更にケトン例えばアセトン及びメチルイソプロピルケトン、エーテル例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、加えてカルボン酸エステル例えば酢酸エチル、並びにまた強い極性溶媒例えばジメチルスルホキド及びスルホラン。酸ハロゲン化物物が加水分解に対して十分安定である場合、反応はまた水の存在下で行い得る。
本発明による工程（Ｇα）による反応に適する酸結合剤は全ての通常の酸受容体である。次のものを好適に使用し得る：第三級アミン例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（ＤＡＢＣＯ）、ジアザビシクロウンデカン（ＤＢＵ）、ジアザビシクロノネン（ＤＢＮ）、ヒューニッヒ塩基及びＮ，Ｎ－ジメチル－アニリン、更にアルカリ土金属酸化物例えば酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、更にアルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土金属炭酸塩例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属水酸化物例えば水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム。
本発明による工程（Ｇα）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は－２０乃至１５０℃間、好ましくは０乃至１００℃間の温度で行う。
本発明による工程（Ｇα）を行う場合、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発物質及びの式（Ｘ）のカルボン酸ハロゲン化物を一般に各々の場合にほぼ等モル量で用いる。しかしながらまた、カルボン酸ハロゲン化物を大過剰で（５モルまで）用いることができる。処理を常法により行う。

工程（Ｇβ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で各々の場合に式（ＸＩ）のカルボン酸無水物と反応させることを特徴とする。
本発明による工程（Ｇβ）に使用し得る希釈剤は好ましくは酸ハロゲン化物を用いる場合にも好適に適するものである。更にまた、過剰に用いるカルボン酸無水物は同時に希釈剤として作用し得る。
工程（Ｇβ）において随時加えられる酸結合剤は好ましくはまた酸ハロゲン化物を用いる場合にも好適に適する酸結合剤である。
本発明による工程（Ｇβ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。一般に、本法は－２０乃至１５０℃間、好ましくは０乃至１００℃間の温度で行う。
本発明による工程（Ｇβ）を行う場合、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発物質及び式（ＸＩ）のカルボン酸無水物を一般に各々の場合にほぼ等モル量で用いる。しかしながらまた、カルボン酸無水物を大過剰で（５モルまで）用いることができる。処理を常法により行う。
一般に、希釈剤並びに過剰のカルボン酸無水物及び生じるカルボン酸を蒸留または有機溶媒もしくは水での洗浄により除去する操作に従う。
工程（Ｈ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（Ｘ－ＩＩ）のクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステルと反応させることを特徴とする。
本発明による工程（Ｈ）に適する酸結合剤は全ての通常の酸受容体である。次のものを好適に使用し得る：第三級アミン例えばトリエチルアミン、ピリジン、ＤＡＢＣＯ、ＤＢＵ、ＤＢＮ、ヒューニッヒ塩基並びにＮ，Ｎ－ジメチル－アニリン、更にアルカリ土金属酸化物例えば酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、更にアルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土金属炭酸塩例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにまたアルカリ金属水酸化物例えば水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム。
本発明による工程（Ｈ）に使用し得る希釈剤はクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステルに対して不活性である全ての有機溶媒である。次のものを好適に使用し得る：炭化水素例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、更にハロゲン化された炭化水素例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びｏ－ジクロロベンゼン、更にケトン例えばアセトン及びメチルイソプロピルケトン、エーテル例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、加えてカルボン酸エステル例えば酢酸エチル、並びにまた強い極性溶媒例えばジメチルスルホキド及びスルホラン。
本発明による工程（Ｈ）を行う場合、反応温度は実質的な範囲内で変え得る。反応温度は一般に－２０乃至１００℃間、好ましくは０乃至５０℃間である。
本発明による工程（Ｈ）は一般に大気圧下で行う。
本発明による工程（Ｈ）を行う場合、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発物質及び式（ＸＩＩ）の関連するクロロギ酸エステルまたはクロロギ酸チオエステルを一般に各々の場合にほぼ等モル量で用いる。しかしながらまた、あるまたは他の反応体を大過剰で（２モルまで）用いることができる。処理を常法により行う。一般に、沈殿した塩を除去し、そして残った反応混合物を希釈剤を除去することにより濃縮する操作に従う。
本発明による工程（Ｉ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に（Ｉα）希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＩＩＩ）の化合物とか、或いは（Ｉβ）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば塩基の存在下で二硫化炭素及び続いて式（ＸＩＶ）のアルキルハロゲン化物と反応させることを特徴とする。
製造方法（Ｉα）において、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発物質１モル当たり約１モルの式（ＸＩＩＩ）のクロロモノチオギ酸エステルまたはクロロジチオギ酸エステルを０～１２０℃、好ましくは２０～６０℃で反応させる。
随時加えられる適当な希釈剤は全ての不活性極性有機溶媒例えばエーテル、アミド、スルホン、スルホキシド、またハロゲノアルカンである。

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを好適に用いる。
好適な具体例において、化合物（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）のエノラート塩を強脱プロトン化剤例えば水素化ナトリウムまたはカリウムｔ－ブチラートを加えることにより合成する場合、更に酸結合剤を添加することは省略し得る。
酸結合剤を用いる場合、適当な物質は通常の無機または有機塩基であり、挙げ得る例には水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン及びトリエチルアミンがある。
反応は大気圧下または昇圧下、好ましくは大気圧下で行い得る。処理は常法により行う。
製造方法（Ｉβ）において、各々の場合に式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発化合物１モル当たり等モル量または過剰の二硫化炭素を加える。本法は好ましくは０～５０℃、殊に２０～３０℃の温度で行う。
塩基（例えばカリウムｔ－ブチラートまたは水素化ナトリウム）を加えることにより式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物から対応する塩を最初に調製することがしばしば便利である。化合物（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）を各々の場合に例えば室温で数時間撹拌した後に中間体の生成が完了するような期間二硫化炭素と反応させる。
工程（Ｉβ）に使用し得る塩基は全ての通常のプロトン受容体である。次のものが好適に適する：アルカリ金属水素化物、アルカリ金属アルコラート、アルカリ金属炭酸塩、アルカリ金属炭酸水素塩、アルカリ土金属炭酸塩、アルカリ土金属炭酸水素塩または窒素塩基。挙げ得る例には例えば水素化ナトリウム、ナトリウムメチラート、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、トリエチルアミン、ジベンジルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン、キノリン、ジアザビシクロオクタン（ＤＡＢＣＯ）、ジアザビシクロノネン（ＤＢＮ）及びジアザビシクロウンデセン（ＤＢＵ）がある。
本法に使用し得る希釈剤は全ての通常の溶媒である。
次のものを好適に使用し得る：芳香族炭化水素例えばベンゼンまたはトルエン、アルコール例えばメタノール、エタノール、イソプロパノールまたはエチレングリコール、ニトリル例えばアセトニトリル、エーテル例えばテトラヒドロフランまたはジオキサン、アミド例えばジメチルホルムアミド、或いは他の極性溶媒例えばジメチルスルホキシドまたはスルホラン。
更に式（ＸＩＶ）のアルキルハロゲン化物との反応は好ましくは０～７０℃、殊に２０～５０℃で行う。少なくとも等モル量のアルキルハロゲン化物を用いる。
本法は大気圧下または昇圧下、好ましくは大気圧下で行う。
再び、処理は常法により行う。
本発明による工程（Ｊ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶ）の塩化スルホニルと反応させることを特徴とする。
製造方法（Ｊ）において、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発化合物１モル当たり約１モルの式（ＸＶ）の塩化スルホニルを－２０～１５０℃、好ましくは２０～７０℃で反応させる。
工程（Ｊ）は好ましくは希釈剤の存在下で行う。
使用し得る希釈剤は全ての不活性極性有機溶媒例えばエーテル、アミド、ニトリル、スルホン、スルホキシド、ハロゲン化された炭化水素例えば塩化メチレンである。
ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを好適に用いる。
好適な具体例において、化合物（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）のエノラート塩を強脱プロトン化剤（例えば水素化ナトリウムまたはカリウムｔ－ブチラート）を加えることにより合成する場合、更に酸結合剤を添加することは省略し得る。
酸結合剤を用いる場合、適当な物質は通常の無機または有機塩基であり、挙げ得る例には水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン及びトリエチルアミンがあ

る。
反応は大気圧下または昇圧下、好ましくは大気圧下で行い得る。処理は常法により行う。
本発明による工程（Ｋ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＶＩ）のリン化合物と反応させることを特徴とする。
製造方法（Ｋ）において、式（Ｉ－１－ｅ）～（Ｉ－６－ｅ）の化合物を得るために、化合物（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）１モル当たり１～２、好ましくは１～１．３モルの式（ＸＶＩ）のリン化合物を－４０乃至１５０℃間、好ましくは－１０乃至１１０℃間の温度で反応させる。
工程（Ｋ）は好ましくは希釈剤の存在下で行う。
適当な希釈剤は全ての不活性極性有機溶媒例えばエーテル、アミド、ニトリル、アルコール、スルフィド、スルホン、スルホキシドなどである。
アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを好適に用いる。
随時加えられる適当な酸結合剤は通常の無機または有機塩基例えば水酸化物、炭酸塩またはアミンである。挙げ得る例には水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン及びトリエチルアミンがある。
反応は大気圧下または昇圧下、好ましくは大気圧下で行い得る。処理は有機化学の常法により行う。最終生成物は好ましくは結晶化、クロマトグラフィーまたはいわゆる「初期蒸留」、即ち真空中での揮発成分の除去により精製する。
工程（Ｌ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に適当ならば希釈剤の存在下で式（ＸＶＩＩ）の金属水酸化物または金属アルコラート或いは式（ＸＶＩＩＩ）のアミンと反応させることを特徴とする。
本発明による工程（Ｌ）に使用し得る希釈剤は好ましくはエーテル例えばテトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジエチルエーテル、或いは他にアルコール例えばメタノール、エタノールまたはイソプロパノール、また水である。本発明による工程（Ｌ）は一般に大気圧下で行う。反応温度は一般に－２０乃至１００℃間、好ましくは０乃至５０℃間である。
本発明による工程（Ｍ）は式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の化合物を各々の場合に（Ｍα）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば触媒の存在下で式（ＸＩＸ）の化合物とか、或いは（Ｍβ）適当ならば希釈剤の存在下及び適当ならば酸結合剤の存在下で式（ＸＸ）の化合物と反応させることを特徴とする。
製造方法（Ｍα）において、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発化合物１モル当たり約１モルの式（ＸＩＸ）のイソシアネートを０～１００℃、好ましくは２０～５０℃で反応させる。
工程（Ｍα）は好ましくは希釈剤の存在下で行う。
適当な希釈剤は全ての不活性有機溶媒例えばエーテル、アミド、ニトリル、スルホンまたはスルホキシドである。
適当ならば、反応を加速するために触媒を加える。使用し得る触媒は極めて有利には有機スズ化合物例えばジラウリン酸ジブチルスズである。
本法は好ましくは大気圧下で行う。
製造方法（Ｍβ）において、式（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）の出発化合物１モル当たり約１モルの式（ＸＸ）の塩化カルバモイルを０～１５０℃、好ましくは２０～７０℃で反応させる。
随時加えられる希釈剤は全ての不活性の極性有機溶媒例えばエーテル、アミド、スルホン、スルホキシドまたはハロゲン化された炭化水素である。
ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを好適に用いる。
好適な具体例において、化合物（Ｉ－１－ａ）～（Ｉ－６－ａ）のエノラート塩を強脱プロトン化剤例えば水素化ナトリウムまたはカリウムｔ－ブチラートを加えることにより合

成する場合、更に酸結合剤を添加することは省略し得る。
酸結合剤を用いる場合、適当な物質は通常の無機または有機塩基であり、挙げ得る例には水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたはピリジンがある。
反応は大気圧下または昇圧下、好ましくは大気圧下で行い得る。処理は常法により行う。
活性化合物は農業、林業、貯蔵製品及び材料の保護において、そして衛生分野において遭遇する動物性有害生物（pest）、好ましくは節足動物及び線虫（nematode）、殊に昆虫及びクモ（arachnid）の防除に適している。それらは通常の敏感性の及び抵抗性の種及び全てのまたはある成長段階に対して活性である。上記した有害生物には、次のものが包含される：
等脚目（Isopoda）のもの、例えばオニスカス・アセルス（Oniscus asellus）、オカダンゴムシ（Armadillidium vulgare）、及びポルセリオ・スカバー（Porcellio scabar）。
倍脚綱（Diplopoda）のもの、例えば、ブラニウルス・グットラタス（Blaniulus guttulatus）。
チロポダ目（Chilopoda）のもの、例えば、ゲオフィルス・カルポファグス（Geophilus carpohagus）及びスカチゲラ（Scutigera spp.）。
シムフィラ目（Symphyla）のもの、例えばスカチゲレラ・イマキュラタ（Scutigerella immaculata）。
シミ目（Thysanura）のもの、例えばレプシマ・サッカリナ（Lepisma saccharina）。
トビムシ目（Collembola）のもの、例えばオニチウルス・アルマツス（Onychiurus armatus）。
直翅目（Orthoptera）のもの、例えばブラッタ・オリエンタリス（Blatta orientalis）、ワモンゴキブリ（Periplaneta americana）、ロイコファエ・マデラエ（Leucophaea maderae）、チヤバネ・ゴキブリ（Blattella germanica）、アチータ・ドメスチクス（Acheta domesticus）、ケラ（Gryllotalpa spp.）、トノサマバッタ（Locusta migratoria migratorioides）、メラノプルス・ジフェレンチアリス（Melanoplus differentialis）及びシストセルカ・グレガリア（Schistocerca gregaria）。
ハサミムシ目（Dermaptere）のもの、例えばホルフィキュラ・アウリクラリア（Forficula auricularia）。
シロアリ目（Isoptera）のもの、例えばレチキュリテルメス（Reticulitermes spp.）。
シラミ目（Anoplura）のもの、例えばフィロクセラ・バスタリクス（Phylloxera vastatrix）、ペンフィグス（Pemphigus spp.）及びヒトジラミ（Pediculus humanus corporis）、ケモノジラミ（Haematopinus spp.）及びケモノホソジラミ（Linognathus spp.）。
ハジラミ目（Mallophaga）のもの、例えばケモノハジラミ（Trichodectes spp.）及びダマリネア（Damalinea spp.）。
アザミウマ目（Thysanoptera）のもの、例えばクリバネアザミウマ（Hercinothrips femoralis）及びネギアザミウマ（Thrips tabaci）。
半翅目（Heteroptera）のもの、例えばチャイロカメムシ（Eurygaster spp.）、ジスデルクス・インテルメジウス（Dysdercus intermedius）、ピエスマ・クワドラタ（Piesma quadrata）、ナンキンムシ（Cimex lectularius）、ロドニウス・プロリクス（Rhodnius prolixus）及びトリアトマ（Triatoma spp.）。
同翅目（Homoptera）のもの、例えばアレウロデス・ブラシカエ（Aleurodes brassicae）、ワタコナジラミ（Bemisia tabaci）、トリアレウロデス・バポラリオルム（Trialeurodes vaporariorum）、ワタアブラムシ（Aphis gossypii）、ダイコンアブラムシ（Brevicoryne brassicae）、クリプトミズス・リビス（Cryptomyzus ribis）、ドラリス・ファバエ（Doralis fabae）、ドラリス・ポミ（Doralis pomi）、リンゴワタムシ（Eriosoma lanigerum）、モモコフキアブラムシ（Hyalopterus arundinis）、ムギヒゲナガアブラムシ（Macrosiphum avenae）、コブアブラムシ（Myzus spp.）、ホップイボアブラムシ（Phorodon humuli）、ムギクビレアブラムシ（Rhopalosiphum padi）、ヒメヨコバイ（Empoasca spp.）、ユースセリス・ビロバツス（Euscelis bilobatus）、ツマグロヨコバイ（Nephotettix cincticeps）、ミズキカタカイガラムシ（Lecanium corni）、オリーブカタカイ

ガラムシ（Saissetia oleae）、ヒメトビウンカ（Laodelphax striatellus）、トビイロウンカ（Nilaparvata lugens）、アカマルカイガラムシ（Aonidiella aurantii）、シロマルカイガラムシ（Aspidiotus hederae）、プシュードコッカス（Pseudococcus spp.）及びキジラミ（Psylla spp.）。
鱗翅目（Lepidoptera）のもの、例えばワタアカミムシ（Pectinophora gossypiella）、ブパルス・ピニアリウス（Bupalus piniarius）、ケイマトビア・ブルマタ（Cheimatobia brumata）、リソコレチス・ブランカルデラ（Lithocolletis blancardella）、ヒポノミュウタ・パデラ（Hyponomeuta padella）、コナガ（Plutella maculipennis）、ウメケムシ（Malacosoma neustria）、クワノキンムケシ（Euproctis chrysorrhoea）、マイマイガ（Lyman-tria spp.）、ブッカラトリックス・スルベリエラ（Bucculatrix thurberiella）、ミカンハモグリガ（Phyllocnistis citrella）、ヤガ（Agrotis spp.）、ユークソア（Euxoa spp.）、フェルチア（Feltia spp.）、エアリアス・インスラナ（Earias insulana）、ヘリオチス（Heliothis spp.）、ヒロイチモジヨトウ（Laphygma exigua）、ヨトウムシ（Mamestra brassicae）、パノリス・フラメア（Panolis flammea）、ハスモンヨトウ（Prodenia litura）、シロナヨトウ（Spodoptera spp.）、トリコプルシア・ニ（Trichoplusia ni）、カルポカプサ・ポモネラ（Carpocapsa pomonella）、アオムシ（Pieris spp.）、ニカメイチユウ（Chilo spp.）、アワノメイガ（Pyrausta nubilalis）、スジコナマダラメイガ（Ephestia kuehniella）、ハチミツガ（Galleria mellonella）、テイネオラ・ビセリエラ（Tineola bisselliella）、テイネア・ペリオネラ（Tinea pellionella）、ホフマノフィラ・プシュードスプレテラ（Hofmannophila pseudospretella）、カコエシア・ポダナ（Cacoecia podana）、カプア・レチクラナ（Capua reticulana）、クリストネウラ・フミフェラナ（Choristoneura fumiferana）、クリシア・アンビグエラ（Clysia ambiguella）、チヤハマキ（Homona magnanima）、及びトルトリクス・ビリダナ（Tortrix viridana）。
鞘翅目（Coleoptera）のもの、例えばアノビウム・プンクタツム（Anobium punctatum）、コナナガシンクイムシ（Rhizopertha dominica）、ブルキジウス・オブテクツス（Bruchidius obtectus）、インゲンマメゾウムシ（Acanthoscelides obtectus）、ヒロトルペス・バジュルス（Hylotrupes bajulus）、アゲラスチカ・アルニ（Agelastica alni）、レプチノタルサ・デセムリネアタ（Leptinotarsa decemlineata）、フエドン・コクレアリアエ（Phaedon cochleariae）、ジアブロチカ（Diabrotica spp.）、プシリオデス・クリソセファラ（Psylliodes chrysocephala）、ニジュウヤホシテントウ（Epilachna varivestis）、アトマリア（Atomaria spp.）、ノコギリヒラタムシ（Oryzaephilus surinamensis）、ハナゾウムシ（Anthonomus spp.）、コクゾウムシ（Sitophilus spp.）、オチオリンクス・スルカツス（Otiorrhychus sulcatus）、バショウゾウムシ（Cosmopolites sordidus）、シュートリンクス・アシミリス（Ceuthorrhynchus assimillis）、ヒペラ・ポスチカ（Hyperapostica）、カツオブシムシ（Dermestes spp.）、トロゴデルマ（Trogoderma spp.）、アントレヌス（Anthrenus spp.）、アタゲヌス（Attagenus spp.）、ヒラタキクイムシ（Lyctus spp.）、メリゲテス・アエネウス（Meligethes aeneus）、ヒョウホンムシ（Ptinus spp.）、ニプツス・ホロレウカス（Niptus hololeucus）、セマルヒョウホンムシ（Gibbium psylloides）、コクヌストモドキ（Tribolium spp.）、チャイロコメノゴミムシダマシ（Tenebrio molitor）、コメツキムシ（Agriotes spp.）、コノデルス（Conoderus spp.）、メロロンサ・メロロンサ（Melolontha melolontha）、アムフィマロン・ソルスチチアリス（Amphimallon solstitialis）及びコステリトラ・ゼアランジカ（Costelytra zealandica）。
膜翅目（Hymenoptera）のもの、例えばマツハバチ（Diprion spp.）、ホプロカムパ（Hoplocampa spp.）、ラシウス（Lasius spp.）、イエヒメアリ（Monomorium pharaonis）及びスズメバチ（Vespa spp.）。
双翅目（Diptera）のもの、例えばヤブカ（Aedes spp.）、ハマダラカ（Anopheles spp.）、イエカ（Culex spp.）、キイロショウジョウバエ（Drosophila melanogaster）、イエバエ（Musca spp.）、ヒメイエバエ（Fannia spp.）、クロバエ・エリスロセファラ（C

alliphoro erythrocephala）、キンバエ（Lucilia spp.）、オビキンバエ（Chrysomya spp.）、クテレブラ（Cuterebra spp.）、ウマバエ（Gastrophilus spp.）、ヒッポボスカ（Hyppobosca spp.）、サシバエ（Stomoxys spp.）、ヒツジバエ（Oestrus spp.）、ウシバエ（Hypoderma spp.）、アブ（Tabanus spp.）、タニア（Tannia spp.）、ケバエ（Bibio hortulanus）、オスシネラ・フリト（Oscinella frit）、クロキンバエ（Phorbia spp.）、アカザモグリハナバエ（Pegomyia hyoscyami）、セラチチス・キャピタータ（Ceratitis capitata）、ミバエオレアエ（Dacus oleae）及びガガンボ・パルドーサ（Tipula paludosa）。

ノミ目（Siphonapterida）のもの、例えばケオプスネズミノミ（Xenopsylla cheopis）及びナガノミ（Ceratopyllus spp.）。

蜘形網（Arachnida）のもの、例えばスコルピオ・マウルス（Scorpio maurus）及びラトロデクタス・マクタンス（Latrodectus mactans）。

ダニ目（Acarina）のもの、例えばアシブトコナダニ（Acarus siro）、ヒメダニ（Argas spp.）、カズキダニ（Ornithodoros spp.）、ワクモ（Dermanyssus gallinae）、エリオフィエス・リビス（Eriophyes ribis）、ミカンサビダニ（Phyllocoptruta oleivora）、オウシマダニ（Boophilus spp.）、コイタマダニ（Rhipicephalus spp.）、アンブリオマ（Amblyomma spp.）、イボマダニ（Hyalomma spp.）、マダニ（Ixodes spp.）、キュウセンヒゼンダニ（Psoroptes spp.）、ショクヒヒゼンダニ（Chorioptes spp.）、ヒゼンダニ（Sarcoptes spp.）、ホコリダニ（Tarsonemus spp.）、クローバハダニ（Bryobia praetiosa）、ミカンリンゴハダニ（Panonychus spp.）及びナミハダニ（Tetranychus spp.）。

本発明による活性化合物は高度な殺虫及び殺ダニ（acaricidal）活性に特徴がある。これらのものは植物を損傷する昆虫例えばマスタード・ビートル（mustard beetle）（Phaedon cochleariae）の幼虫またはツマグロヨコバイ（Nephotettix cincticeps）の幼虫またはコナガ（Plutella maculipennis）の幼虫を防除するために殊に良好に使用し得る。

本発明による活性化合物は更に落葉剤、乾燥剤、広葉樹の破壊剤及び、特に殺雑草剤として使用することができる。雑草とは、最も広い意味において、雑草を望まない場所に生長するすべての植物を意味する。本発明による物質は、本質的に使用量に依存して完全除草剤または選択的除草剤として作用する。

雑草を防除するために必要とされる本発明による活性化合物の投与割合は０．００１乃至１０ｋｇ／ｈａ間、好ましくは０．００５乃至５ｋｇ／ｈａ間である。

本発明による活性化合物は、例えば、次の植物に関連して使用することができる：

次の属の双子葉雑草：カラシ属（Sinapis）、マメグンバイナズナ属（Leipidium）、ヤエムグラ属（Galium）、ハコベ属（Stellaria）、シカギク属（Matricaria）、カミツレモドキ属（Anthemis）、ガリンソガ属（Galinsoga）、アカザ属（Chenopodium）、イラクサ属（Urtica）、キオン属（Senecio）、ヒユ属（Amaranthus）、スベリヒユ属（Portulaca）、オナモミ属（Xanthium）、ヒルガオ属（Convolvulus）、サツマイモ属（Ipomoea）、タデ属（Polygonum）、セスバニア属（Sesbania）、オナモミ属（Ambrosia）、アザミ属（Cirsium）、ヒレアザミ属（Carduus）、ノゲシ属（Sonchus）、ナス属（Solanum）、イヌガラシ属（Rorippa）、キカシグサ属（Rotala）、アゼナ属（Lindernia）、ラミウム属（Lamium）、クワガタソウ属（Veronica）、イチビ属（Abutilon）、エメクス属（Emex）、チョウセンアサガオ属（Datura）、スミレ属（Viola）、チシマオドリコ属（Galeopsis）、ケシ属（Papaver）、センタウレア属（Centaurea）、ツメクサ属（Trifolium）、キツネノボタン属（Ranunculus）及びタンポポ属（Taraxacum）。

次の属の双子葉栽培植物：ワタ属（Gossypium）、ダイズ属（Glycine）、フダンソウ属（Beta）、ニンジン属（Daucus）、インゲンマメ属（Phaseolus）、エンドウ属（Pisum）、ナス属（Solanum）、アマ属（Linum）、サツマイモ属（Ipomoea）、ソラマメ属（Vicia）、タバコ属（Nicotiana）、トマト属（Lycopersicon）、ラッカセイ属（Arachis）、アブラナ属（Brassica）、アキノノゲシ属（Lactuca）、キュウリ属（Cucumis）及びウリ属（

Cucurbita）。
次の属の単子葉雑草：ヒエ属（Echinochloa）、エノコログサ属（Setaria）、キビ属（Panicum）、メヒシバ属（Digitaria）、アワガリエ属（Phleum）、スズメノカタビラ属（Poa）、ウシノケグサ属（Festuca）、オヒシバ属（Eleusine）、ブラキアリア属（Brachiaria）、ドクムギ属（Lolium）、スズメノチヤヒキ属（Bromus）、カラスムギ属（Avena）、カヤツリグサ属（Cyperus）、モロコシ属（Sorghum）、カモジグサ属（Agropyron）、シノドン属（Cynodon）、ミズアオイ属（Monochoria）、テンツキ属（Fimbristylis）、オモダカ属（Sagittaria）、ハリイ属（Eleocharis）、ホタルイ属（Scirpus）、パスパルム属（Paspalum）、カモノハシ属（Ischaemum）、スフェノクレア属（Sphenoclea）、ダクチロクテニウム属（Dactyloctenium）、ヌカボ属（Agrostis）、スズメノテッポウ属（Alopecurus）及びアペラ属（Apera）。
次の属の単子葉栽培植物：イネ属（Oryza）、トウモロコシ属（Zea）、コムギ属（Triticum）、オオムギ属（Hordeum）、カラスムギ属（Avena）、ライムギ属（Secale）、モロコシ属（Sorghum）、キビ属（Panicum）、サトウキビ属（Saccharum）、アナナス属（Ananas）、クサスギカズラ属（Asparagus）およびネギ属（Allium）。
しかしながら、本発明による活性化合物の使用はこれらの属にまったく限定されず、同じ方法で他の植物に及ぶ。
化合物は、濃度に依存して、例えば工業地域及び鉄道線路上、樹木が存在するか或いは存在しない道路及び広場上の雑草の完全防除に適する。同等に、化合物は多年生栽培植物、例えば造林、装飾樹木、果樹園、ブドウ園、かんきつ類の木立、クルミの果樹園、バナナの植林、コーヒーの植林、茶の植林、ゴムの木の植林、油ヤシの植林、カカオの植林、小果樹の植え付け及びホップの栽培植物の中の雑草の防除に、そして１年生栽培植物中の雑草の選択的防除に使用することができる。
本発明による活性化合物は発芽前及び発芽後法により双子葉の栽培植物における単子葉の雑草の選択的防除に高度に適している。これらのものは例えばワタまたは砂糖大根における草性の雑草を防除するために極めて良好に使用し得る。
本活性化合物は普通の組成物例えば、溶液、乳液、水和剤、懸濁剤、粉末、包沫剤、塗布剤、可溶性粉末、顆粒、懸濁乳化濃厚剤、活性化合物を含浸させた天然及び合成物質、並びに重合物質中の極く細かいカプセルに変えることができる。
これらの組成物は公知の方法において、例えば活性化合物を伸展剤、即ち液体溶媒及び／または固体の担体と随時表面活性剤、即ち乳化剤及び／または分散剤及び／または発泡剤と混合して製造される。
また伸展剤として水を用いる場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。液体溶媒として、主に、芳香族炭化水素例えばキシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン、塩素化された芳香族もしくは塩素化された脂肪族炭化水素例えばクロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素例えばシクロヘキサン、またはパラフィン例えば鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール例えばブタノールもしくはグリコール並びにそのエーテル及びエステル、ケトン例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン、強い有極性溶媒例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド並びに水が適している。
固体の担体として、例えばアンモニウム塩及び粉砕した天然鉱物、例えばカオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト、またはケイソウ土並びに粉砕した合成鉱物例えば高度に分散性ケイ酸、アルミナ及びシリケートが適している；粒剤に対する固体の担体として、粉砕し且つ分別した天然岩、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石並びに無機及び有機のひきわり合成顆粒及び有機物質の顆粒例えばおがくず、やしがら、トウモロコシ穂軸及びタバコの茎が適している；乳化剤及び／または発泡剤として非イオン性及び陰イオン性乳化剤例えばポリオキシエチレン－脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪族アルコールエーテル例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネート並びにアルブミン加水分解生成物が適している；分散剤として、例えばリグニン－ス

ルファイト廃液及びメチルセルロースが適している。
接着剤例えばカルボキシメチルセルロース並びに粉状、粒状またはラテックス状の天然及び合成重合体例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリビニルアセテート並びに天然リン脂質例えばセファリン及びレシチン、及び合成リン脂質を組成物に用いることができる。更に添加物は鉱油及び植物油であることができる。
着色剤例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー並びに有機染料例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、及び微量の栄養剤例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を用いることができる。
調製物は一般に活性化合物０．１乃至９５重量％間、好ましくは０．５乃至９０重量％間を含有する。
本発明による活性化合物は商業的に入手可能な調製物中及びこれらの調製物から製造された使用形態中で、他の活性化合物例えば殺虫剤、誘引剤（attractant）、滅菌剤、殺ダニ剤（acaricides）、殺線虫剤（nematicides）、殺菌・殺カビ剤（fungicides）、生長調節物質または除草剤との混合物として存在し得る。殺虫剤には例えばリン酸塩、カルバミン酸塩、カルボン酸塩、塩素化された炭化水素、フェニル尿素、微生物により製造された物質等が含まれる。
混合物に対して殊に有利な成分の例には次のものがある：
殺菌・殺カビ剤：
２－アミノブタン；２－アニリノ－４－メチル－６－シクロプロピル－ピリミジン；２′，６′－ジブロモ－２－メチル－４′－トリフルオロメトキシ－４′－トリフルオロ－メチル－１，３－チアゾール－５－カルボキシアニリド；２，６－ジクロロ－Ｎ－（４－トリフルオロメチルベンジル）－ベンズアミド；（Ｅ）－２－メトキシイミノ－Ｎ－メチル－２－（２－フェノキシフェニル）－アセトアミド；硫酸８－ヒドロキシキノリン；（Ｅ）－２－｛２－［６－（２－シアノフェノキシ）－ピリミジン－４－イルオキシ］フェニル｝－３－メトキシアクリル酸メチル；（Ｅ）－メトキシイミノ［アルファ－（ｏ－トリルオキシ）－ｏ－トリル］酢酸メチル；２－フェニルフェノール（ＯＰＰ）、アルジモルフ、アムプロピルフォス、アニラジン、アザコナゾール、ベナラキシル、ベノダニル、ベノミル、ビナパクリル、ビフェニル、ビテルタノール、ブラスチシジン－Ｓ、ブロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルシウムポリスルフィド、カプタフォル、カプタン、カルベンダジム、カルボキシン、キノメチオネート、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロゾリネート、クフラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロフラム、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、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、ジメチリモル、ジメトモルフ、ジニコナゾール、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリムフォス、ジチアノン、ドジン、ドラゾキソロン、エディフェンフォス、エポキシコナゾール、エチリモル、エトリジアゾール、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェニトロパン、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、酢酸フェンチン、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルオロミド、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルトリアフォル、フォルペット、フォセチル－アルミニウム、フタリド、フベリダゾール、フララキシル、フルメシクロックス、グアザチン、ヘキサクロロベンゼン、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、イプロベンフォス（ＩＢＰ）、イプロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン、銅調製物例えば水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシン－銅及びボルドー混合物、マンカッパー、マンコゼブ、マネブ、メパニピリム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトスルホバックス、ミクロブタニル、ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタル－イソプロピル、ヌアリモル、オフレース、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシカルボキシン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、フォスジフェン、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、

プロピコナゾール、プロピネブ、ピラゾフォス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、キントゼン（ＰＣＮＢ）、硫黄及び硫黄調製物、テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チシオフェン、チオファネート－メチル、チラム、トルクロフォス－メチル、トリルフルアニド、トリアジメフォン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダマイシンＡ、ビンクロゾリン、ジネブ、ジラム。

殺バクテリア剤：

ブロノポル、ジクロロフェン、ニトラピリン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅調製物。

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン、ＡＣ　３０３　６３０、アセフェート、アクリナトリン、アラニカルブ、アルジカルブ、アルファメトリン、アミトラズ、アベルメクチン、ＡＺ　６０５４１、アザジラクチン、アジンフォスＡ、アジンフォスＭ、アザサイクロチン、バシルス・ツリンジエンシス（Bacillus thuringiensis）、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベタシルトリン、ビフェントリン、ＢＰＭＣ、ブロフェンブロックス、ブロモフォスＡ、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブトカルボキシン、ブチルピリダベン、カズサフォス、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カータップ、ＣＧＡ　１５７４１９、ＣＧＡ　１８４６９９、クロエトカルブ、クロエトキシフォス、クロルフェンビンフォス、クロルフルアズロン、クロルメフォス、クロルピリフォス、クロルピリフォスＭ、シス－レスメトリン、クロシトリン、クロフェンテジン、シアノフォス、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、デメトンＭ、デメトンＳ、デメトン－Ｓ－メチル、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジクリフォス、ジクロトフォス、ジエチオン、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルビンフォス、ジオキサチオン、ジスルホトン、エジフェンフォス、エマメクチン、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、エチオン、エトフェンプロックス、エトプロフォス、エトリムフォス、フェナミフォス、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノブカルブ、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、フェンピラド、フェンピロキシメート、フェンチオン、フェンチオン、フェンバレレート、フイプロニル、フルアジナム、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェノクスロン、フルフェンプロクス、フルバリネート、フォノフォス、フォルモチオン、フォスチアゼート、フブフェンプロクス、フラチオカルブ、ＨＣＨ、ヘプテノフォス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、イミダクロプリド、イプロベンフォス、イサゾフォス、イソフェンフォス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、ラムダ－シハロトリン、ルフェヌロン、マラチオン、メカルバム、メルビンフォス、メスルフェンフォス、メタアルデヒド、メタアクリフォス、メタアミドフォス、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、ミルベメクチン、モノクロトフォス、モキシデクチン、ナレド、ＮＣ　１８４、ＮＩ　２５、ニテンピラム、オメトエート、オキサミル、オキシデメトンＭ、オキシデプロフォス、パラチオンＡ、パラチオンＭ、パーメトリン、フェントエート、フォレート、フォサロン、フォスメット、フォスファムロン、フォキシム、ピリミカルブ、ピリミフォスＭ、ピリミフォスＡ、プロフェノフォス、プロメカルブ、プロパフォス、プロポクスル、プロチオフォス、プロチオホス、プロトエート、ピメトロジン、ピラクロフォス、ピラダフェンチオン、ピレスメトリン、ピレトラム、ピリダベン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、キナルフォス、ＲＨ　５９９２、サリチオン、セブフォス、シラフルオフェン、スルフォテップ、スルプロフォス、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムフォス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメフォス、テルバム、テルブフォス、テトラクロルビンフォス、チアフェノックス、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオナジン、ツリンジエンシン、トラロメトリン、トリアラテン、トリアゾフ

ォス、トリアズロン、トリクロルフオン、トリフルムロン、トリメタカルブ、バミドチオン、ＸＭＣ、キシリルカルブ、ＹＩ　５３０１／５３０２、ゼータメトリン。
除草剤：
例えばアニリド例えばジフルフェニカン及びプロパニル；アリールカルボン酸例えばジクロロピコリン酸、ジカンバ及びピコロラム；アリールオキシアルカン酸例えば２，４－Ｄ、２，４－ＤＢ、２，４－ＤＰ、フルメロキシピル、ＭＣＰＡ、ＭＣＰＰ及びトリクロピル；アリールオキシ－フェノキシ－アルカン酸エステル例えばジクロホップ－メチル、フェノキサプロップ－エチル、フルアジホップ－ブチル、ハロキシホップ－メチル及びキザロホップ－エチル；アジノン例えばクロリダゾン及びノルフルラゾン；カルバメート例えばクロルプロファム、デスメジファム、フェンメジファム及びプロファム、クロロアセトアニリド例えばアラクロル、アセトクロル、ブタクロル、メタザクロル、メトラクロル、プレチラクロル及びプロパクロル；ジニトロアニリン例えばオリザリン、ペンジメタリン及びトリフルラリン；ジフェニルエステル例えばアシフルオルフェン、ビフェノックス、フルオログリコフェン、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン及びオキシフルオルフェン；ウレア例えばクロルトルロン、ジウロン、フルオメツロン、イソプロツロン、リヌロン及びメタベンズチアズロン；ヒドロキシルアミン例えばアロキシジム、クレトジム、シクロキシジム、セトキシジム及びトラルコキシジム；イミダゾリノン例えばイマゼタピル、イマザメタベンズ、イマザピル及びイマザキン；ニトリル例えばブロモキシニル、ジクロベニル及びイオキシニル；オキシアセトアミド例えばメフェナセット；スルホニルウレア例えばアミドスルフロン、ベンスルフロン－メチル、クロリムロン－エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、メトスルフロン－メチル、ニコスルフロン、プリミスルフロン、ピラゾスルフロン－エチル、チフェンスルフロン－メチル、トリアスルフロン及びトリベヌロン－メチル；チオカルバメート例えばブチレート、シクロエート、ジ－アレート、ＥＰＴＣ、エスプロカルブ、モリネート、プロスルホカルブ、チオベンカルブ及びトリ－アレート；トリアジン例えばアトラジン、シアナジン、シマジン、シメトリン、ターブトリン及びターブチラジン；トリアジノン例えばヘキサジノン、メタミトロン及びメトリブジン；他のもの例えばアミノトリアゾール、ベンフレセート、ベンタゾン、ジンメチリン、クロマゾン、クロピラリド、ジフェンゾクアット、ジチオピル、エトフメセート、フルオロクロリドン、グルホシネート、クリホセート、イソキサベン、ピリデート、キンクロラック、キンメラック、スルホセート及びトリジファン。
本発明による活性化合物はまたその通常の商業的配合剤中及びこれらの配合剤から製造された使用形態中で、相乗剤との混合物として存在することもできる。相乗剤とは加えられる相乗剤自身は活性である必要はないが、活性化合物の活性を増加させる化合物である。通常の商業的配合剤から製造された使用形態の活性化合物含量は広範囲にわたって変化させることができる。使用形態の活性化合物濃度は０．０００００００１～９５重量％の、好ましくは０．０００１乃至１重量％間の活性化合物であり得る。
化合物は使用形態に適する通常の方法で使用される。
健康に有害な有害生物及び貯蔵製品の有害生物に対して使用するときには、活性化合物は木材及び土壌上に優れた残存活性を有し、並びに石灰処理した物質上でのアルカリに対する良好な安定性を有することに特色がある。
本発明による活性化合物は植物、衛生及び貯蔵生成物の有害生物に対するばかりでなく、獣医学分野において動物性寄生虫（外部寄生虫）例えばスケリー・チック（scaley tick）、ヒメダニ（Argasidae）、スカブ・マイト（scab mite）、ケダニ（Trombidae）、ハエ（刺し、そして吸う）、寄生ハエの幼虫、シラミ、ケジラミ、トリジラミ及びノミに対しても活性がある。これらの寄生虫には次のものが含まれる：
シラミ目（Anoplurida）のもの、例えばケモノジラミ（Haematopinus spp.）、ケモノホソジラミ（Linognathus spp.）、ペディクルス（Pediculus spp.）、フチルス（Phtirus spp.）、ソレノポテス（Solenopotes spp.）。
ハジラミ目（Mallophagida）並びに亜目アンブリセリナ（Amblycerina）及びイスクノセリナ（Ischnocerina）のもの、例えばトリメノポン（Trimenopon spp.）、メノポン（Men

opon spp.）、トリノトン（Trinoton spp.）、ボビコラ（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ（Wernckiella spp.）、レピケントロン（Lepikentron spp.）、ダマリナ（Damalina spp.）、トリコデクテス（trichodectes spp.）、フェリコラ（Felicola spp.）。
双翅目（Diptera）並びに亜目ネマトセリナ（Nematocerina）及びブラキセリナ（Brachycerina）のもの、例えばヤブカ（Aedes spp.）、ハマダラカ（Anopheles spp.）、イエカ（Culex spp.）、シムリウム（Simulium spp.）、エウシムリウム（Eusimulium spp.）、フレボトムス（Phlebotomus spp.）、ルゾミイア（Lutzomyia spp.）、クリコイデス（Culicoides spp.）、クリソプス（Chrysops spp.）、ヒボミトラ（Hybomitra spp.）、アチロツス（Atylotus spp.）、タバヌス（Tabanus spp.）、ヘマトポタ（Haematopota spp.）、フィリポミイア（Philipomyia spp.）、ブラウラ（Braula spp.）、イエバエ（Musca spp.）ヒドロタエア（Hydrotaea spp.）、ストモキシス（Stomoxys spp.）、ヘマトビア（Haematobia spp.）、モレリア（Morellia spp.）、ファニア（Fannia spp.）、グロシナ（Glossina spp.）、カリフォラ（Calliphora spp.）、ルシリア（Lucilia spp.）、クリソミア（Chrysomyia spp.）、ウォールファールリア（Wohlfahrlia spp.）、サルコファーガ（Sarcophaga spp.）、エストルス（Oestrus spp.）、ヒポデルマ（Hypoderma spp.）、ガステロフィルス（Gastrophilus spp.）、ヒポボスカ（Hippobosca spp.）、リポプテナ（Lipoptena spp.）、メロファグス（Melophagus spp.）。
ノミ目（Siphonapterida）のもの、例えばプレックス（Pulex spp.）、クテノセファリデス（Ctenocephalides spp.）ケオプスネズミノミ（Xenopsylla cheopis）、ナガノミ（Ceratopyllus spp.）。
異翅亜目（Heteropterida）のもの、例えばシメックス（Cimex spp.）、トリアトーマ（Triatoma spp.）、ロドニウス（Rhodnius spp.）、パンスロンギルス（Panstrongyrus spp.）。
ゴキブリ類（Blattarida）のもの、例えばコバネゴキブリ（Blattela orientalis）、ワモンゴキブリ（Periplaneta americana）、ゴキブリ（Blattela germanica）、スペラ（Supella spp.）。
ダニ目（Acaria）（Acarida）並びにメター（Meta-）及びメソスチグマタ（Mesostigmata）のもの、例えばヒメダニ（Argas spp.）、カズキダニ（Ornithodoros spp.）、オタビウス（Otabius spp.）、マダニ（Ixodes spp.）、アンブリオマ（Amblyomma spp.）、オウシマダニ（Boophilus spp.）、デルマセントル（Dermacentor spp.）、ヘマフィサリス（Haemaphysalis spp.）、イボマダニ（Hyalomma spp.）、コイタマダニ（Rhipicephalus spp.）、ワクモ（Dermanyssus gallinae）、ライリエチア（Raillietia spp.）、ニューモニスス（Pneumonyssus spp.）ステルノストルマ（Sternostorma spp.）及びバロア（Varroa spp.）。
前気門亜目［Actinedida（Prostigmata）及び壁蟹目［Acaridida（Astigmata）］のもの、例えばアカラピス（Acarapis spp.）、ケイレティエラ（Cheyletiella spp.）、オルニトケイレチア（Ornithocheyletia spp.）、ミオビア（Myobia spp.）、プソレルガテス（Psorergates spp.）、デモデックス（Demodex spp.）、トロンビキュラ（Trombicula spp.）、リストロフォルス（Listrophorus spp.）、アカルス（Acarus spp.）、チロファグス（Tyrophagus spp.）、カログリフス（Caloglyphus spp.）、ヒポデクテス（Hypodectes spp.）、プテロリクス（Pterolichus spp.）、プソロプテス（Psoroptes spp.）、コリオプテス（Chorioptes spp.）、オトデクテス（Otodectes spp.）、サルコプテス（Sarcoptes spp.）、ノトエドレス（Notoedres spp.）、クネミドコプテス（Knemidocoptes spp.）、シトジテス（Cytodites spp.）、ラミノシオプテス（Laminosioptes spp.）。
例えば、これらのものはオウシマダニ（Boophilus microplus）及びヒツジウジバエ（Lucilia cuprina）に対して顕著な活性を示す。
本発明による式（Ｉ）の活性化合物はまた農業における家畜動物例えばウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、ヤギュウ、ウサギ、ニワトリ、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、ハチ、他の家庭用動物例えばイヌ、ネコ、かごのトリ、水族館の魚並びにいわゆる実験動物例えばハムスター、モルモット、ラット及びマウスに感染する節足動物の

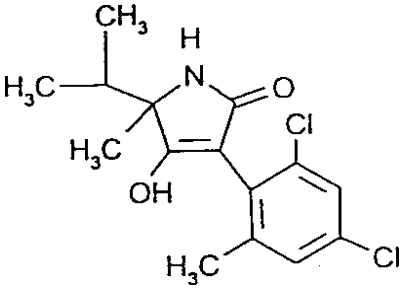
防除に適する。これらの節足動物を防除する目的は死及び収穫量（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、ハチミツなどにおける）の減少を減じることにあり、従って本発明による活性化合物の使用により動物の飼育がより経済的に、かつより簡単になる。
獣医分野において、本発明による活性化合物は例えば錠剤、カプセル剤、水剤、飲薬、粒剤、塗布剤、大丸薬、フィード・スルー（feed-through）法及び坐薬の形態での経腸的投与、例えば注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）による非経腸的投与、移植、経鼻投与、浸漬または入浴、スプレー、滴下（pouring on）及びスポッティング（spotting on）、洗浄、パウダリング（powdering）の状態の経皮投与により、そして活性化合物を含む成形製品例えば首輪、イヤー・マーク（ear mark）、テイル（tail）・マーク、リム・バンド（limb band）、はづな、標識器具などを用いて公知の方法で施用する。
家畜、家禽、家庭用動物等に用いる場合、式（Ｉ）の活性化合物は１～８０重量％の量の活性化合物からなる調製物（例えば粉末、乳液、自由流動組成物）として直接にか、または１００～１０，０００倍に希釈した後に施用することができるか、またはこれらのものは化学浴として施用し得る。
更に、本発明による式Ｉの化合物は工業材料を破壊する昆虫に対して有効な殺虫作用を有する。
次の昆虫を例として、そして好適なものとして挙げ得るが、これに限定されない：
甲虫、例えばヒロトルペス・バジュルス（Hylotrupes bajulus）、クロロホルス・ピロシス（Chlorophorus pilosis）、アノビウム・プンクタツム（Anobium punctatum）、キセストビウム・ルフオビロスム（Xestobium rufovillosum）、プチリヌス・ペクチコルニス（Ptilinus pecticornis）、デンドロビウム・ペルチネクス（Dendrobium pertinex）、エルノビウス・モリス（Ernobius mollis）、プリオビウム・カルピニ（Priobium carpini）、リクツス・ブルネウス（Lyctus brunneus）、リクツス・アフリカヌス（Lyctus africanus）、リクツス・プラニコリス（Lictus planicollis）、リクツス・リネアリス（Lyctus linearis）、リクツス・プベセンス（Lictus pubescens）、トロゴキシロン・アエクアレ（Trogxylon aequale）、ミンテス・ルジコリス（Minthes rugicollis）、キシレボルス種（Xyleborus spec.）、トリプトデンドロン種（Tryptodendron spec.）、アパテ・モノクス（Apate monochus）、ボストリクス・カプシンス（Bostrychus capucins）、ヘテロボストリクス・ブルネウス（Heterobostrychus brunneus）、シノキシロン種（Sinoxylon spec.）、デイノデルス・ミヌツス（Dinoderus minutus）
膜翅目、例えばシレックス・ジュベンクス（Sirex juvencus）、ウロセルス・ギガス（Urocerus gigas）、ウロセルス・ギガス・タイグヌス（Urocerus gigas taignus）、ウロセルス・アウグル（Urocerus augur）。
白蟻、例えばカロテルメス・フラビコリス（Kalotermes flavicollis）、クリプトテルメルス・ブレビス（Cryptotermers brevis）、ヘテロテルメス・インジコラ（Heterotermes indicola）、レチクリテルメス・フラビペス（Reticulitermes flavipes）、レチクリテルメス・サントネンシス（Reticulitermes santonensis）、レチクリテルメス・ルシルグス（Reticulitermes lucilugus）、マストテルメス・ダルウイニエンシス（Mastotermes darwiniensis）、ズーテルモプシス・ネバデンシス（Zootermopsis nevadensis）、コプトテルメス・ホルモサヌス（Coptotermes formosanus）。
しみ（bristletails）、例えばレピスマ・サッカリナ（Lepisma saccharina）。
これに関連して、工業用材料とは非生物材料例えば、好ましくは合成材料、糊料、サイズ剤、紙及びボード、皮革、木材及び誘導された木材生成物、並びに塗料を意味する。
昆虫による攻撃に対して保護される材料は極めて殊に好ましくは木材及び誘導された木材生成物である。
本発明によるま薬剤またはこのものからなる組成物により保護され得る木材及び誘導された木材生成物は、例えば構造用木材、木製角材、線路のまくら木、架橋部品、防波堤、木製の車、箱、パレット、容器、電話機、木製被覆材、木製の窓及びドア、合板、削片板、建具屋の仕事または建設業もしくはビル建築に全く一般的に用いられる木材ベースの材料を意味するものとして理解されよう。

活性化合物はそのままでか、濃厚剤または一般には調製物例えば粉末、顆粒、溶液、懸濁液、乳液またはペーストの状態で使用し得る。
上記の調製物はそれ自体公知の方法で、例えば活性化合物を溶媒もしくは希釈剤、乳化剤、分散剤及び／または結合剤または固定剤、撥水剤、適当ならば乾燥剤及びＵＶ安定剤並びに適当ならば着色剤及び顔料並びに他の処理助剤と混合することにより製造し得る。
木材及び誘導された木材生成物の保護に用いられる殺虫組成物または濃厚剤は０．０００１～９５重量％、殊に０．００１～６０重量％の濃度の本発明による活性化合物からなる。
用いる組成物または濃厚剤の量は昆虫の種及び頻度並びに媒質に依存する。施用する最適量は各々の場合に使用の際の試験群により求めることができる。しかしながら、保護する材料をベースとして０．０００１～２０重量％、好ましくは０．００１～１０重量％の活性化合物を用いることで一般に十分である。
用いる溶媒及び／または希釈剤は有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／または油状もしくは油タイプの有機化学溶媒もしくは低揮発性及び／または極性の有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／または水並びに、適当ならば乳化剤及び／または湿潤剤である。
好適に用いる有機化学溶媒は３５以上の蒸発数（evaporation number）及び３０℃以上、好ましくは４５℃以上のフラッシュ点を有する油状もしくは油タイプの溶媒である。適当な鉱油もしくはその芳香族フラクションまたは鉱油含有溶媒混合物、好ましくはホワイト・スピリット（white spirit）、石油及び／またはアルキルベンゼンを低揮発性を有し、そして水に不溶性であるかかる油状及び油タイプの溶媒として用いる。
１７０～２２０℃の沸点範囲を有する鉱油、１７０～２２０℃の沸点範囲を有するホワイト・スピリット、２５０～３５０℃の沸点範囲を有するスピンドル油、１６０～２８０℃の沸点範囲を有する石油及び芳香族、マツヤニの油などを用いることが有利である。
好適な具体例において、用いる物質は１８０～２１０℃の沸点範囲を有する液体脂肪族炭化水素または１８０～２２０℃の沸点範囲を有する芳香族及び脂肪族炭化水素の高沸点混合物及び／またはスピンドル油及び／またはモノクロロナフタレン、好ましくはα-モノクロロナフタレンである。
３５以上の蒸発数及び３０℃以上、好ましくは４５℃以上のフラッシュ点を有する低揮発性の有機性の油状もしくは油タイプの溶媒を部分的に高または中程度の揮発性の有機化学溶媒に代えることができ、但しまた溶媒混合物は３５以上の蒸発数及び３０℃以上、好ましくは４５℃以上のフラッシュ点を有し、そして殺虫剤／殺菌・殺カビ剤混合物はこの溶媒混合物に可溶性または乳化可能であることとする。
好適な具体例において、有機化学溶媒または溶媒混合物の一部は脂肪族極性有機化学溶媒または溶媒混合物に代えられる。好適に用いる物質はヒドロキシル及び／またはエステル及び／またはエーテル基を含む脂肪族の有機化学溶媒例えばグリコールエーテル、エステルなどを用いる。
本発明の範囲内で用いる有機化学結合剤はそれ自体公知であり、そして水で希釈することができ、そして／または用いる有機化学溶媒中に溶解、分散もしくは乳化することができる結合乾燥油及び／または合成樹脂、殊にアクリレート樹脂、ビニル樹脂例えばポリ酢酸ビニル、ポリエステル樹脂、重縮合もしくは重付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂もしくは好ましくは中程度の油分の改質アルキド樹脂、フエノール樹脂、炭化水素樹脂例えばインゲン／クマロン樹脂、シリコーン樹脂、乾燥植物及び／または乾燥油及び／または天然及び／または合成樹脂をベースとする物理的乾燥結合剤からなる結合剤である。
結合剤として用いる合成樹脂は乳液、分散体または溶液の状態で使用し得る。また１０重量％までの量のビチューメンまたはビチューメン状物質を結合剤として使用し得る。加えて、それ自体公知である着色剤、顔料、撥水剤、消臭物質及び阻害剤または腐蝕防止剤を殊に使用し得る。
本発明による組成物または濃厚物は好ましくは有機化学結合剤として少なくとも１つのアルキド樹脂または改質アルキド樹脂及び／または乾燥植物油からなる。本発明により好適に用いられる物質は４５重量％以上、好ましくは５０～６８重量％の油含有量を有するア

ルキル樹脂である。
上記結合剤は固定剤（混合物）または可塑剤（混合物）に全体的にか、または部分的に代えることができる。これらの添加剤は活性化合物の揮発、結晶化または沈殿を防止するためのものである。これらのものは結合剤の０．０１～３０％（用いる結合剤１００％をベースとして）を代替する。
可塑剤はフタル酸エステル例えばフタル酸ジブチル、フタル酸ジオクチルまたはフタル酸ベンジルブチル、リン酸エステル例えばリン酸トリブチル、アジピン酸エステル例えばアジピン酸ジ-（２-エチルヘキシル）、ステアリン酸エステル例えばステアリン酸ブチルまたはステアリン酸アミル、オレイン酸エステル例えばオレイン酸ブチル、グリセリンエーテルまたは高分子量グリコールエーテル、グリセリンエステル及びｐ-トルエンスルホン酸エステルの化学群からのものである。
化学的には、固定剤はポリビニルアルキルエーテル例えばポリビニルメチルエーテルまたはケトン例えばベンゾフエノン、エチルベンゾフエノンをベースとする。
他の適当な溶媒または希釈剤は殊に、適当ならば１つまたはそれ以上の上記の有機化学溶媒または希釈剤、乳化剤及び分散剤との混合物としての水である。
殊に有効な木材の保護は工業規模の含浸法、例えば真空、二重真空または圧力法により達成される。
適当ならば、調製済組成物は他の殺虫剤及び、適当ならば１つまたはそれ以上の他の殺菌・殺カビ剤からなり得る。
混合し得る追加の成分は好ましくはＷＯ　９４／２９，２６８に挙げられる殺虫剤及び殺菌・殺カビ剤である。上記の文献に挙げられる化合物は本明細書の一部として表される。
極めて殊に好適に混合し得る成分は殺虫剤例えばクロロピリホス、フォキシム、シラフロフィン、アルファメトリン、シフルトリン、シペルメトリン、デルタメトリン、パーメトリン、イミダクロプリド、ＮＩ－２５、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン及びトリフルムロン、並びに殺菌・殺カビ剤例えばエポキシコナゾール、ヘキサコナゾール、アザコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、イマザリル、ジクロルフルアニド、トリルフルアニド、３－ヨード－２－プロピニルブチルカルバメート、Ｎ－オクチル－イソチアゾリン－３－オン及び４，５－ジクロロ－Ｎ－オクチルイソチアゾリン－３－オン。
本発明による活性化合物の製造及び使用は次の実施例から知り得る。

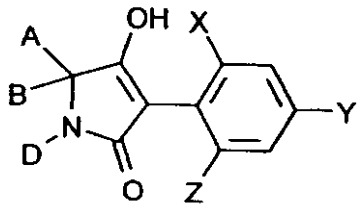
製造実施例

実施例（Ｉ－１－ａ－１）



無水トルエン１６０ｍｌ中の実施例（ＩＩ－１）の化合物２５．１ｇ（０．０７２モル）を還流温度で無水テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）５５ｍｌ中のカリウムｔ－ブチラート１７．３６ｇ（０．１５９モル）に滴加し、そして混合物を還流下で１．５時間撹拌した。処理のために、水２３０ｍｌを加え、水相を分別し、トルエン相を水１２０ｍｌを用いて抽出し、水相を一緒にし、トルエンで洗浄し、そして１０～２０℃で濃ＨＣｌ約２５ｍｌで酸性にした。生成物を吸引濾過し、洗浄し、乾燥し、そしてメチルｔ－ブチル（ＭＴＢ）エチル／ｎ－ヘキサン中で撹拌することにより洗浄した。
収量：１６．７ｇ（理論値の７３％）、融点：１５９℃。
次の式（Ｉ－１－ａ）の化合物が同様にか、または一般的製造方法に従って得られた：

表10

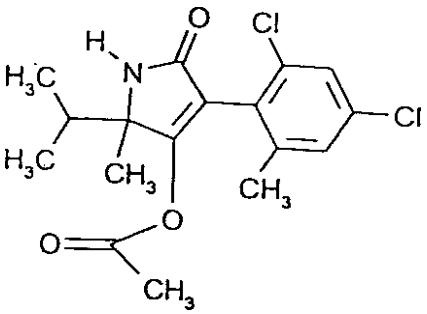


(I-1-a)

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	融点 °C	異性体
I-1-a-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	192	ß
I-1-a-3	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		H	176	-
I-1-a-4	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	189	ß
I-1-a-5	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	>220	-
I-1-a-6	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	216	ß
I-1-a-7	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	>220	ß
I-1-a-8	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	209	ß
I-1-a-9	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		H	>220	-
I-1-a-10	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	>220	-
I-1-a-11	Cl	CH_3	Cl	$i\text{-}C_3H_7$	CH_3	H	>220	-
I-1-a-12	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	>220	ß
I-1-a-13	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		>220	-
I-1-a-14	Cl	Cl	CH_3	H	H	$i\text{-}C_3H_7$	>220	-
I-1-a-15	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	>220	α
I-1-a-16	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	148	ß
I-1-a-17	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	>220	ß
I-1-a-18	Br	Cl	CH_3	CH_3	CH_3	H	>220	-

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	融点 ℃	異性体
I-1-a-19	Br	Cl	CH_3	CH_3	i-C_3H_7	H	>200	-
I-1-a-20	Br	CH_3	Cl	-$(CH_2)_2$-$CHCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	219	ß
I-1-a-21	Br	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	206	-
I-1-a-22	Cl	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CH(CH_3)$-$(CH_2)_2$-		H	>220	ß
I-1-a-23	Cl	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-O-$(CH_2)_2$-		H	>220	-
I-1-a-24	Cl	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	>220	ß
I-1-a-25	Cl	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	>220	-
I-1-a-26	Cl	CH_3	Cl	H	-CH_2-$CHCH_3$-$CHCH_3$-		201	

実施例（Ｉ－１－ｂ－１）

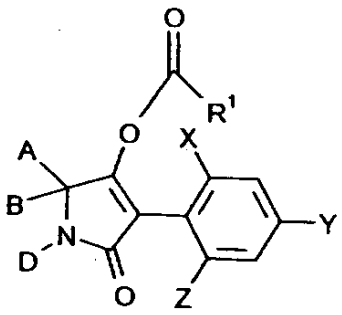


無水塩化メチレン７０ｍｌ中の実施例（Ｉ－１－ａ－１）の化合物４．７ｇ（０．０１５モル）及びトリエチルアミン４．２ｍｌ（３０ミリモル）を無水塩化メチレン５ｍｌ中の塩化アセチル２．１４ｍｌ（０．０３モル）を用いて０～１０℃で処理した。混合物を薄層クロマトグラフィーのチェックにより反応が終了したことを確認するまで室温で撹拌した。処理のために、混合物を０．５Ｎ水酸化ナトリウム溶液５０ｍｌを用いて２回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥し、そして蒸発させた。粗製生成物をＭＴＢエーテル／ｎ－ヘキサンから再結晶した。

収量：２．３０ｇ（理論値の４３％）、融点：２１１℃。

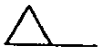
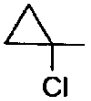
次の式（Ｉ－ｂ－１）の化合物が同様にか、または一般的製造方法に従って得られた：

表11



(I-1-b)

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^1	融点 °C	異性体
I-1-b-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	CH_3-	>220	ß
I-1-b-3	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	$i-C_3H_7-$	191	ß
I-1-b-4	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	$H_5C_2-O-CH_2-$	168	ß
I-1-b-5	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	C_6H_5-	>220	ß
I-1-b-6	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	$t-C_4H_9-CH_2-$	218	ß
I-1-b-7	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		H	CH_3-	>220	-
I-1-b-8	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		H	$i-C_3H_7-$	188	-
I-1-b-9	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		H	$t-C_4H_9-CH_2-$	>220	-
I-1-b-10	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_1-$		H	CH_3-	>220	ß
I-1-b-11	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_1-$		H	$i-C_3H_7-$	189	ß
I-1-b-12	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_1-$		H	$4-Cl-C_6H_4-$	>220	ß
I-1-b-13	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_1-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$H_3CO-CH_2-CHCH_3-$	>220	ß
I-1-b-14	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	CH_3-	216	-
I-1-b-15	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	187	-
I-1-b-16	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	$s-C_4H_9-$	198	-

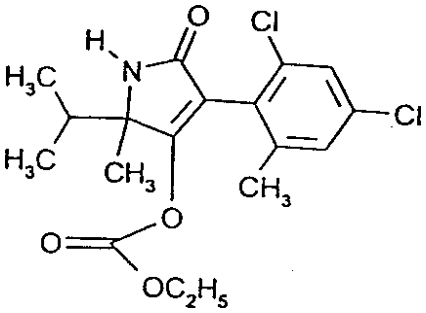
実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^1	融点 °C	異性体
I-1-b-17	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	C_2H_5-	>220	-
I-1-b-18	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	>220	ß
I-1-b-19	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	CH_3-	>220	ß
I-1-b-20	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	$i-C_3H_7-$	190	ß
I-1-b-21	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	CH_3-	>220	-
I-1-b-22	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	215	-
I-1-b-23	Cl	CH_3	Cl	$i-C_3H_7$	CH_3	H	CH_3-	209	-
I-1-b-24	Cl	CH_3	Cl	$i-C_3H_7$	CH_3	H	$i-C_3H_7-$	105	-
I-1-b-25	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	183	ß
I-1-b-26	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$H_5C_2-O-CH_2-$	>220	ß
I-1-b-27	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$t-C_4H_9-CH_2-$	219	ß
I-1-b-28	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	>220	ß
I-1-b-29	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$H_5C_2-O-CH_2-$	>220	ß
I-1-b-30	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$t-C_4H_9-CH_2-$	197	ß
I-1-b-31	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$i-C_3H_7-$	193	α[a)]
I-1-b-32	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	$H_5C_2-O-CH_2-$	171	α[a)]
I-1-b-33	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$C_2H_5O-CH_2-$	156	ß
I-1-b-34	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H		219	ß
I-1-b-35	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H		185	ß
I-1-b-36	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$i-C_4H_9-$	160	ß

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^1	融点 °C	異性体
I-1-b-37	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$C_4H_9-CH(C_2H_5)-CH_2-$	141	ß
I-1-b-38	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	cyclohexyl	>220	ß
I-1-b-39	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	$C(CH_3)_2=CH-$	219	ß
I-1-b-40	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	3-(6-Cl-pyridyl)-	167	ß
I-1-b-41	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	2-thienyl-	213	ß
I-1-b-42	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	2-furanyl-	>220	ß
I-1-b-43	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		t-C_4H_9-	147	-
I-1-b-44	Br	Cl	CH_3	CH_3	CH_3	H	i-C_4H_9-	164	-
I-1-b-45	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	CH_3-	>220	ß
I-1-b-46	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	i-C_3H_7-	210	ß
I-1-b-47	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	C_2H_5-O-CH_2-	158	ß
I-1-b-48	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	4-Cl-C_6H_4-	213	ß
I-1-b-49	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	i-C_3H_7-	216	-
I-1-b-50	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	i-C_4H_9-	>220	-
I-1-b-51	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	C_2H_5-O-CH_2-	217	-
I-1-b-52	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	$C(CH_3)_2=CH-$	205	-
I-1-b-53	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	i-C_3H_7-	192	ß
I-1-b-54	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	C_2H_5-O-CH_2-	173	ß
I-1-b-55	Cl	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	i-C_3H_7-	161	-

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^1	融点 °C	異性体
I-1-b-56	Cl	CH_3	Cl	H	H	i-C_3H_7	t-C_4H_9-	104	
I-1-b-57	Cl	CH_3	Cl	H	-CH_2-$CHCH_3$-$CHCH_3$-		t-C_4H_9	oil	

[a] α異性体は溶離液として塩化メチレン／酢酸エチル２：１を用いるシリカゲル上でのα及びβ異性体の混合物のクロマトグラフィー分離により得られた。

実施例（Ｉ－１－ｃ－１）

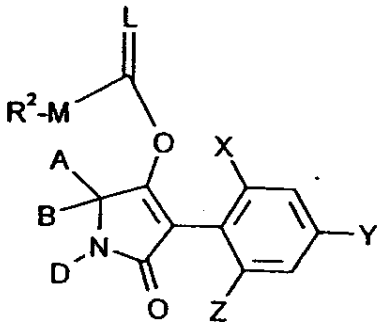


無水塩化メチレン５ｍｌ中のクロロギ酸エチル１．８ｍｌ（１８ミリモル）を０～１０℃で無水ＴＨＦ７０ｍｌ中の実施例（Ｉ－１－ａ－１）の化合物４．７ｇ（０．０１５モル）及びトリエチルアミン２．１ｍｌに滴加し、そして混合物を薄層クロマトグラフィーのチェックにより反応が終了したことを確認するまで室温で撹拌した。処理のために、混合物を０．５Ｎ水酸化ナトリウム溶液５０ｍｌを用いて２回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥し、そして蒸発させた。

収量：４．０ｇ（理論値の６９％）、融点：＞２２０℃。

次の式（Ｉ－１－ｃ）の化合物が同様にか、または一般的製造方法に従って得られた：

表12



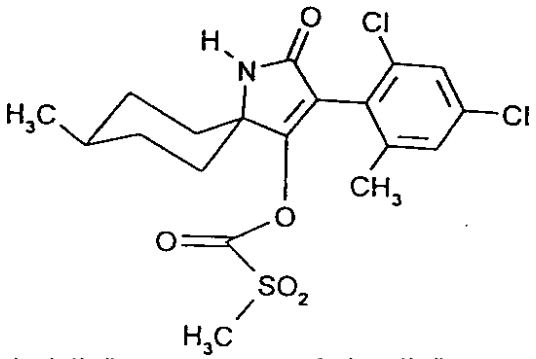
(I-1-c)

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	L	M	R^2	融点 °C	異性体
I-1-c-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	O	O	C_2H_5-	196	β
I-1-c-3	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		H	O	O	C_2H_5-	182	-
I-1-c-4	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	196	β
I-1-c-5	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	>220	-
I-1-c-6	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	201	β
I-1-c-7	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	O	O	C_2H_5-	206	β
I-1-c-8	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	197	-
I-1-c-9	Cl	CH_3	Cl	CH_3	$i-C_3H_7$	H	O	O	C_2H_5-	174	-
I-1-c-10	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	>220	β
I-1-c-11	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	176	β
I-1-c-12	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	198	α*)
I-1-c-13	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	$i-C_4H_9-$	201	β
I-1-c-14	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_6H_5-	>220	β
I-1-c-15	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	$C_6H_5-CH_2-$	>220	β
I-1-c-16	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	$s-C_4H_9-$	206	β
I-1-c-17	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	S	$t-C_4H_9-CH_2-$	232	β
I-1-c-18	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	S	$s-C_4H_9-$	205	β
I-1-c-19	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	S	$i-C_3H_7-$	218-220	β

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	L	M	R^2	融点 °C	異性体
I-1-c-20	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	S	$C_6H_5-CH_2-$	179-181	β
I-1-c-21	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	S	t-C_4H_9-	245-247	β
I-1-c-22	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		O	S	t-C_4H_9-	oil	
I-1-c-23	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		O	S	t-$C_4H_9-CH_2-$	oil	
I-1-c-24	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		O	S	s-C_4H_9-	oil	
I-1-c-25	Cl	Cl	CH_3	H	H	i-C_3H_7	O	S	t-$C_4H_9-CH_2-$	oil	
I-1-c-26	Cl	Cl	CH_3	H	H	i-C_3H_7	O	S	s-C_4H_9-	84-86	
I-1-c-27	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	>220	β
I-1-c-28	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	O	O	C_2H_5-	>220	-
I-1-c-29	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	O	O	i-C_4H_9-	>220	-
I-1-c-30	Cl	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	O	O	i-C_4H_9-	132	-
I-1-c-31	Cl	CH_3	Cl	H	H	i-C_3H_7	O	S	t-C_4H_9-	141	-
I-1-c-32	Cl	CH_3	Cl	H	$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$		O	S	t-C_4H_9-	160	-

[a] α異性体は溶離液として塩化メチレン／酢酸エチル２：１を用いるシリカゲル上でのα及びβ異性体の混合物のクロマトグラフィー分離により得られた。

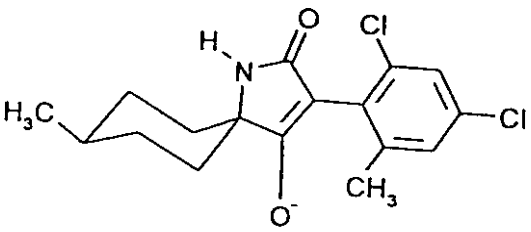
実施例（Ｉ－１－ｄ－１）

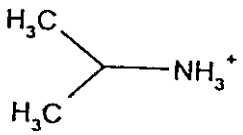


無水塩化メチレン５ｍｌ中の塩化メタンスルホニル０．９３ｍｌ（０．０１２ミリモル）を０～１０℃で無水塩化メチレン７０ｍｌ中の実施例Ｉ－１－ａ－４の化合物４．０８ｇ及びトリエチルアミン１．７ｍｌ（０．０１２モル）に滴加し、そして混合物を反応が終了するまで（ＴＬＣチェック）室温で撹拌した。混合物を０．５Ｎ　ＮａＯＨ　５０ｍｌを用いて２回洗浄し、乾燥し、濃縮し、そして残渣をメチルｔ－ブチルエーテル（ＭＴＢエーテル）／ｎ－ヘキサンから再結晶した。

収量：２．８０ｇ（理論値の５２％）、融点：２１１℃。

実施例（Ｉ－１－ｆ－１）

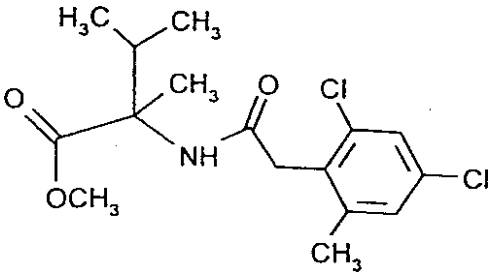




無水イソプロピルアミン０．８１ｍｌ（０．０１モル）をＭＴＢエーテル４０ｍｌ中の実施例Ｉ－１－ａ－４の化合物２．０４ｇに加え、そして混合物を室温で１０分間撹拌した。続いてこのものを真空中で乾固するまで蒸発させた。

収量：２．２０ｇ（理論値の９１％）、融点：＞２２０℃。

実施例（ＩＩ－１）

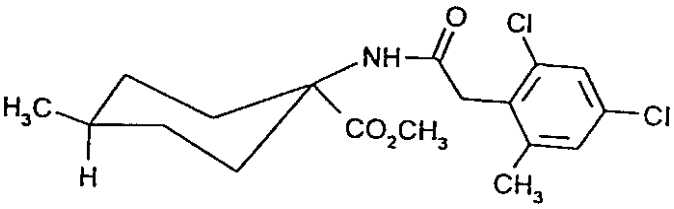


式（ＸＸＩ－１）の化合物３０．８ｇを３０～４０℃で注意して濃硫酸４８．４ｇ（０．４９３モル）に滴加し、そして混合物をこの温度で２時間撹拌した。次に無水メタノール６７ｍｌを約４０℃の内部温度を達成させるように滴加し、そして混合物を４０～７０℃で更に６時間撹拌した。

処理のために、混合物を氷０．４８ｋｇ上に注ぎ、塩化メチレンを用いて抽出し、塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて洗浄し、乾燥し、そして蒸発させた。粗製生成物をＭＴＢエーテル／ｎ－ヘキサンから再結晶した。

収量：２５．１ｇ（理論値の７３％）、融点：１１４℃。

実施例（ＩＩ－２）



実施例（ＸＸＶ－２）による２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸２６．３ｇ（０．１２モル）及び塩化チオニル１７．７ｍｌ（０．２４モル）をガスの発生が終了するまで８０℃で撹拌した。過剰の塩化チオニルを真空中にて５０℃で除去した。次に無水トルエン５０ｍｌを加え、そして混合物を再度蒸発させた。残渣を無水ＴＨＦ１００ｍｌ中に取り入れた（溶液１）。

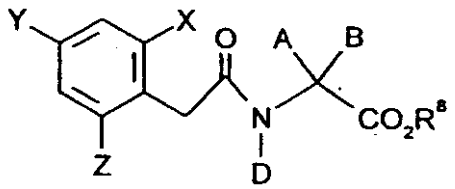
溶液１を無水ＴＨＦ２５０ｍｌ中の４－メチルシクロヘキシルアミン－１－カルボン酸メチル２５．０３ｇ及びトリエチルアミン３７ｍｌ（０．２６４モル）に０～１０℃で滴加し、続いて混合物を室温で１時間撹拌した。次にこのものを吸引濾過し、無水ＴＨＦで洗浄し、そして蒸発させた。残渣を塩化メチレン中に取り入れ、混合物を０．５Ｎ　ＨＣｌで洗浄し、乾燥し、そして蒸発させた。粗製生成物をＭＴＢエーテル／ｎ－ヘキサンから再結晶した。

収量：３４．６ｇ（理論値の７７％）、融点：１４５℃。

次の式（ＩＩ）の化合物を実施例（ＩＩ－１）または（ＩＩ－２）と同様にか、または一

般的製造方法に従って製造した。

表13

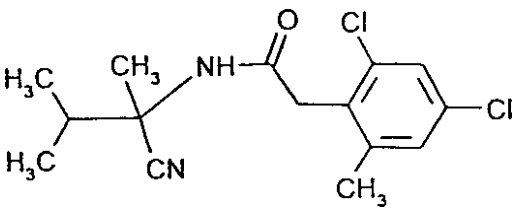


(II)

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^8	異性体	融点 °C
II-3	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_3$-$CHCH_3$-CH_2-		H	CH_3	ß	141
II-4	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_5$-		H	CH_3	-	139
II-5	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_2$-O-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	-	129
II-6	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	141
II-7	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_2$-$CHCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	93
II-8	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_3$-$CHCH_3$-(CH_2)-		H	CH_3	ß	112
II-9	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_5$-		H	CH_3	-	121
II-10	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_2$-O-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	-	146
II-11	Cl	CH_3	Cl	i-C_3H_7	CH_3	H	CH_3	-	128
II-12	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	158
II-13	Cl	Cl	CH_3	CH_3	CH_3	H	CH_3	-	175
II-14	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	α	141
II-15	Br	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	CH_3	-	137
II-16	Br	CH_3	Br	-$(CH_2)_2$-$CHCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	203
II-17	Br	CH_3	Br	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	149
II-18	Br	CH_3	Br	-$(CH_2)_2$-O-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	-	172
II-19	Br	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	159
II-20	Br	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHOCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	138
II-21	Br	Br	CH_3	CH_3	CH_3	H	CH_3	-	158
II-22	Br	Br	CH_3	-$(CH_2)_2$-O-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	-	152
II-23	Br	Cl	CH_3	-$(CH_2)_2$-$CHCH_3$-$(CH_2)_2$-		H	CH_3	ß	163

実施例 No.	X	Y	Z	B	A	D	R^4	異性体	融点 °C
II-24	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_3-CHCH_3-CH_2-$		H	CH_3	B	139
II-25	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	CH_3	B	133
II-26	Br	Cl	CH_3	CH_3	CH_3	H	CH_3	-	164
II-27	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	CH_3	-	184
II-28	Br	Cl	CH_3	i-C_3H_7	CH_3	H	CH_3	-	102
II-29	Br	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	CH_3	B	141
II-30	Br	CH_3	Cl	CH_3	CH_3	H	CH_3	-	127
II-31	Br	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	CH_3	-	174
II-32	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H	CH_3	-	169
II-33	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	CH_3	-	158
II-34	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H	CH_3	B	158
II-35	Cl	Cl	CH_3	H	$-(CH_2)_4-$		C_2H_5	-	oil
II-36	Cl	Cl	CH_3	H	H	i-C_3H_7	C_2H_5	-	oil
II-37	Cl	CH_3	Cl	H	$-CH_2-S-(CH_2)_2-$		C_2H_5	-	oil
II-38	Cl	CH_3	Cl	H	$-CH_2-CHCH_3-CHCH_3-$		C_2H_5	-	oil

実施例（ＸＸＸＩ－１）



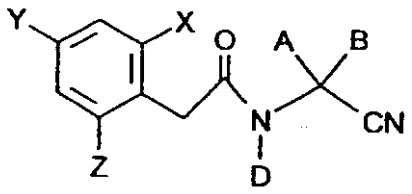
溶液１を２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸２６．３ｇから出発して実施例（ＩＩ－２）に記載の通りに製造した。

溶液１を０～１０℃で無水ＴＨＦ１５０ｍｌ中の２－アミノ－２，３－ジメチルブチロニトリル１３．４６ｇ及びトリエチルアミン１８．５ｇ（０．１３２モル）に滴加し、そして混合物を室温で更に１時間撹拌した。次にこのものを吸引濾過し、無水ＴＨＦで洗浄し、そして蒸発させた。残渣を塩化メチレン中に取り入れ、０．５Ｎ　ＨＣｌを用いて洗浄し、乾燥し、そして蒸発させた。粗製生成物をＭＴＢエーテル／ｎ－ヘキサンから再結晶した。

収量：３０．８ｇ（理論値の８１％）、融点：１１２℃。

次の式（ＸＸＸＩ）の化合物を実施例（ＸＸＸＩ－１）と同様にか、または一般的製造方法に従って製造した。

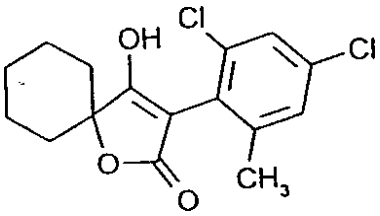
表14



(XXXI)

実施例 No.	X	Y	Z	A	B	D	融点℃
XXXI-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	117
XXXI-3	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	119
XXXI-4	Cl	CH_3	Cl	CH_3	i-C_3H_7	H	71
XXXI-5	Br	CH_3	Br	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	>220
XXXI-6	Br	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	196
XXXI-7	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	172
XXXI-8	Br	Cl	CH_3	CH_3	i-C_3H_7	H	128
XXXI-9	Br	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	139
XXXI-10	Cl	Br	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H	171

実施例（Ｉ－２－ａ－１）



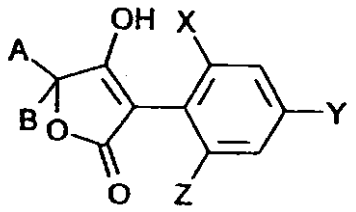
カリウムｔ－ブチラート８．４２ｇ（７５ミリモル）をＤＭＦ　５０ｍｌ中に導入し、ＤＭＦ　５０ｍｌ中の実施例（ＩＩＩ－１）による２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸１－エトキシカルボニル－シクロヘキシル１８．６ｇ（５０ミリモル）の溶液を０～１０℃で滴加し、そして混合物を室温で一夜撹拌した。

処理のために、反応混合物を氷冷した１Ｎ　ＨＣｌ　５００ｍｌに滴加し、沈殿した生成物を吸引濾過し、水で洗浄し、そして真空乾燥器中で乾燥した。更に精製のために、次に粗製生成物をｎ－ヘキサン／アセトンと共に沸騰させた。

収量：６．７１ｇ（理論値の４１％）の３－（２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル）－５－スピロシクロヘキシルテトロン酸、融点：＞２４０℃。

次の式（Ｉ－２－ａ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた。

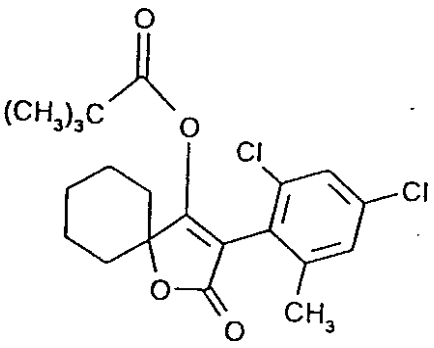
表15



(I-2-a)

実施例 No.	X	Y	Z	A	B	融点 °C
I-2-a-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		>240
I-2-a-3	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		oil[1)]
I-2-a-4	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_4-$		>230
I-2-a-5	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		>260
I-2-a-6	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		>230
I-2-a-7	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_4-$		>260
I-2-a-8	Br	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		284-285
I-2-a-9	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		282
I-2-a-10	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		218-219
I-2-a-11	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		230
I-2-a-12	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		280
I-2-a-13	Br	Br	CH_3	$-(CH_2)_5-$		245
I-2-a-14	Br	CH_3	Br	$-(CH_2)_5-$		248

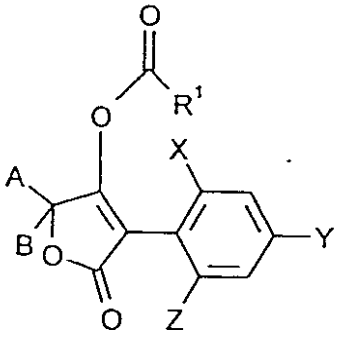
実施例（Ｉ－２－ｂ－１）



実施例Ｉ－２－ａ－１による化合物３．２７ｇ（１０ミリモル）をジクロロメタン４０ｍｌ中に導入し、トリエチルアミン１．５２ｇ（１５ミリモル）を加え、ジクロロメタン４０ｍｌ中の塩化ピバロイル１．５７ｇ（１３ミリモル）の溶液を氷冷しながら滴加し、そして撹拌を室温で１～２時間続けた。処理のために、混合物を順次１０％クエン酸、１Ｎ　ＮａＯＨ及びＮａＣｌ溶液で洗浄し、有機相を$MgSO_4$上で乾燥し、そして蒸発させた。更に精製のために、次に粗製生成物を少量の石油エーテルと共に撹拌した。
収量：３．６ｇ（理論値の８８％）の４－ピバロイル－オキシ－３－（２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル）－５－スピロ－シクロヘキシル－テトロン酸、融点：１３７℃。

次の式（Ｉ－２－ｂ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

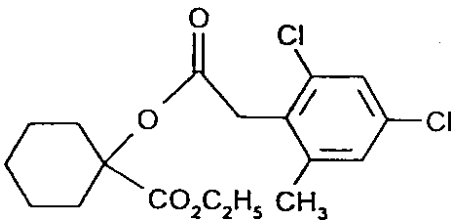
表１６



(I-2-b)

実施例 No.	X	Y	Z	A	B	R^1	融点 °C
I-2-b-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-$	154
I-2-b-3	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-$	147
I-2-b-4	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_4-$		$t-C_4H_9-$	112
I-2-b-5	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-$	123-128
I-2-b-6	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-$	125-127
I-2-b-7	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_4-$		$t-C_4H_9-$	116-118
I-2-b-8	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-$	133
I-2-b-9	Br	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-CH_2-$	140
I-2-b-10	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-CH_2-$	149
I-2-b-11	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-$	124
I-2-b-12	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-CH_2-$	114
I-2-b-13	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		$t-C_4H_9-$	133-135
I-2-b-14	Br	Br	CH_3	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-$	oil
I-2-b-15	Br	Br	CH_3	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-CH_2-$	113-115
I-2-b-16	Br	CH_3	Br	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-$	175
I-2-b-17	Br	CH_3	Br	$-(CH_2)_5-$		$t-C_4H_9-CH_2-$	160-162

実施例（ＩＩＩ－１）



２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸１０．９５ｇ（５０ミリモル）をトルエン５０ｍｌ中に導入し、塩化チオニル１１．９ｇ（１００ミリモル）を加え、混合物を水素

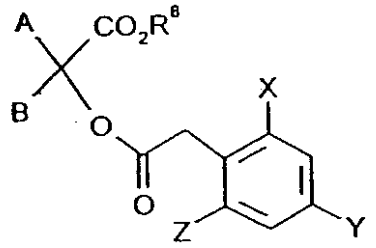
の発生が終了するまで８０℃で撹拌し、次に蒸発させた。粗製酸塩化物を１－ヒドロキシ－シクロヘキサンカルボン酸エチル８．６ｇ（５０ミリモル）と一緒にトルエン５０ｍｌ中で一夜沸騰させ、続いて混合物を蒸発させた。

収量：１８．６ｇ（定量的）の無色油としての２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニル酢酸１－エトキシカルボニル－シクロヘキシル。

^{1}ＨＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）：δ＝１．２（ｔ，３Ｈ）；１．３－２．０（ｍ，９Ｈ）；２．３（ｓ，３Ｈ）；３．８（ｓ，２Ｈ）；４．１５（ｑ，２Ｈ）；７．３（ｍ，２Ｈ）。

次の式（ＩＩＩ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

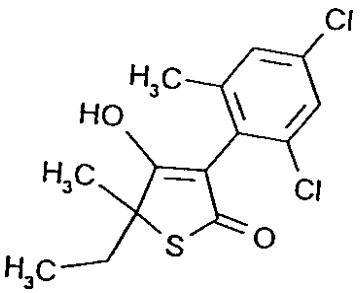
表17



(III)

実施例 No.	A	B	X	Y	Z	R^1	融点 °C
III-2	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		Cl	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-3	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		Cl	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-4	$-(CH_2)_4-$		Cl	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-5	$-(CH_2)_5-$		Cl	CH_3	Cl	C_2H_5	油
III-6	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		Cl	CH_3	Cl	C_2H_5	油
III-7	$-(CH_2)_4-$		Cl	CH_3	Cl	C_2H_5	油
III-8	$-(CH_2)_5-$		Br	CH_3	Cl	C_2H_5	油
III-9	$-(CH_2)_5-$		Br	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-10	$-(CH_2)_5-$		Br	CH_3	Br	C_2H_5	油
III-11	$-(CH_2)_5-$		Br	Br	CH_3	C_2H_5	油
III-12	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		Br	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-13	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		Cl	Cl	CH_3	C_2H_5	油
III-14	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		Cl	CH_3	Cl	C_2H_5	油

実施例（Ｉ－３－ａ－１）

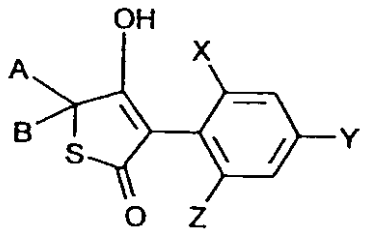


実施例（ＩＶ－１）による化合物１０．８ｇ（２３ミリモル）をトリフルオロ酢酸２５ｍｌ及びトルエン５０ｍｌ中で５時間還流させた。混合物を乾固するまで濃縮し、残渣を水１２０ｍｌ及びＭＴＢエーテル４０ｍｌで処理し、そしてＮａＯＨをｐＨ値が１４に達するまで加えた。混合物をＭＴＢエーテルを用いて２回抽出した。次に水相を酸性にし、そしてＭＴＢエーテルを用いて３回抽出した。有機相を乾燥し、濃縮し、残渣をシクロヘキサンと共に撹拌し、そして吸引濾過した。

収量：０．６０ｇ（理論値の８％）、融点：２２２℃。

次の式（Ｉ－３－ａ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

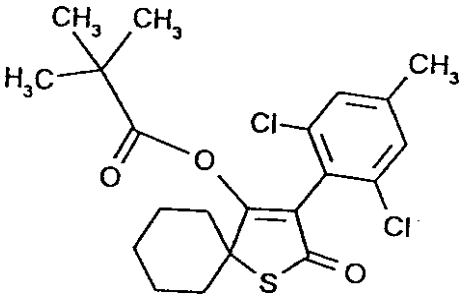
表１８



(I-3-a)

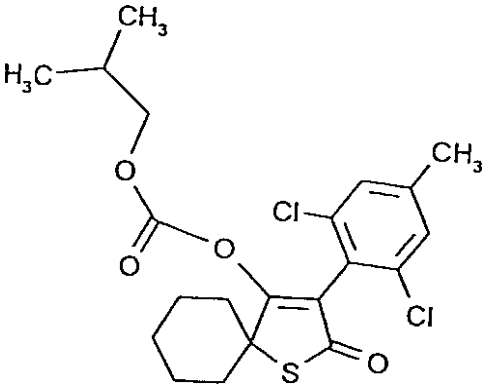
実施例 No.	X	Y	Z	A	B	融点 °C
I-3-a-2	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		>250

実施例（Ｉ－３－ｂ－１）

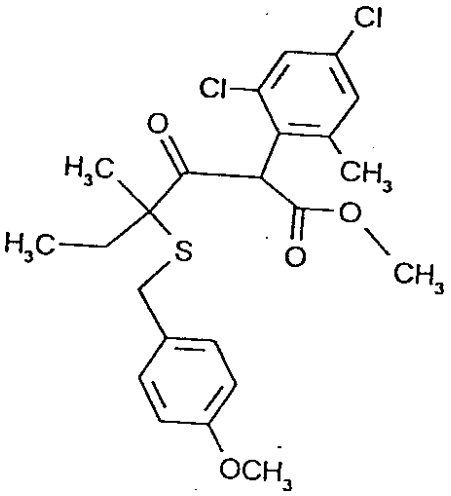


実施例（Ｉ－３－ａ－２）による化合物１ｇ（２．９ミリモル）を無水塩化メチレン１２ｍｌ中に導入し、そしてトリエチルアミン０．６ｇ（１．５当量）を加えた。無水塩化メチレン３ｍｌ中に塩化ピバロイル０．４７ｍｌ（０．４５ｇ、３．７７ミリモル）の溶液を氷冷しながら滴加した。バッチを室温で１～２時間撹拌した。不完全な反応のため、トリエチルアミン０．３ｍｌ及び酸塩化物０．２４ｍｌを更に計量導入した。続いて混合物を１０％クエン酸を用いて２回洗浄し、そして一緒にした水相を塩化メチレンを用いて抽出した。一緒にした有機相を１Ｎ　ＮａＯＨを用いて２回洗浄し、そして水相を塩化メチレンを用いて抽出した。一緒にした有機相を乾燥し、そして濃縮した。残渣を石油エーテ

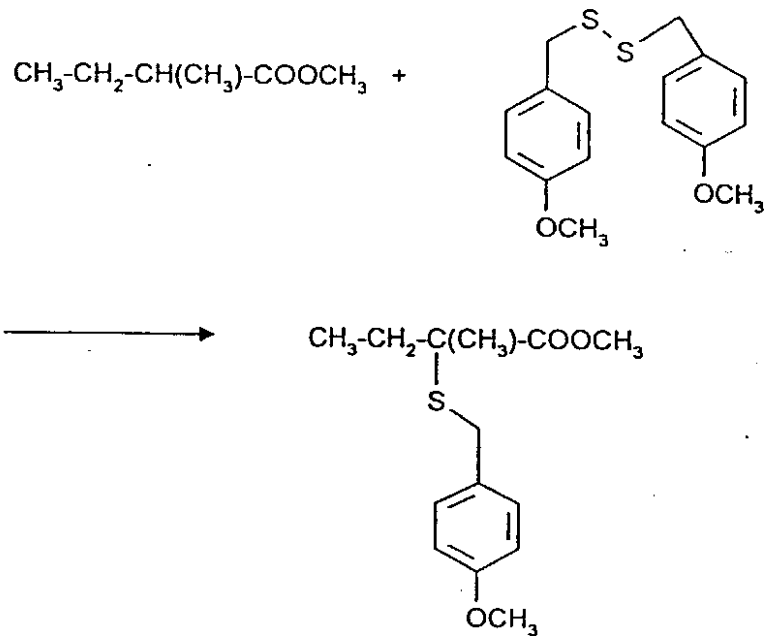
ル中で撹拌し、吸引濾過し、そして乾燥した。
収量：０．７０ｇ（理論値の５６％）、融点：１００～１０８℃。
実施例（Ｉ－３－ｃ－１）



実施例（Ｉ－３－ａ－２）による化合物１ｇ（２．９ミリモル）を無水塩化メチレン１２ｍｌ中に導入し、そしてトリエチルアミン０．６ｇ（１．５当量）を加えた。無水塩化メチレン３ｍｌ中のクロロギ酸イソブチル０．４９ｇ（０．５１ｇ、３．７７ミリモル）の溶液を氷冷しながら滴加した。バッチを室温で１～２時間撹拌した。処理を実施例（Ｉ－３－ｂ－１）のとおりに行った。
収量：０．６０ｇ（理論値の４７％）、融点：１７４～１７６℃。
実施例（ＩＶ－１）

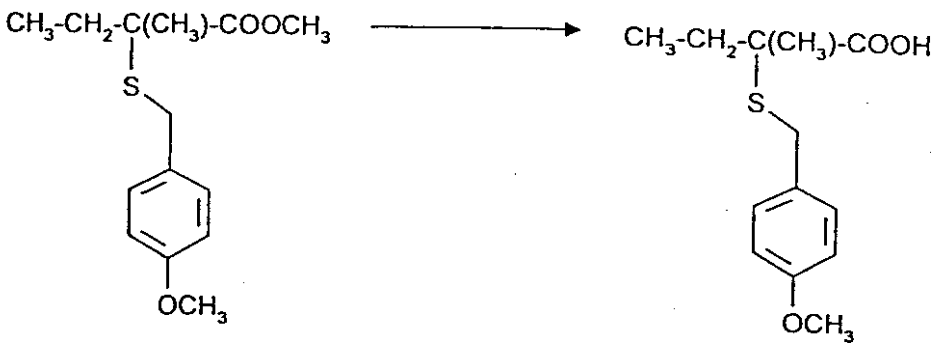


A:



ｎ－ブチルリチウム（ｎ－ヘキサン中１．６Ｎ）１００ｍｌ（１６０ミリモル）を－７８℃で無水ＴＨＦ１３０ｍｌ中のジイソプロピルアミン１７．６５ｇ（１７３．２ミリモル）に滴加し、そして混合物を２０分間撹拌した。次に無水ＴＨＦ３０ｍｌ中の２－メチル酪酸メチル１５．５ｇ（１３３．２ミリモル）を加え、そして混合物を６０分間撹拌した。続いてＴＨＦ１２０ｍｌ中に溶解した二硫化ビス－（４－メトキシベンジル）４０．６３ｇ（１３３．２ミリモル）を滴加し、混合物を室温に戻し、そして１時間撹拌した。ＭＴＢエーテル３００ｍｌを加え、混合物を水１５０ｍｌを用いて洗浄し、乾燥し、そして濃縮した。収量：３５．１ｇ。

B:



Ａにより製造した上の化合物１．５ｇ（５．６ミリモル）及びＫＯＨ２．０ｇをエタノール２０ｍｌ中にて４０℃で４８時間撹拌した。混合物を常法で処理し、そして粗製生成物をカラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル１／１）により精製した後、酸０．６ｇ（理論値の４２％）が得られた。

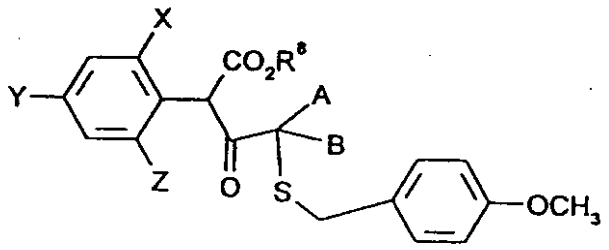
Ｃ：

トルエン１０７ｍｌ中のＢにより製造された上記のカルボン酸２５ｇ（９８ミリモル）をジメチルホルムアミド（ＤＭＦ）一滴及び塩化チオニル１７．５ｇ（１４７ミリモル）で処理し、そして混合物をガスの発生が終了するまで１００℃で撹拌した。続いて混合物を乾固するまで蒸発させ、そして酸塩化物を無水ＴＨＦ４０ｍｌ中に溶解した（酸塩化物溶液）。

ブチルリチウム（ｎ－ヘキサン中１．６Ｍ）７１．６ｍｌ（１１８ミリモル）を０℃でＴＨＦ１００ｍｌ中のジイソプロピルアミン１３．０ｇ（１２９ミリモル）に滴加した。１５分後、ＴＨＦ４０ｍｌ中の２，４－ジクロロ－６－メチルフェニル酢酸メチル２５．０５ｇ（１０８ミリモル）を０℃で滴加し、そして混合物を３０分間撹拌した。続いて上で調製した酸塩化物溶液を０℃で滴加し、そして混合物を室温で１時間撹拌した。ＭＴＢエーテル３５０ｍｌを加え、混合物を１０％塩化アンモニウム溶液を用いて２回洗浄し、有機相を乾燥し、そして濃縮した。カラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル２０／１～１０／１）による粗製生成物の精製後、式（ＩＶ－１）の化合物１１．３ｇ（理論値の２５％）が得られた。

下記の表に示される式（ＩＶ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

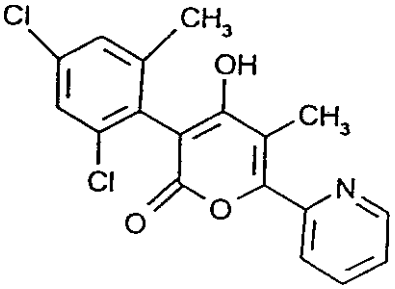
表１９



(IV)

実施例 No.	X	Y	Z	A	B	R^8	融点℃
IV-2	Cl	Cl	CH_3	$-(CH_2)_5-$		CH_3	油
IV-3	Cl	CH_3	Cl	$-(CH_2)_5-$		CH_3	130-135

実施例（Ｉ－５－ａ－１）



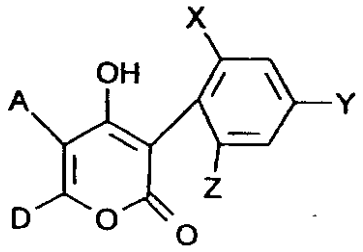
２，４－ジクロロ－６－メチル－フェニルクロロカルボニルケテン２．６ｇ（１０ミリモル）を無水トルエン２０ｍｌ中に導入し、エチル２－ピリジルケテン１．３ｇ（１０ミリモル）を２０℃で加え、そして混合物を８時間還流させた。沈殿を冷却条件下で分別し、そしてシリカゲル（３５～７０μｍ）２００ｇ上でクロマトグラフにかけた（溶離液：トルエン／エタノール１０：１）。

融点９６～１００℃の固体１．０ｇ（２８％）が得られた。

R_f＝０．１４（トルエン／エタノール＝１０／１）。

下記の表に示される式（Ｉ－５－ａ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

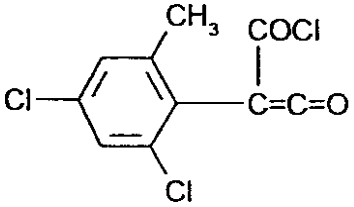
表20



(I-5-a)

実施例 No.	X	Y	Z	A	D	融点 °C
I-5-a-2	Cl	Cl	CH_3	CH_3	4-F-C_6H_4-	194-197
I-5-a-3	Cl	Cl	CH_3	CH_3	t-C_4H_9-	243-245
I-5-a-4	Cl	CH_3	Cl	CH_3	4-F-C_6H_4-	235-238
I-5-a-5	Cl	CH_3	Cl	-$(CH_2)_4$-		253-256
I-5-a-6	Cl	CH_3	Cl	CH_3	t-C_4H_9-	245-246
I-5-a-7	Cl	CH_3	Cl	CH_3	シクロペンチル	260-261
I-5-a-8	Cl	Cl	CH_3	-$(CH_2)_4$-		295-296

実施例（Ｖ－１）



(V-1)

塩化チオニル８５ｍｌを室温でトルエン１１５ｍｌ中の式（ＸＸＸＶ－１）による化合物２６ｇ（０．１モル）に加えた。続いて混合物を一夜還流させた。このものを冷却し、そして乾固するまで蒸発させた。

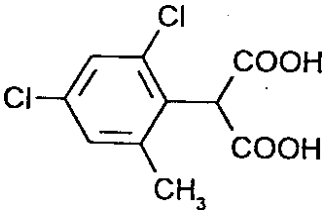
収量：２６．２ｇ（理論値の９９％）。

^{1}ＨＮＭＲ（２００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）：δ＝２．３５，２．３７（２ｓ，３Ｈ，Ａｒ－CH_3）７．０５－７．４５（ｍ，２Ｈ　Ａｒ－Ｈ）。

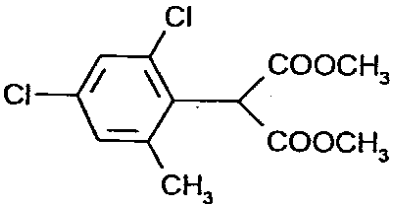
実施例（Ｖ－２）

実施例（ＸＸＸＶ－２）による化合物から出発し、２－（２，６－ジクロロ－４－メチルフェニル）クロロカルボニルケテンが同様に油として得られた。

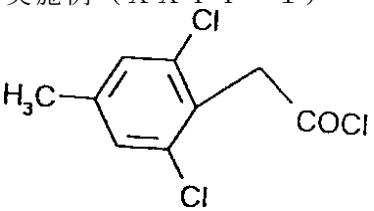
実施例（ＸＸＸＶ－１）



水８．６ｍｌ中のＫＯＨ６．４ｇ（０．１１４モル）の溶液を室温でメタノール２０ｍｌ中の実施例（ＶＩ－１）による化合物１０ｇ（０．０３４モル）に滴加した。続いて混合物を１０時間還流させた。
混合物を常法で処理した後、融点：１７６～１７９℃の固体４．７ｇ（理論値の５３％）が得られた。
実施例（ＸＸＸＶ－２）
実施例（ＶＩ－２）による化合物から出発し、融点１９９～２０７℃の２－（２，６－ジクロロ－４－メチルフェニル）マロン酸が同様に得られた。
実施例（ＶＩ－１）

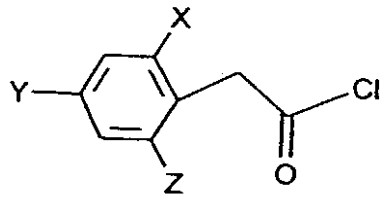


純度８０％の水素化ナトリウム２１．７ｇ（０．７モル）を室温でジメチルカーボネート８２０ｍｌに加えた。続いて２，４－ジクロロ－６－メチルフェニル酢酸メチル１２５ｇ（０．５４モル）を８０～９０℃で滴加し、そして混合物をこの温度で一夜撹拌した。少量のメタノールを加え、混合物を氷－水中に注ぎ、そして２０％ＨＣｌを用いて酸性にした。相を乾燥し、塩化メチレンで繰り返し抽出し、一緒にした有機相を乾燥し、そして蒸発させた。
収量：１３２．１ｇ（理論値の８４％）、融点：９６～９９℃。
実施例（ＶＩ－２）
２－（２，６－ジクロロ－４－メチルフェニル）マロン酸ジメチルが同様に油として得られた。
^{1}ＨＮＭＲ（２００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）：δ＝２．３１（ｓ，３Ｈ，４－ＣＨ$_{3}$－Ａｒ），２．７７（ｓ，６Ｈ，ＯＣＨ$_{3}$），５．４３（ｓ，１Ｈ，ＣＨ），７．１８（ｓ，１Ｈ，Ａｒ－Ｈ）
実施例（ＸＸＩＩ－１）



塩化チオニル６３ｇ（０．５３１モル）を室温で２，６－ジクロロ－４－メチルフェニル酢酸３８．９ｇ（０．１７７モル）に滴加し、続いて混合物をガスの発生が終了するまで７０℃で加熱した。過剰の塩化チオニルを真空中で留去し、そして残渣を高真空下で蒸留した。
沸点$_{0.06～0.03mbar}$１０９～１１５℃の塩化フェニルアセチル（ＸＸＩＩ－１）３７．８ｇ（理論値の９２％）が得られた。
下記の表に示される式（ＸＸＩＩ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

表21

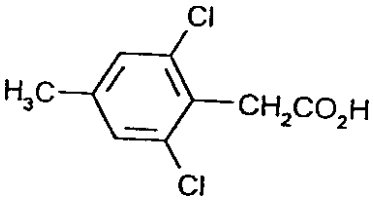


(XXII)

実施例 No.	X	Y	Z	沸点 °C	mbar
XXII-2	Cl	Cl	CH_3	108-116	0.07
XXII-3	Br	CH_3	Cl	124	0.35
XXII-4	Br	Br	CH_3	136	0.39

化合物（ＩＩ）、（ＩＩＩ）及び（ＸＸＸＩ）の合成に用いられる全ての他の酸塩化物は粗製生成物の状態で用い、そして詳細には特性化しなかった。

実施例（ＸＸＶ－１）

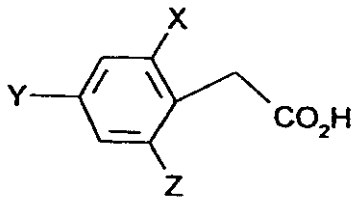


実施例（ＸＸＶＩ－１）の化合物（純度９４％）２２８．６ｇ（０．９８モル）を室温で水１１５ｍｌ及びメタノール２３０ｍｌ中のＫＯＨ８８．５１ｇ（１．５８モル）の混合物に滴加し、そして混合物を５時間還流させた。冷却後、このものを水３００ｍｌで希釈し、そして酢酸エチルを用いて抽出した。水相を半濃縮した塩酸を用いて酸性にし、沈殿を吸引濾過し、そして乾燥した。

収量：１８３ｇ（理論値の９０％）、融点：２０１～２０３℃。

下記の表に示される式（ＸＸＶ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

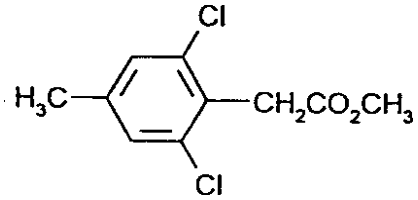
表２２



(XXV)

実施例 No.	X	Y	Z	融点 °C
XXV-2	Cl	Cl	CH_3	191-193
XXV-3	Br	Cl	CH_3	187-189

実施例（ＸＸＶＩ－１）

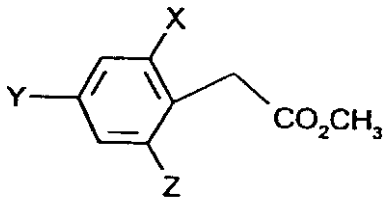


メタノール中のナトリウムメチラートの３０％溶液７４０ｍｌを室温でメタノール４１０ｍｌ中の実施例（ＸＸＶＩＩ－１）による化合物２８３．５ｇ（０．９７モル）の溶液に滴加し、混合物を５時間還流させ、室温に冷却し、そして濃硫酸１１０ｍｌを滴加した。混合物を１時間還流させ、メタノールを留去し、そして固体残渣を水中に取り入れた。有機相を分別し、そして水相を塩化メチレン１．５ｌを用いて２回抽出した。一緒にした有機相を$MgSO_4$上で乾燥し、そして濃縮した。

収量：沸点$_{0.1mbar}$１０４～１０８℃の油２２８．６ｇ（定量的収率）。

下記の表に示される式（ＸＸＶＩ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

表２３

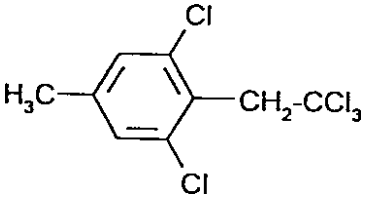


(XXVI)

実施例 No.	X	Y	Z	融点°C 沸点	mbar
XXVI-2	Cl	Cl	CH_3	98-110	0.5
XXVI-3[1)]	Cl	Br	CH_3	油	
XXVI-4	Br	CH_3	Cl	109-112	0.1
XXVI-5	Br	Cl	CH_3	113-133	0.35
XXVI-6	Br	Br	CH_3	126-130	0.35
XXIV-7[1)]	Br	CH_3	Br	油.	

[1)]酸（ＸＸＶ）を製造するために、化合物は粗製生成物として用いた。

実施例（ＸＸＶＩＩ－１）

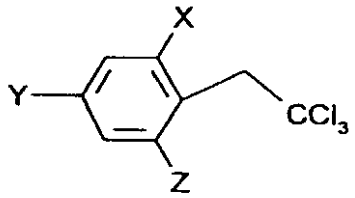


１，１－ジクロロエタン８８６．５ｇ（９．１３５モル）を無水アセトニトリル３６０ｍｌ中のｔ－ブチルニトリル９２．３７ｇ（０．９１４モル）及び無水塩化銅（ＩＩ）１０２．５ｇ（０．７１５モル）の十分に冷却した混合物に滴加し、その際に混合物は室温に保持した。次に２，６－ジクロロ－４－メチルアニリン１０６．５ｇ（０．６モル）及び無水アセトニトリル６００ｍｌの混合物を３０℃以下の温度で滴加した。混合物をガスの発生が終了するまで室温で撹拌し、次に混合物を２０％ＨＣｌ　２．４ｌ中に注意して注ぎ、そして全体で２．５ｌのメチルｔ－ブチルエーテル（ＭＴＢＥ）で繰り返し抽出した。一緒にした有機相を２０％ＨＣｌで洗浄し、乾燥し、そして濃縮した。残った油を精留した。

収量：７２ｇ（理論値の４２％）、沸点$_{0.8mbar}$１３０～１３５℃。

下記の表に示される式（ＸＸＶＩＩ）の化合物が一般的製造方法と同様にか、またはこれに従って得られた：

表２４



(XXVII)

実施例 No.	X	Y	Z	融点 °C 沸点 °C	mbar
XXVII-2	Cl	Cl	CH_3	50-52	
XXVII-3	Cl	Br	CH_3	79-81	
XXVII-4[1)]	Br	Cl	CH_3	油	
XXVII-5[1)]	Br	Br	CH_3	油	
XXVII-6[1)]	Br	CH_3	Br	油	
XXVII-7[1)]	Br	CH_3	Cl	油	

[1)]式（ＸＸＶＩ）のエステルに対する反応において、化合物は粗製生成物として用いた。

使用例

実施例１

フエドン（Phaedon）幼虫試験

溶媒：ジメチルホルムアミド７重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部

活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。

キャベツの葉（Brassica oleracea）を所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することにより処理し、そしてマスタード・ビートル（Phaedon cochleariae）の幼虫を葉が湿っている限りは感染させた。

所定の期間後、％における撲滅度を測定した。１００％はすべてのかぶと虫幼虫の死滅を意味し；０％はかぶと虫の幼虫が死滅しないことを意味する。

この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－３－ａ－１）、（Ｉ－３－ａ－２）、（Ｉ－３－ａ－３）、（Ｉ－５－ａ－３）、（Ｉ－５－ａ－４）、（Ｉ－２－ｂ－５）、（Ｉ－２－ａ－６）、（Ｉ－１－ａ－２）、（Ｉ－１－ｂ－７）、（Ｉ－１－ａ－８）、（Ｉ－１－ａ－９）、（Ｉ－１－ａ－１０）及び（Ｉ－１－ａ－１１）の化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で７日後に１００％の撲滅度を生じさせ、製造実施例（Ｉ－３－ｂ－１）及び（Ｉ－３－ｃ－１）の化合物は少なくとも８０％の撲滅度を生じさせた。

実施例２

プルテラ（Plutella）試験

溶媒：ジメチルホルムアミド７重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適切な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
キャベツの葉（Brassica oleracea）の所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することによって処理し、そしてコナガ（Plutella maculipennis）の幼虫を葉が湿っている限りは感染させた。
所定の期間後、％における撲滅度を測定した。１００％はすべてのイモムシの死滅を意味し；０％はイモムシが死滅しないことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－３－ａ－３）、（Ｉ－３－ｂ－１）、（Ｉ－３－ａ－１）、（Ｉ－５－ａ－３）、（Ｉ－５－ａ－４）、（Ｉ－１－ａ－３）、（Ｉ－１－ａ－４）、（Ｉ－１－ｂ－２）、（Ｉ－１－ｃ－２）、（Ｉ－１－ａ－１）及び（Ｉ－１－ａ－７）の化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で７日後に１００％の撲滅度を生じさせ
実施例３
ツマグロヨコバイ（Nephotettix）試験
溶媒：ジメチルホルムアミド７重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適切な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
イネの種（Oryzae sativa）を所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することによって処理し、そしてツマグロヨコバイ（Nephotettix cincticeps）の幼虫を種が湿っている限りは感染させた。
所定の期間後、％における撲滅度を測定した。１００％はすべてのヨコバイの死滅を意味し；０％はヨコバイが死滅しないことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－３－ａ－２）、（Ｉ－５－ａ－３）、（Ｉ－５－ａ－４）、（Ｉ－５－ａ－８）、（Ｉ－３－ｂ－１）、（Ｉ－５－ａ－４）、（Ｉ－１－ａ－２）、（Ｉ－１－ａ－３）、（Ｉ－１－ａ－４）、（Ｉ－１－ｃ－３）、（Ｉ－１－ａ－１）、（Ｉ－１－ｂ－１０）、（Ｉ－１－ｃ－４）、（Ｉ－１－ｂ－１３）、（Ｉ－１－ａ－７）、（Ｉ－１－ａ－８）、（Ｉ－１－ａ－９）及び（Ｉ－１－ａ－１１）による化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で６日後に１００％の撲滅度を生じさせた。
実施例４
スポドプテラ（Spodoptera）試験
溶媒：ジメチルホルムアミド７重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
キャベツの葉（Brassica oleracea）を所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することにより処理し、そしてヤガ（Spodoptera frugiperda）のイモムシを葉が湿っている限りは感染させた。
所定の期間後、撲滅度を％で測定した。１００％は全てのイモムシが死滅したことを意味し；０％はイモムシが死滅しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－１－ｂ－５）による化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で７日後に１００％の撲滅度を生じさせた。
実施例５
コブアブラムシ（Myzus）試験
溶媒：ジメチルホルムアミド７重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。

コブアブラムシ（Myzus persicae）に重大に感染したキャベツの葉（Brassica oleracea）を所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬することにより処理した。
所定の期間後、撲滅度を％で測定した。１００％は全てのアブラムシが死滅したことを意味し；０％はアブラムシが死滅しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ａ－５）、（Ｉ－２－ｂ－５）、（Ｉ－２－ａ－６）、（Ｉ－１－ｂ－７）及び（Ｉ－１－ａ－１）による化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で６日後に１００％の撲滅度を生じさせた。
実施例６
リンゴハダニ（Panonychus）試験
溶媒：ジメチルホルムアミド３重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そしてこの濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
全ての段階のリンゴハダニ（Panonychus ulmi）に重大に感染した高さ約３０ｃｍのプラムの木（Prunus domestica）に所望の濃度の活性化合物の調製物を噴霧した。
所定の期間後、撲滅度を％で測定した。１００％は全てのハダニが死滅したことを意味し；０％はハダニが死滅しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ａ－１）、（Ｉ－２－ｂ－１）、（Ｉ－２－ａ－２）、（Ｉ－２－ｂ－２）、（Ｉ－２－ｂ－４）及び（Ｉ－２－ｂ－５）による化合物は例えば０．００４％の活性化合物濃度で７日後に少なくとも９５％の撲滅度を生じさせた。
実施例７
ナミハダニ（Tetranychus）試験（ＯＰ耐性／噴霧処理）
溶媒：ジメチルホルムアミド３重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そして濃厚物を水で所望の濃度に希釈した。
すべての発育段階のナミハダニ（Tetranychus urticae）に重大に感染した大豆植物（Phaseolus vulgaris）に所望の濃度の活性化合物の調製物を噴霧した。
所定の期間後、撲滅度を％で測定した。１００％は全てのナミハダニが死滅したことを意味し；０％はナミハダニが死滅しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ｂ－１）、（Ｉ－２－ｂ－４）及び（Ｉ－２－ｂ－５）による化合物は例えば０．００４％の活性化合物濃度で７日後に１００％の活性を生じさせた。
実施例８
ナミハダニ（Tetranychus）試験（ＯＰ耐性／浸漬処理）
溶媒：ジメチルホルムアミド３重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を調製するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、そして濃厚物を水で所望の濃度に希釈した。
すべての発育段階のナミハダニ（Tetranychus urticae）に重大に感染した大豆植物（Phaseolus vulgaris）に所望の濃度の活性化合物の調製物中に浸漬した。
所定の期間後、撲滅度を％で測定した。１００％は全てのナミハダニが死滅したことを意味し；０％はナミハダニが死滅しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ｂ－２）、（Ｉ－２－ｂ－６）、（Ｉ－１－ｂ－７）、（Ｉ－１－ｂ－１０）、（Ｉ－１－ｃ－４）、（Ｉ－１－ａ－７）、（Ｉ－１－ａ－１１）、（Ｉ－３－ａ－２）、（Ｉ－３－ｂ－１）、（Ｉ－３－ｃ－１）、（Ｉ－５－ａ－４）、（Ｉ－５－ａ－３）及び（Ｉ－５－ａ－８）による化合物は例えば０．１％の活性化合物濃度で１３日後に１００％の活性を生じさせた。
実施例９

発芽前試験
溶媒：アセトン５重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を製造するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を加え、この濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
試験植物の種子を通常の土壌中にまき、２４時間後、活性化合物の調製物を液剤散布した。単位面積当りの水の量を一定に保持することが適当である。調製物中の活性化合物の濃度は重要ではなく、単位面積当り施用した活性化合物の量のみが決めてとなる。３週間後、植物に対する損傷の程度を、未処理対照植物の発育と比較して、％損傷として評価した。数字は次を意味する：
０％＝作用なし（未処理対照と同様）
１００％＝全て撲滅
実施例９ａ
発芽後試験
溶媒：アセトン５重量部
乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル１重量部
活性化合物の適当な調製物を製造するために、活性化合物１重量部を上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を加え、この濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。
高さ５～１５ｃｍの試験植物に、単位面積当り所望の活性化合物の特定の量が施用されるように、活性化合物の調製物を噴霧した。噴霧液の濃度を所望の活性化合物の特定の量が１ヘクタール当り水２０００ｌとして施用されるように選定した。３週間後、植物に対する損傷の程度を未処理対照植物の発育と比較して％損傷として評価した。数字は次の意味する：
０％＝作用なし（未処理対照と同様）
１００％＝全て撲滅

発芽前試験 / 温床

実施例 No.	g/ha	サトウダイコン	スズメノテッポウ	カラスムギ	エノコログサ	カラシ
I-1-a-2	250	0	100	90	100	-
I-1-a-3	250	0	100	-	100	80
I-1-a-4	250	0	100	100	100	95
I-1-b-2	250	0	100	80	100	70
I-1-b-4	250	0	95	80	100	80
I-1-b-7	250	30	95	80	100	100
I-1-b-8	250	0	95	50	100	100
I-1-c-3	250	30	80	80	100	100
I-1-b-10	250	20	100	100	100	100
I-1-b-11	250	30	95	40	100	90
I-1-b-12	250	20	100	80	100	95
I-1-c-4	250	50	100	100	100	100
I-1-b-13	250	30	100	80	100	90
I-1-a-7	250	-	100	90	100	100
I-1-a-8	250	-	100	40	100	100
I-1-c-6	250	-	100	100	100	95
I-1-b-20	250	30	95	-	90	80
I-1-c-7	250	0	100	80	100	80

実施例 No.	g/ha	サトウダイコン	スズメノテッポウ	ヒユ属	カラシ
I-3-a-2	250	0	-	60	-
I-3-c-1	250	0	-	70	-
I-5-a-7	250	0	80	-	95
I-5-a-1	250	0	80	-	-
I-5-a-1*	250	0	80	-	-

*発芽後試験

実施例１０

牛壁蝨（Boophilus microplus）耐性を用いる試験／ＳＰ耐性パークハースト（Parkhurst）株

試験動物：それ自身十分に血を吸った雌成虫

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物２０ｍｇをジメチルホルムアミド１ｍｌに溶解し、そして同溶媒で希釈するこ

とにより低濃度を調製した。
試験を５倍測定として行った。溶液１μｌを腹部中に注入し、動物を皿に移し、そして御制環境室中に保持した。産卵の抑制により作用を測定した。１００％の作用はダニが受精卵を産まなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ｂ－５）、（Ｉ－２－ａ－６）、（Ｉ－１－ｂ－３）及び（Ｉ－１－ａ－５）による化合物は各々の場合に例えば２０μｇ／動物の活性化合物濃度で１００％の活性を示した。
実施例１１
ハエ幼虫を用いる試験／発育阻害作用
試験動物：全ての幼虫段階のヒツジウジバエ（Lucilia cuprina）（ＯＰ－耐性）［サナギ及び成虫（活性化合物との接触なし）］
溶媒：エチレングリコールモノメチルエーテル３５重量部
乳化剤：ノニルフェノールポリグリコールエーテル３５重量部
活性化合物の適切な調製物を調製するために、活性化合物３重量部を上記溶媒／乳化剤混合物７重量部と混合し、そして生じた乳化濃厚物を各々の場合に水で所望の濃度に希釈した。
各々の濃度に対し、３０～５０匹の幼虫をガラス管中に置かれた馬肉（１ｃｍ^3）に移し、試験希釈液５００μｌを肉の上にピペットで取った。ガラス管をその底を海砂で覆ったプラスチック製ビーカー中に置き、そして環境を制御したキャビネット（２６±１．５℃、相対湿度７０±１０％）中に保持した。活性を２４時間及び４８時間後にチェックした（殺幼虫作用）。幼虫をガラス管から放し（約７２時間）、管を除去し、穴を空けたプラスチック製の蓋をビーカー上に置いた。発育期間の$1^1/_2$倍後（対照ハエの孵化）、孵化したハエ及びサナギを数えた。
作用に対する基準は４８時間後の処理幼虫における死（殺幼虫効果）またはサナギから孵化する成虫の阻害もしくは脱皮の阻害とする。物質の試験管内作用に対する基準はハエの発育の阻害または成虫段階前の発育の停止とする。１００％の殺幼虫活性は全ての幼虫が４８時間後に死滅することを意味する。１００％の発育阻害活性は成虫のハエが孵化しなかったことを意味する。
この試験において、例えば製造実施例（Ｉ－２－ｂ－５）、（Ｉ－２－ａ－６）、（Ｉ－１－ｂ－３）及び（Ｉ－１－ａ－５）による化合物は例えば１０００ｐｐｍの活性化合物濃度で１００％の活性を示した。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI	
C07D 307/94	*(2006.01)*	C07D 307/94	
C07D 309/38	*(2006.01)*	C07D 309/38	
C07D 333/32	*(2006.01)*	C07D 333/32	
C07D 405/04	*(2006.01)*	C07D 405/04	
C07D 407/04	*(2006.01)*	C07D 407/04	
C07D 409/04	*(2006.01)*	C07D 409/04	
C07D 417/04	*(2006.01)*	C07D 417/04	
C07D 491/107	*(2006.01)*	C07D 491/107	
C07D 493/04	*(2006.01)*	C07D 493/04	106A
C07D 493/10	*(2006.01)*	C07D 493/10	A
C07D 495/10	*(2006.01)*	C07D 495/10	
A01N 43/08	*(2006.01)*	A01N 43/08	H
A01N 43/10	*(2006.01)*	A01N 43/10	H
A01N 43/16	*(2006.01)*	A01N 43/16	B
A01N 43/36	*(2006.01)*	A01N 43/36	C
A01N 43/56	*(2006.01)*	A01N 43/56	F
A01N 43/86	*(2006.01)*	A01N 43/86	102
C07C 25/02	*(2006.01)*	C07C 25/02	
C07C 57/58	*(2006.01)*	C07C 57/58	
C07C 57/76	*(2006.01)*	C07C 57/76	
C07C 59/88	*(2006.01)*	C07C 59/88	
C07C 69/612	*(2006.01)*	C07C 69/612	
C07C 69/66	*(2006.01)*	C07C 69/66	
C07C 233/51	*(2006.01)*	C07C 233/51	
C07C 233/52	*(2006.01)*	C07C 233/52	
C07C 255/29	*(2006.01)*	C07C 255/29	

(72)発明者　リープ，フオルカー
ドイツ連邦共和国デー－５１３７５レーフエルクーゼン・アルフレート－クビン－シユトラーセ１
(72)発明者　ハゲマン，ヘルマン
ドイツ連邦共和国デー－５１３７５レーフエルクーゼン・カンデインスキシユトラーセ５２
(72)発明者　ビデイヒ，アルノ
ドイツ連邦共和国デー－５１５１９オーデンタール・アイフゲンシユトラーセ８
(72)発明者　ルター，ミヒヤエル
ドイツ連邦共和国デー－４０７８９モンハイム・グラーベンシユトラーセ２３
(72)発明者　フイシヤー，ライナー
ドイツ連邦共和国デー－４０７８９モンハイム・ネリー－ザクス－シユトラーセ２３
(72)発明者　ブレチユナイダー，トマス
ドイツ連邦共和国デー－５３７９７ローマー・タルシユトラーセ２９ベー
(72)発明者　エルデレン，クリストフ
ドイツ連邦共和国デー－４２７９９ライヒリンゲン・ウンテルビユシヤーホフ１５
(72)発明者　バヘンドルフ－ノイマン，ウルリケ
ドイツ連邦共和国デー－５６５６６ノイビート・オベラーマルケンベーク８５
(72)発明者　ダーメン，ペーター
ドイツ連邦共和国デー－４１４７０ノイス・アルターブリユツカーシユトラーセ６３
(72)発明者　ドリンガー，マルクス
ドイツ連邦共和国デー－５１３８１レーフエルクーゼン・ブルシヤイダーシユトラーセ１５４ベー

(72)発明者　ザンテル，ハンスーヨアヒム
ドイツ連邦共和国デー－５１３７１レーフエルクーゼン・グリユンシユトラーセ９アー
(72)発明者　グラフ，アラン
ドイツ連邦共和国デー－５１４２７ベルギツシユグラートバツハ・イムシユラーク１６
(72)発明者　アンデルシユ，ボルフラム
ドイツ連邦共和国デー－５１４６９ベルギツシユグラートバツハ・シユロツダーデイヒヤーベーク７７
(72)発明者　メンケ，ノルベルト
ドイツ連邦共和国デー－５１３８１レーフエルクーゼン・グルンデルミユーレ２
(72)発明者　トウルベルク，アンドレアス
ドイツ連邦共和国デー－４０６９９エルクラート・ナーエベーク１９

審査官　高原　慎太郎

(56)参考文献　特開平０３－０９３７８５（ＪＰ，Ａ）
特表平０６－５０６２０１（ＪＰ，Ａ）
国際公開第９５／００１９７１（WO，Ａ１）
特開平０５－２９４９５３（ＪＰ，Ａ）
特開平０５－１１７２４０（ＪＰ，Ａ）
特開平０６－２２００３６（ＪＰ，Ａ）
国際公開第９４／０１４７８５（WO，Ａ１）
国際公開第９５／００１３５８（WO，Ａ１）
特開平０６－２５６３０７（ＪＰ，Ａ）
特開平０６－２６３７３１（ＪＰ，Ａ）
特開平０４－２２６９５７（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
C07D
A01N
REGISTRY(STN)
CAplus(STN)