

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号  
特許第7581336号  
(P7581336)

(45)発行日 令和6年11月12日(2024.11.12)

(24)登録日 令和6年11月1日(2024.11.1)

(51)国際特許分類		F I	
C 0 7 D 401/04 (2006.01)		C 0 7 D 401/04	
C 0 7 D 413/04 (2006.01)		C 0 7 D 413/04	C S P
C 0 7 D 413/14 (2006.01)		C 0 7 D 413/14	
C 0 7 D 471/04 (2006.01)		C 0 7 D 471/04	1 0 7 K
C 0 7 D 401/14 (2006.01)		C 0 7 D 401/14	
請求項の数 24 (全212頁) 最終頁に続く			
(21)出願番号	特願2022-517940(P2022-517940)	(73)特許権者	520222106
(86)(22)出願日	令和2年9月17日(2020.9.17)		シンジェンタ クロップ プロテクション
(65)公表番号	特表2022-549417(P2022-549417 A)		アクチェンゲゼルシャフト
(43)公表日	令和4年11月25日(2022.11.25)		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタールシュトラッセ 6 7
(86)国際出願番号	PCT/EP2020/076038	(74)代理人	100094569
(87)国際公開番号	WO2021/053110		弁理士 田中 伸一郎
(87)国際公開日	令和3年3月25日(2021.3.25)	(74)代理人	100103610
審査請求日	令和5年9月14日(2023.9.14)		弁理士 吉 田 和彦
(31)優先権主張番号	201911038070	(74)代理人	100109070
(32)優先日	令和1年9月20日(2019.9.20)		弁理士 須田 洋之
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)	(74)代理人	100119013
			弁理士 山崎 一夫
(31)優先権主張番号	202011030926	(74)代理人	100123777
(32)優先日	令和2年7月20日(2020.7.20)		弁理士 市川 さつき
最終頁に続く		最終頁に続く	

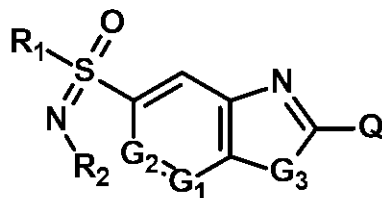
(54)【発明の名称】 硫黄及びスルホキシミン含有置換基を有する殺有害生物的に活性な複素環式誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ⅰ)

【化1】



(I)

(式中、

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、相互に独立して、C H又はNであり；

G<sub>3</sub>は、N C H<sub>3</sub>又はOであり；

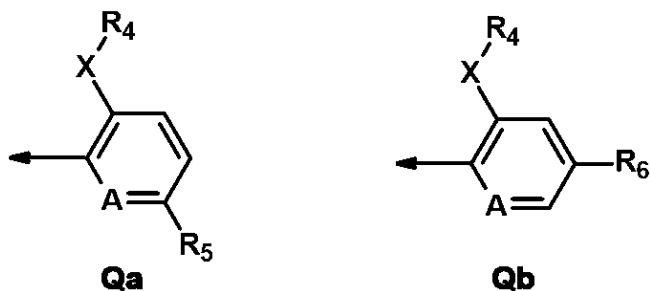
R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；

R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C(O)R<sub>3</sub>又はCNであり；

R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

Qは、式Q a及びQ b

## 【化 2】



10

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

A は、CH 又は N であり；

X は、S、SO 又は SO<sub>2</sub> であり；

R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sub>5</sub> は、水素又はハロゲンであるか；又は

R<sub>5</sub> は、環炭素原子を介して、前記置換基 A を含有する環に結合されている 5 員～6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個又は 3 個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2 個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ 2 個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又は

20

R<sub>5</sub> は、環窒素原子を介して、前記置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個又は 3 個の環ヘテロ原子を含有し、ここで、前記環系は、少なくとも 1 個の環窒素原子を含有し、及び 2 個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ 2 個以上の環硫黄原子を含有することができず；

30

R<sub>6</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換された C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換された C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノで置換された C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>、N(R<sub>9</sub>)C(=O)R<sub>10</sub>、N(R<sub>11</sub>)R<sub>12</sub> 又は 2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub> は、環炭素原子を介して、前記置換基 A を含有する環に結合されている 5 員～6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個又は 3 個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2 個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ 2 個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又は

40

R<sub>6</sub> は、環窒素原子を介して、前記置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒

50

素、酸素及び硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個又は 3 個の環ヘテロ原子を含有し、ここで、前記環系は、少なくとも 1 個の環窒素原子を含有し、及び 2 個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ 2 個以上の環硫黄原子を含有することができず；

$R_7$  及び  $R_8$  は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；

$R_9$  は、 $H$  又は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；

$R_{10}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル又は  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；

$R_{11}$  及び  $R_{12}$  は、相互に独立して、 $H$  又は  $C_1 \sim C_6$  アルキルである）

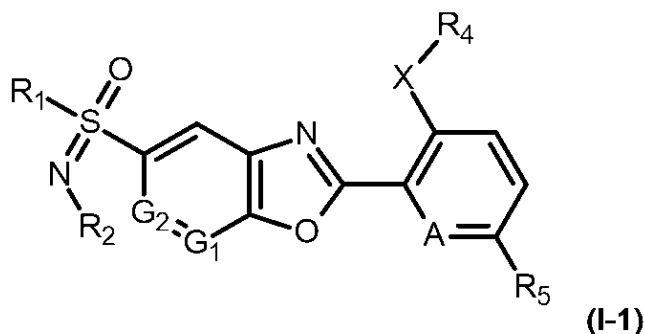
の化合物又は式 I の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 2】

式 I - 1

【化 3】

10



20

（式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$  及び  $R_5$  は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである）

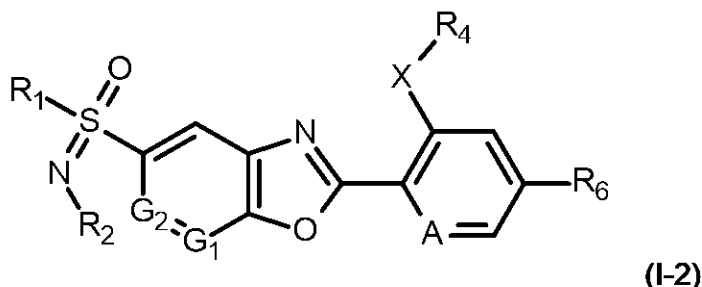
の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 3】

式 I - 2

【化 4】

30



40

（式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$  及び  $R_6$  は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである）

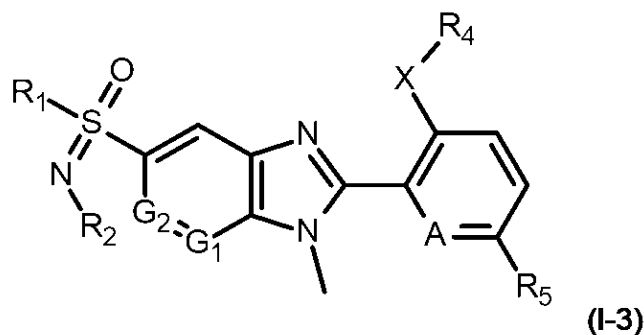
の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 4】

式 I - 3

50

【化 5】



10

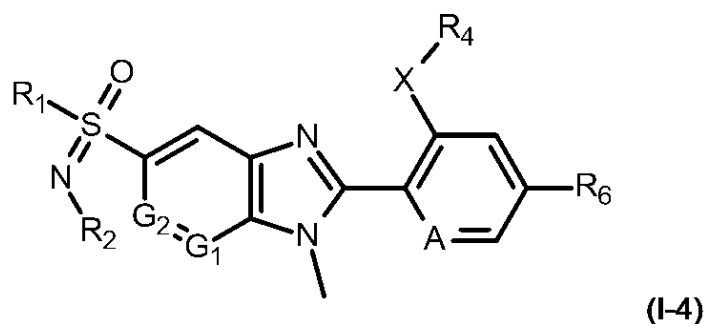
(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

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

【請求項 5】

式 I - 4

【化 6】



20

(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_6$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

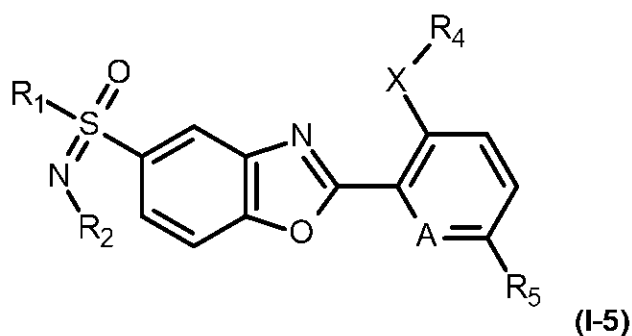
30

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

【請求項 6】

式 I - 5

【化 7】



40

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可

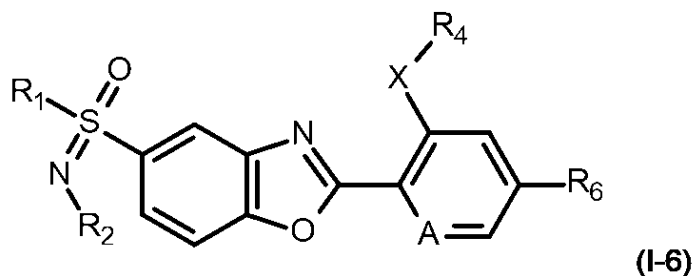
50

能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシド。

【請求項 7】

式 I - 6

【化 8】



10

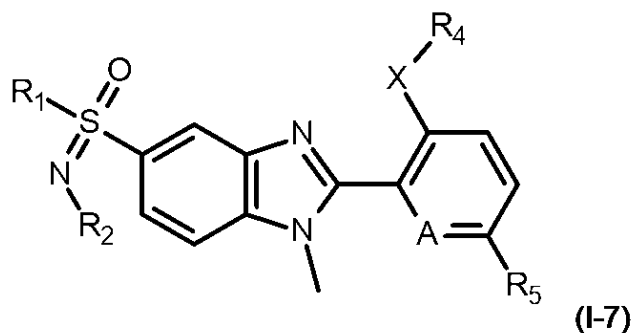
(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_6$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

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

【請求項 8】

式 I - 7

【化 9】



20

30

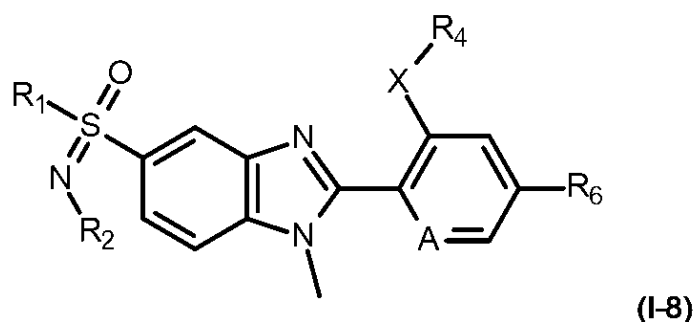
(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

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

【請求項 9】

式 I - 8

【化 10】



40

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_6$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとお

50

りである)

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

【請求項 10】

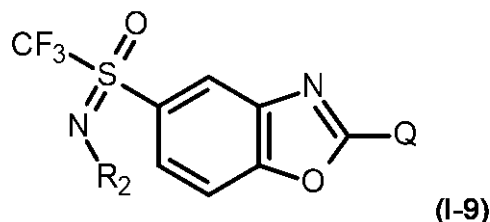
$R_1$  は、メチル又はトリフルオロメチル；好ましくはトリフルオロメチルであり；  
 $X$  は、 $S$  又は  $SO_2$ ；好ましくは  $SO_2$  であり；及び  
 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_2$  アルキル；好ましくはエチルである、請求項 1 ～ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

式 I - 9

【化 11】

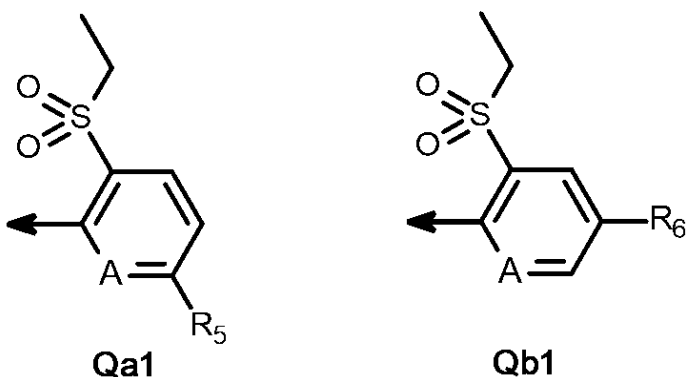
10



(式中、 $Q$  は、式 Q a 1 及び Q b 1

【化 12】

20



30

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

$R_2$ 、 $R_5$  及び  $R_6$  は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

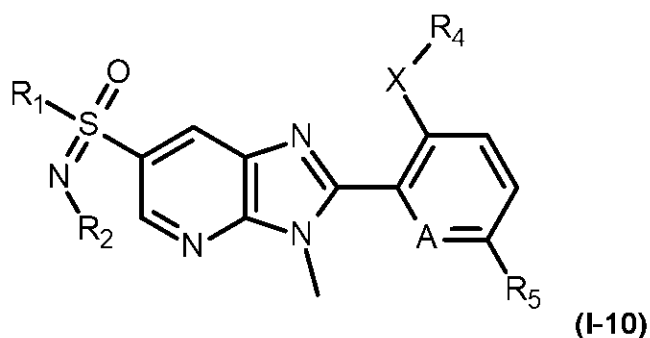
の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 12】

式 I - 10

【化 13】

40



50

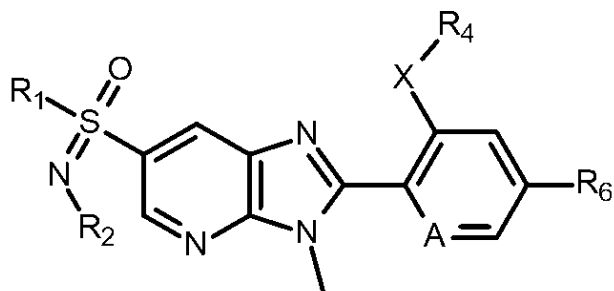
(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

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

【請求項13】

式I - 11

【化14】



(I-11)

10

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_6$ は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

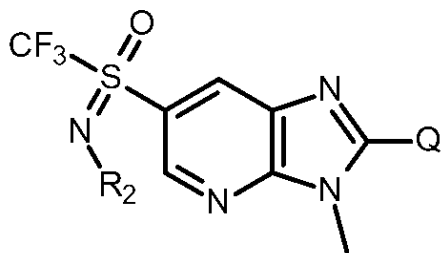
の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシド。

20

【請求項14】

式I - 12

【化15】

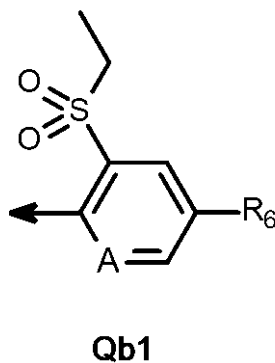
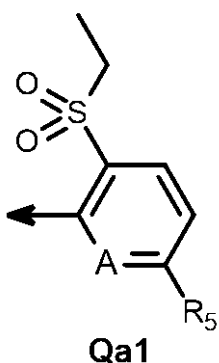


(I-12)

30

(式中、 $R_2$ は、請求項1において式Iで定義されているとおりであり、及び $Q$ は、式Qa1及びQb1

【化16】



40

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

$R_5$ 及び $R_6$ は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

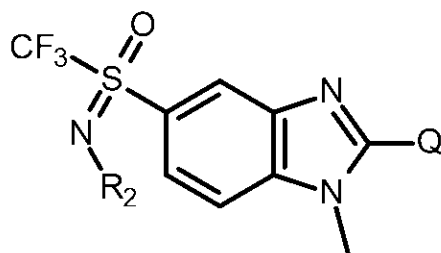
50

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

【請求項 1 5】

式 I - 1 3

【化 1 7】

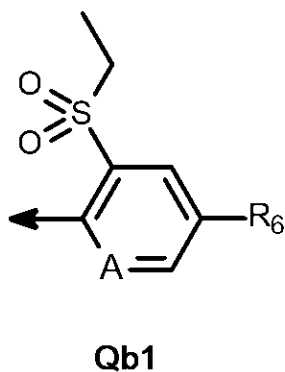
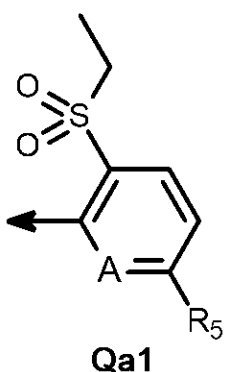


(I-13)

10

(式中、 $R_2$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりであり、及び Q は、式 Q a 1 及び Q b 1

【化 1 8】



20

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

30

A、 $R_5$ 及び $R_6$ は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりである)

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

【請求項 1 6】

$R_2$ は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-C(O)R_3$ 又はシアノであり；好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルであり；及び  
 $R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル；好ましくはメチルである、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

40

$R_5$ は、水素、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルである、請求項 1、2、4、6、8、10、11、12、14 又は 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

$R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロボキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、

50



5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル又は 3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルである、請求項 1、3、5、7、9、10、11、13、14 又は 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

A は、N である、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

A は、CH である、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

[ 2 - [ 5 - [ [ジメチル(オキソ) - <sup>6</sup> - スルファニリデン] アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 1) ;

10

[ 2 - [ 5 - [ [ジメチル(オキソ) - <sup>6</sup> - スルファニリデン] アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 2) ;

N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド(化合物 P 3) ;

N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド(化合物 P 4) ;

20

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - [ 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル ] - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 5) ;

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - [ 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル ] - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 6) ;

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 7) ;

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 8) ;

30

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 - ピリジルオキシ ) - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 9) ; エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 - ピリジルオキシ ) - 2 - ピリジル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 10) ;

[ 2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 11) ;

40

[ 2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 12) ;

シクロプロピルイミノ - [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 13) ;

[ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - ( 2, 2, 2 - トリフルオロエチルイミノ ) - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 14) ;

[ [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 -

50

イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファニリデン]シアナミド(化合物 P 1 5 ) ;

[ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 1 6 ) ;

N - [ [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファニリデン]アセトアミド(化合物 P 1 7 ) ;

[ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - メチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 1 8 ) ;

エチルイミノ - [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 1 9 ) ;

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 6 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 3 - メチル - イミダゾ[ 4 , 5 - b ]ピリジン - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパン - カルボニトリル(化合物 P 2 0 ) ;

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル - スルホンイミドイル)イミダゾ[ 4 , 5 - b ]ピリジン - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 2 1 ) ;

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 2 2 )、

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 2 3 )、

N - [ [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファニリデン]アセトアミド(化合物 P 2 4 )、

N - [ [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 - ピリジリオキシ) - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファニリデン]アセトアミド(化合物 P 2 5 )、

[ 2 - [ 5 - ( 2 , 2 - ジフルオロプロポキシ) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 2 6 )、

[ 2 - [ 5 - ( 2 , 2 - ジフルオロプロポキシ) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン(化合物 P 2 7 )、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 2 8 )、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - メチル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 2 9 )、

1 - [ 6 - [ 5 - [ N - シクロプロピル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - 5 - エチルスルホニル - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 3 0 )、

1 - [ 6 - [ 5 - [ N - シクロプロピル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 5 - エチルスルホニル - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物 P 3 1 )、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル)ス

10

20

30

40

50

ルホンイミドイル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 3 2)、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 3 3)、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - [ N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル] ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 3 4)、

エチルイミノ - [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 5 - ピリミジン - 2 - イル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3 5)、

10

[ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 5 - ピリミジン - 2 - イル - 2 - ピリジル) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3 6)、

[ 2 - [ 5 - ( 3 - クロロピラゾール - 1 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3 7)、

[ 2 - [ 5 - ( 3 - クロロピラゾール - 1 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3 8)、

20

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3 9)、

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - [ 4 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 2 - イル] - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 0)、

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - [ 4 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 2 - イル] - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 1)、

[ 2 - [ 5 - ( 5 - クロロピリミジン - 2 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 2)、

30

[ 2 - [ 5 - ( 5 - クロロピリミジン - 2 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 3)、

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 2 - ピリジル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 4)、

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 2 - ピリジル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 5)、

40

[ 2 - [ 6 - ( 3 - クロロ - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 6)、

[ 2 - [ 6 - ( 3 - クロロ - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル] - エチルイミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 7)、

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] - 2 - ピリジル] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 8)、

50

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ] - 2 - ピリジル ] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4 9 ) 、  
[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 - ピリジルオキシ ) - 2 - ピリジル ] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5 0 ) 、

エチルイミノ - [ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - ( 2 - ピリジルオキシ ) - 2 - ピリジル ] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5 1 ) 、

2 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] ピリミジン - 5 - カルボニトリル (化合物 P 5 2 ) 、

2 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] ピリミジン - 5 - カルボニトリル (化合物 P 5 3 ) 、

[ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 6 - ピリミジン - 2 - イル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5 4 ) 、

エチルイミノ - [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 6 - ピリミジン - 2 - イル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5 5 ) 、

[ 2 - [ 3 - エチルスルホニル - 6 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) - 2 - ピリジル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - (トリフルオロメチル) - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5 6 ) 、

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - [ N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 5 7 ) 、

1 - [ 6 - [ 6 - [ N - シクロプロピル - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] - 3 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 5 - エチルスルホニル - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 5 8 )

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 2 2】

殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドと、任意に助剤又は希釈剤とを含む組成物。

#### 【請求項 2 3】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシド或いは請求項 2 2 に記載の組成物を適用する工程を含む方法。

#### 【請求項 2 4】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、請求項 2 2 に記載の組成物で処理する工程を含む方法。

#### 【発明の詳細な説明】

#### 【技術分野】

#### 【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する、殺有害生物的に活性である、特に殺虫的に活性である複素環式誘導体、それらの調製のためのプロセス、それらの化合物を含む組成物及び節

10

20

30

40

50

足動物、特に昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表例を含む動物有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

殺有害生物作用を有するヘテロ環式化合物は、公知であり、例えば国際公開第2014/104407号、国際公開第2016/107831号、国際公開第2016/107831号、国際公開第2013/018928号、国際公開第2014/119672号、国際公開第2014/119494号、国際公開第2014/119679号及び国際公開第2014/119670号に記載されている。

【発明の概要】

10

【課題を解決するための手段】

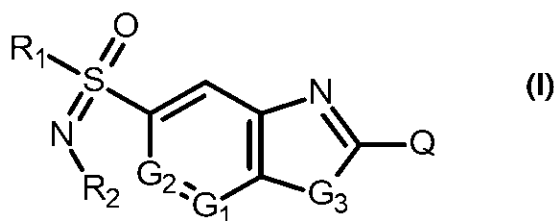
【0003】

意外なことに、ここで、硫黄及びスルホキシミン含有置換基を有する特定の新規な殺有害生物活性誘導体が殺有害生物剤として好ましい特性を有することが見出された。

【0004】

したがって、本発明は、式 I

【化1】



20

(式中、

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、相互に独立して、CH又はNであり；

G<sub>3</sub>は、NCH<sub>3</sub>又はOであり；

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；

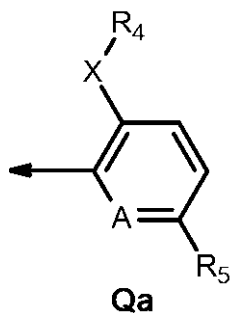
30

R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C(O)R<sub>3</sub>又はCNであり；

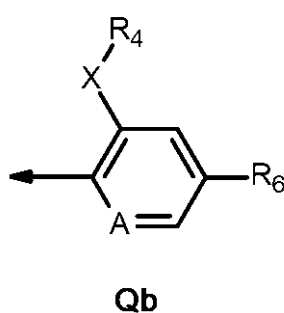
R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

Qは、式Qa及びQb

【化2】



Qa



Qb

40

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

Aは、CH又はNであり；

Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>4</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；

50

R<sub>5</sub>は、水素又はハロゲンであるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個の環ヘテロ原子を含有し、ここで、前記環系は、少なくとも1個の環窒素原子を含有し、及び2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができず；

R<sub>6</sub>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノによって単置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>、-N(R<sub>9</sub>)C(=O)R<sub>10</sub>、-N(R<sub>11</sub>)R<sub>12</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、少なくとも1個の環窒素原子を含有し、且つ窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される2個又は3個のさらなる環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができず；R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は、相互に独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>9</sub>は、H又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>10</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sub>11</sub>及びR<sub>12</sub>は、相互に独立して、H又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである；

の化合物又は式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

少なくとも1つの塩基性中心(basic centre)を有する式Iの化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換されるC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和

10

20

30

40

50

又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン - 又はアリールスルホン酸、例えばメタン - 又は $p$ -トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩又はマグネシウム塩、又はアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ - 、ジ - 又はトリ - 低級アルキルアミン、例えばエチル - 、ジエチル - 、トリエチル - 又はジメチルプロピルアミン、又はモノ - 、ジ - 又はトリヒドロキシ - 低級アルキルアミン、例えばモノ - 、ジ - 又はトリエタノールアミンを形成することができる。

10

#### 【0006】

各事例において、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N - オキシドとしての酸化型形態又は例えば農学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

#### 【0007】

N - オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、“Heterocyclic N - oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991といった書籍に記載されている。

20

#### 【0008】

本発明に係る式Iの化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

#### 【0009】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1 ~ n個の炭素原子を有する飽和直鎖又は分岐炭化水素基を指し、例えばメチル、エチル、 $n$ -プロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、 $n$ -ヘキシル、 $n$ -ペンチル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピルといった基のいずれか1つである。

30

#### 【0010】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1 ~ n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し(上記のとおり)、ここで、これらの基における水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で置き換えられ得、すなわち例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブromoエチル、2-ヨードエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブromoプロピル、3-ブromoプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル

40

50

、 1 - ( ブロモメチル ) - 2 - ブロモエチル、 4 - フルオロブチル、 4 - クロロブチル、 4 - ブロモブチル又はノナフルオロブチルの 1 つである。「  $C_1 \sim C_2$  - フルオロアルキル」という用語によれば、 1、 2、 3、 4 又は 5 つのフッ素原子を有する  $C_1 \sim C_2$  - アルキル基を指し、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチル、 1 - フルオロエチル、 2 - フルオロエチル、 2, 2 - ジフルオロエチル、 2, 2, 2 - トリフルオロエチル、 1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル又はペンタ - フルオロエチルのいずれか 1 つである。

【 0 0 1 1 】

本明細書において用いられる場合、「  $C_1 \sim C_n$  アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、 1 ~ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメトキシ、エトキシ、 n - プロポキシ、 1 - メチルエトキシ、 n - ブトキシ、 1 - メチルプロポキシ、 2 - メチルプロポキシ又は 1, 1 - ジメチルエトキシのいずれか 1 つである。

10

【 0 0 1 2 】

本明細書において用いられる場合、「  $C_1 \sim C_n$  ハロアルコキシ」という用語は、フッ素、塩素、臭素及び / 又はヨウ素で部分的又は完全に置換されている上記の  $C_1 \sim C_n$  アルコキシ基を指し、すなわち例えばクロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、 2 - フルオロエトキシ、 2 - クロロエトキシ、 2 - ブロモエトキシ、 2 - ヨードエトキシ、 2, 2 - ジフルオロエトキシ、 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、 2 - クロロ - 2 - フルオロエトキシ、 2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエトキシ、 2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエトキシ、 2, 2, 2 - トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、 2 - フルオロプロポキシ、 3 - フルオロプロポキシ、 2, 2 - ジフルオロプロポキシ、 2, 3 - ジフルオロプロポキシ、 2 - クロロプロポキシ、 3 - クロロプロポキシ、 2, 3 - ジクロロプロポキシ、 2 - ブロモプロポキシ、 3 - ブロモプロポキシ、 3, 3, 3 - トリフルオロプロポキシ、 3, 3, 3 - トリクロロプロポキシ、 2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、 1 - ( フルオロメチル ) - 2 - フルオロエトキシ、 1 - ( クロロメチル ) - 2 - クロロエトキシ、 1 - ( ブロモメチル ) - 2 - ブロモエトキシ、 4 - フルオロブトキシ、 4 - クロロブトキシ又は 4 - ブロモブトキシのいずれか 1 つである。

20

【 0 0 1 3 】

本明細書において用いられる場合、「  $C_1 \sim C_n$  - アルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子を介して結合している、 1 ~ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルチオ、エチルチオ、 n - プロピルチオ、 1 - メチルエチルチオ、ブチルチオ、 1 - メチルプロピルチオ、 2 - メチルプロピルチオ又は 1, 1 - ジメチルエチルチオのいずれか 1 つである。

30

【 0 0 1 4 】

本明細書において用いられる場合、「  $C_1 \sim C_n$  アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル基の硫黄原子を介して結合している、 1 ~ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n - プロピルスルフィニル、 1 - メチルエチル - スルフィニル、 n - ブチルスルフィニル、 1 - メチルプロピルスルフィニル、 2 - メチルプロピルスルフィニル、 1, 1 - ジメチル - エチルスルフィニル、 n - ペンチルスルフィニル、 1 - メチルブチルスルフィニル、 2 - メチルブチルスルフィニル、 3 - メチル - ブチルスルフィニル、 1, 1 - ジメチルプロピルスルフィニル、 1, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、 2, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル又は 1 - エチルプロピルスルフィニルのいずれか 1 つである。

40

【 0 0 1 5 】

本明細書において用いられる場合、「  $C_1 \sim C_n$  アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル基の硫黄原子を介して結合している、 1 ~ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルスルホニル、エチルスル

50



ホニル、*n* - プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、*n* - ブチルスルホニル、1 - メチルプロピルスルホニル、2 - メチルプロピルスルホニル又は *t* - ブチルスルホニルのいずれか1つである。

【0016】

本明細書において用いられる場合、「シアノによって単置換された  $C_1 \sim C_n$  アルキル」という用語は、シアノ基で置換されている、1 ~ *n* 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、例えばシアノメチレン、シアノエチレン、1, 1 - ジメチルシアノメチル、シアノメチル、シアノエチル及び 1 - ジメチルシアノメチルである。

【0017】

本明細書において用いられる場合、「シアノで単置換された  $C_1 \sim C_n$  アルコキシ」という用語は、シアノ基で置換されている、1 個 ~ *n* 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐状の飽和アルコキシ基を指し（上記のとおり）、例えばシアノメトキシ、シアノエチオキシ、1, 1 - ジメチルシアノメトキシ及び 1 - ジメチルシアノメトキシである。

【0018】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロプロパン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの 3 ~ 6 員シクロアルキル基を指す。

【0019】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルなどの他の意味との組み合わせでハロゲンにも適用される。

【0020】

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

【0021】

本発明に関連して、「環炭素原子を介して結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、...、及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環ヘテロ原子を含有することができる」の例は、特にこれらに限定されないが、フェニル、ピリジニル及びピリミジニル；好ましくはフェニル、2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル及びピリミジン - 5 - イルである。

【0022】

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

【0023】

本発明に係る特定の実施形態が以下に記載のとおり提供される。

【0024】

実施形態 1 は、式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $Q$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$  及び  $R_{12}$  は、上記において式 I で定義されているとおりである。

【0025】

実施形態 2 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、 $Q$  は、 $Q_a$  である。

【0026】

実施形態 3 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、 $Q$  は、 $Q_b$  である。

## 【 0 0 2 7 】

実施形態 1 ~ 3 に関して、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$  及び  $R_{12}$  の好ましい値は、これらのいずれかの組み合わせにおいて、以下に記載されているとおりである。

## 【 0 0 2 8 】

好ましくは、 $G_1$  及び  $G_2$  の両方は、 $N$  である。

## 【 0 0 2 9 】

$G_1$  が  $CH$  であり、 $G_2$  が  $N$  である場合も好ましい。

## 【 0 0 3 0 】

$G_1$  が  $N$  であり、 $G_2$  が  $CH$  である場合も好ましい。

## 【 0 0 3 1 】

最も好ましくは、 $G_1$  及び  $G_2$  の両方は、 $CH$  である。

## 【 0 0 3 2 】

好ましくは、 $G_3$  は、 $O$  である。

## 【 0 0 3 3 】

好ましくは、 $R_1$  は、メチル又はトリフルオロメチル；最も好ましくはトリフルオロメチルである。

## 【 0 0 3 4 】

好ましくは、 $R_2$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $-C(O)R_3$  又はシアノである。

## 【 0 0 3 5 】

より好ましくは、 $R_2$  は、 $H$ 、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルである。

## 【 0 0 3 6 】

最も好ましくは、 $R_2$  は、 $H$ 、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

## 【 0 0 3 7 】

好ましくは、 $R_3$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；最も好ましくは、 $R_3$  は、メチルである。

## 【 0 0 3 8 】

好ましくは、 $X$  は、 $S$  又は  $SO_2$  であり；最も好ましくは、 $X$  は、 $SO_2$  である。

## 【 0 0 3 9 】

好ましくは、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_2$  アルキルであり；最も好ましくは、 $R_4$  は、エチルである。

## 【 0 0 4 0 】

好ましくは、 $R_5$  は、水素であるか；又は  
 $R_5$  は、環炭素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有することができるか；又は  
 $R_5$  は、環窒素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

## 【 0 0 4 1 】

より好ましくは、 $R_5$  は、水素であるか；又は  
 $R_5$  は、環炭素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されている 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

10

20

30

40

50

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0042】

より好ましくは、R<sub>5</sub>は、水素であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニル（好ましくはピリミジニル）から選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリル（好ましくはピラゾリル及びトリアゾリル）から選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0043】

より好ましくは、R<sub>5</sub>は、水素、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルである。

【0044】

最も好ましくは、R<sub>5</sub>は、水素、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル、ピリミジン-2-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル又は3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルである。

【0045】

好ましくは、R<sub>6</sub>は、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノによって単置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>（式中、R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は、相互に独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである）、-N(R<sub>9</sub>)COR<sub>10</sub>（式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、相互に独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである）であるか、又はR<sub>6</sub>は、2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0046】

より好ましくは、R<sub>6</sub>は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCCH<sub>3</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニル（好ましくはピリミジニル）から選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリル（好ましくはピラゾリル及びトリアゾリル）から選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

## 【 0 0 4 7 】

最も好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルである。

## 【 0 0 4 8 】

好ましくは、 $R_7$ 及び $R_8$ は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

## 【 0 0 4 9 】

最も好ましくは、 $R_7$ 及び $R_8$ は、メチルである。

## 【 0 0 5 0 】

好ましくは、 $R_9$ は、H又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

## 【 0 0 5 1 】

より好ましくは、 $R_9$ は、H又はメチルであり；最も好ましくは、 $R_9$ は、メチルである。

## 【 0 0 5 2 】

好ましくは、 $R_{10}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；より好ましくは、 $R_{10}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；最も好ましくは、 $R_{10}$ は、メチルである。

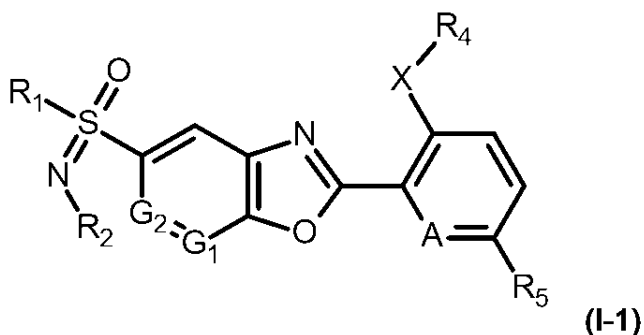
## 【 0 0 5 3 】

好ましくは、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、相互に独立して、H又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；最も好ましくは、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、メチルである。

## 【 0 0 5 4 】

本発明に係る化合物の1つの群は、式 I - 1

## 【 化 3 】



(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、上記の式 I で定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドであり；ここで、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

## 【 0 0 5 5 】

式 I - 1 の化合物の好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

#### 【0056】

式I-1の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル、ピリミジン-2-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択される。

#### 【0057】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；好ましくは、R<sub>1</sub>がCH<sub>3</sub>又はCF<sub>3</sub>であり；より好ましくは、R<sub>1</sub>がCF<sub>3</sub>である、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1a)の化合物である。

#### 【0058】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、R<sub>2</sub>がH、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シクロプロピル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C(O)R<sub>3</sub>又はシアノであり；R<sub>3</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>3</sub>がメチルである、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1b)の化合物であり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、COCH<sub>3</sub>、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルである。

#### 【0059】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又はSO<sub>2</sub>、好ましくはSO<sub>2</sub>である、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1c)の化合物である。

#### 【0060】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、R<sub>4</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>4</sub>がエチルである、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1d)の化合物である。

#### 【0061】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1e)の化合物である。

#### 【0062】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-1f)の化合物である。

#### 【0063】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、G<sub>2</sub>がNであり、G<sub>1</sub>がCHである、式(I-1)の化合物又は式(I-1)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物

10

20

30

40

50

である式 (I - 1 g) の化合物である。

【0064】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ 及び $G_1$ が両方ともCHである、式 (I - 1) の化合物又は式 (I - 1) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 1 h) の化合物である。

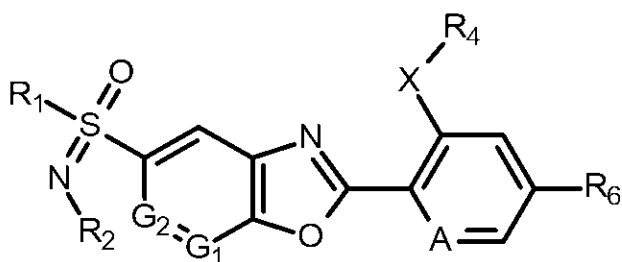
【0065】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ がCHであり、 $G_1$ がNである、式 (I - 1) の化合物又は式 (I - 1) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 1 i) の化合物である。

【0066】

本発明に係る化合物の別の群は、式 I - 2

【化4】



(I-2)

(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、上記の式 I で定義されているとおりである)

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

$R_6$ は、好ましくは、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、シアノで置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-N = S(O)R_7R_8$ 、 $-N(R_9)COR_{10}$ 又は2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0067】

式 I - 2 の化合物の好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、シアノによって置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2 - ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であ

るか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0068】

式I-2の化合物のより好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2, 2-ジフルオロプロポキシ、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル、4-トリフルオロメチル-ピリミジン-2-イル、5-シアノ-ピリミジン-2-イル、5-クロロ-ピリミジン-2-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルからなる群から選択される。

10

【0069】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $R_1$ が $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が $CH_3$ 又は $CF_3$ であり；より好ましくは、 $R_1$ が $CF_3$ である、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2a)の化合物である。

20

【0070】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ がH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2b)の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2, 2, 2-トリフルオロエチルである。

【0071】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又は $SO_2$ 、好ましくは $SO_2$ である、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2c)の化合物である。

30

【0072】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2d)の化合物である。

【0073】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2e)の化合物である。

40

【0074】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2f)の化合物である。

【0075】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $G_2$ がNであり、 $G_1$ がCHである、式(I-2)の化合物又は式(I-2)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-2g)の化合物である。

【0076】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ 及び $G_1$ が両方ともCHである、式

50

(I - 2) の化合物又は式 (I - 2) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 2 h) の化合物である。

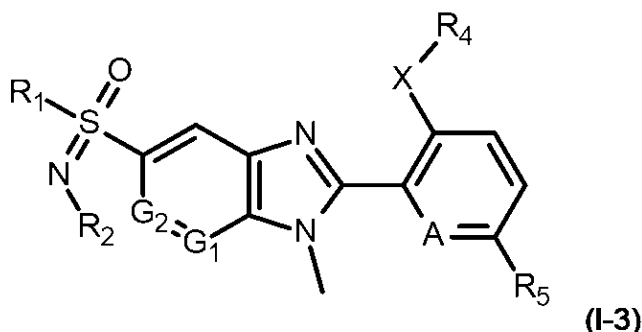
【0077】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ がCHであり、 $G_1$ がNである、式 (I - 2) の化合物又は式 (I - 2) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 2 i) の化合物である。

【0078】

本発明に係る化合物の別の群は、式 I - 3

【化5】



(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、上記の式 I で定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドであり；ここで、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0079】

式 I - 3 の化合物の好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0080】

式 I - 3 の化合物のより好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、 $R_5$ は、H、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル、ピリミジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール -



1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【 0 0 8 1 】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、 $R_1$  が  $C_1 \sim C_4$  アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$  が  $CH_3$  又は  $CF_3$  であり；より好ましくは、 $R_1$  が  $CF_3$  である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 a ) の化合物である。

【 0 0 8 2 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$  が H、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C(O)R_3$  又はシアノであり； $R_3$  が  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；好ましくは、 $R_3$  がメチルである、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 b ) の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$  は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$  は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルである。

【 0 0 8 3 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $X$  が S 又は  $SO_2$ 、好ましくは  $SO_2$  である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 c ) の化合物である。

【 0 0 8 4 】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$  が  $C_1 \sim C_2$  アルキルであり；好ましくは、 $R_4$  がエチルである、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 d ) の化合物である。

【 0 0 8 5 】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、 $A$  が N である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 e ) の化合物である。

【 0 0 8 6 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $A$  が CH である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 f ) の化合物である。

【 0 0 8 7 】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、 $G_2$  が N であり、 $G_1$  が CH である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 g ) の化合物である。

【 0 0 8 8 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$  及び  $G_1$  が両方とも CH である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 h ) の化合物である。

【 0 0 8 9 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$  が CH であり、 $G_1$  が N である、式 ( I - 3 ) の化合物又は式 ( I - 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 3 i ) の化合物である。

【 0 0 9 0 】

本発明に係る化合物の別の群は、式 I - 4

10

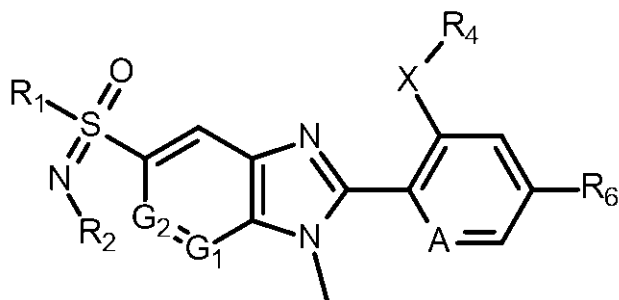
20

30

40

50

## 【化 6】



(I-4)

10

(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、上記の式 I で定義されているとおりである)

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

$R_6$ は、好ましくは、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、シアノで置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-N = S(O)R_7R_8$ 、 $-N(R_9)COR_{10}$ 又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

20

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

## 【0091】

式 I - 4 の化合物の好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、シアノによって置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は 2 - ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は

30

$R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

40

## 【0092】

式 I - 4 の化合物のより好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N = S(O)(CH_3)_2$

50

、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【0093】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $R_1$ が $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が $CH_3$ 又は $CF_3$ であり；より好ましくは、 $R_1$ が $CF_3$ である、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 a)の化合物である。

【0094】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ がH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 b)の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

【0095】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又は $SO_2$ 、好ましくは $SO_2$ である、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 c)の化合物である。

【0096】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式(I - 2)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 d)の化合物である。

【0097】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 e)の化合物である。

【0098】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 f)の化合物である。

【0099】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $G_2$ がNであり、 $G_1$ がCHである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 g)の化合物である。

【0100】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ 及び $G_1$ が両方ともCHである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 h)の化合物である。

【0101】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $G_2$ がCHであり、 $G_1$ がNである、式(I - 4)の化合物又は式(I - 4)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I - 4 i)の化合物である。

【0102】

本発明に係る化合物の別の群は、式I - 5

10

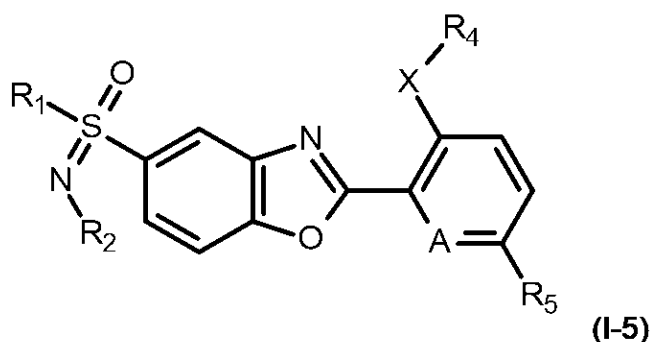
20

30

40

50

## 【化 7】



10

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 及び $R_5$ は、上記の式 I で定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドであり；ここで、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されている 5 員～6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

20

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

## 【0103】

式 I - 5 の化合物の好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

30

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基  $A$  を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

## 【0104】

式 I - 5 の化合物のより好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、 $R_5$ は、H、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル、ピリミジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

40

## 【0105】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、 $R_1$ が  $C_1 \sim C_4$  アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が  $CH_3$  又は  $CF_3$  であり；より好ましくは、 $R_1$ が  $CF_3$  である、式 (I - 5) の化合物又は式 (I - 5) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 5 a) の化合物である。

## 【0106】

50

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ がH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式(I-5)の化合物又は式(I-5)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-5b)の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルである。

【0107】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $X$ がS又は $SO_2$ 、好ましくは $SO_2$ である、式(I-5)の化合物又は式(I-5)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-5c)の化合物である。

10

【0108】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式(I-5)の化合物又は式(I-5)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-5d)の化合物である。

【0109】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $A$ がNである、式(I-5)の化合物又は式(I-5)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-5e)の化合物である。

【0110】

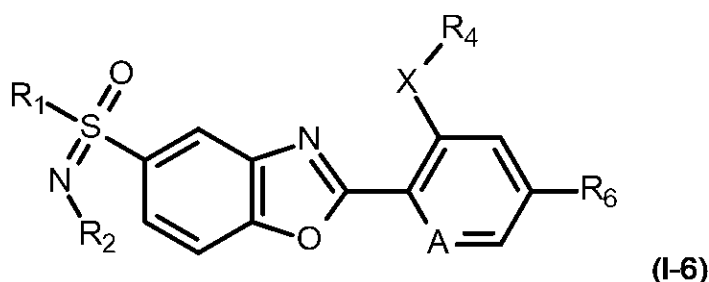
20

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $A$ がCHである、式(I-5)の化合物又は式(I-5)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-5f)の化合物である。

【0111】

本発明に係る化合物の別の群は、式I-6

【化8】



30

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 、 $X$ 、 $R_4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、上記の式Iで定義されているとおりである)

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

$R_6$ は、好ましくは、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、シアノで置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-N = S(O)R_7R_8$ 、 $-N(R_9)COR_{10}$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は  
 $R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

40

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

50

## 【0112】

式 I - 6 の化合物の好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、シアノによって置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2 - ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2 - ピリジルオキシであるか；又は $R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

10

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

## 【0113】

式 I - 6 の化合物のより好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

20

## 【0114】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $R_1$ が $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が $CH_3$ 又は $CF_3$ であり；より好ましくは、 $R_1$ が $CF_3$ である、式 ( I - 6 ) の化合物又は式 ( I - 6 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 6 a ) の化合物である。

30

## 【0115】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ がH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式 ( I - 6 ) の化合物又は式 ( I - 6 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 6 b ) の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

40

## 【0116】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又は $SO_2$ 、好ましくは $SO_2$ である、式 ( I - 6 ) の化合物又は式 ( I - 6 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 6 c ) の化合物である。

## 【0117】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式 ( I - 6 ) の化合物又は式 ( I - 6 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 6 d ) の化合物である。

## 【0118】

50

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、A が N である、式 (I - 6) の化合物又は式 (I - 6) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 6 e) の化合物である。

【0119】

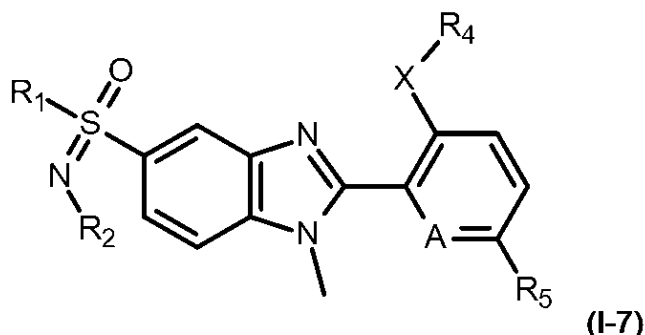
この実施形態による化合物の別の好ましい群は、A が CH である、式 (I - 6) の化合物又は式 (I - 6) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 6 f) の化合物である。

【0120】

本発明に係る化合物の別の群は、式 I - 7

【化 9】

10



20

(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、A、X、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、上記の式 I で定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドであり；ここで、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

30

【0121】

式 I - 7 の化合物の好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

40

【0122】

式 I - 7 の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル、ピリミジン - 2 -

50

イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択される。

【0123】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、 $R_1$ が $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が $CH_3$ 又は $CF_3$ であり；より好ましくは、 $R_1$ が $CF_3$ である、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7a)の化合物である。

【0124】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ がH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7b)の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルである。

【0125】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又は $SO_2$ 、好ましくは $SO_2$ である、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7c)の化合物である。

【0126】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7d)の化合物である。

【0127】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7e)の化合物である。

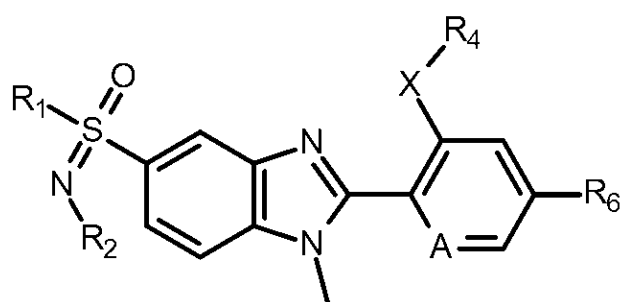
【0128】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-7)の化合物又は式(I-7)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-7f)の化合物である。

【0129】

本発明に係る化合物の別の群は、式I-8

【化10】



(I-8)

(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A、X、 $R_4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、上記の式Iで定義されているとおりである)

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



R<sub>6</sub>は、好ましくは、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノで置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>、-N(R<sub>9</sub>)COR<sub>10</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又はR<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又はR<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

10

## 【0130】

式I-8の化合物の好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、シアノによって置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>又は2-ピリジルオキシであり；最も好ましくは、R<sub>6</sub>は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、-OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、シアノによって単置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又はR<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又はR<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

20

## 【0131】

式I-8の化合物のより好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>、2-ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>6</sub>は、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル、4-トリフルオロメチル-ピリミジン-2-イル、5-シアノ-ピリミジン-2-イル、5-クロロ-ピリミジン-2-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルからなる群から選択される。

30

## 【0132】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；好ましくは、R<sub>1</sub>がCH<sub>3</sub>又はCF<sub>3</sub>であり；より好ましくは、R<sub>1</sub>がCF<sub>3</sub>である、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8a)の化合物である。

40

## 【0133】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、R<sub>2</sub>がH、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シクロプロピル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C(O)R<sub>3</sub>又はシアノであり；R<sub>3</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>3</sub>がメチルである、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8b)の化合物であり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、COCH<sub>3</sub>、シクロプロピル、メチル、エチル、ト

50

リフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

【0134】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又は $SO_2$ であり、好ましくは $SO_2$ である、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8c)の化合物である。

【0135】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8d)の化合物である。

10

【0136】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8e)の化合物である。

【0137】

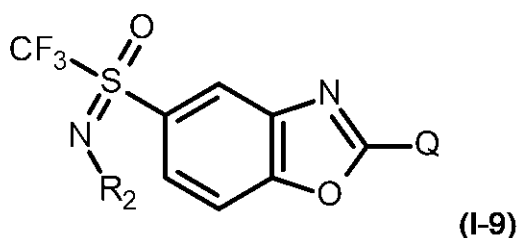
この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-8)の化合物又は式(I-8)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-8f)の化合物である。

【0138】

本発明に係る化合物の際立った群は、式(I-9)

20

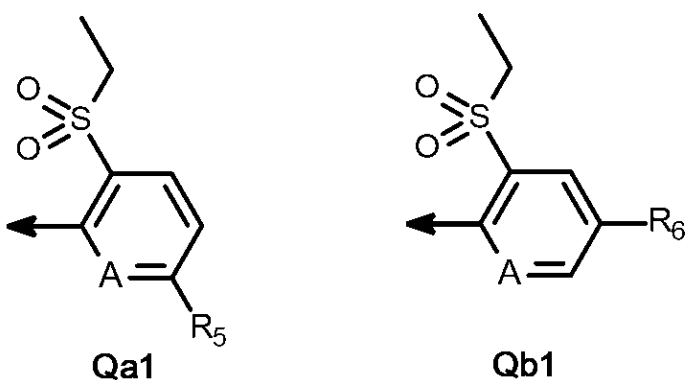
【化11】



(式中、 $R_2$ は、上記の式Iで定義されているとおりであり、及びQは、式Qa1及びQb1

30

【化12】



40

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

A、 $R_5$ 及び $R_6$ は、上記の式Iで定義されているとおりである)

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

$R_2$ は、好ましくは、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ は、

50

メチルである。

【 0 1 3 9 】

式 I - 9 の化合物の 1 つの好ましい群において、A は、N である。

【 0 1 4 0 】

式 I - 9 の化合物の別の好ましい群において、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、C O C H<sub>3</sub>、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルである。

【 0 1 4 1 】

式 I - 9 の化合物の特に好ましい群において、R<sub>2</sub>は、H、エチル、シクロプロピル又は 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>2</sub>は、H 又はエチルである。

【 0 1 4 2 】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、Q が Q a 1 である、式 ( I - 9 ) の化合物又は式 ( I - 9 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 9 a ) の化合物である。

【 0 1 4 3 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、Q が Q b 1 である、式 ( I - 9 ) の化合物又は式 ( I - 9 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 9 b ) の化合物である。

【 0 1 4 4 】

式 ( I - 9 a ) の化合物の好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

【 0 1 4 5 】

式 ( I - 9 a ) の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【 0 1 4 6 】

式 ( I - 9 a ) の化合物の特に好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル、ピリミジン - 2 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1 , 2 , 4 - トリアゾ

10

20

30

40

50

ール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【0147】

式 (I - 9 a) の化合物の際立った群において、 $R_5$  は、好ましくは、H、無置換 C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；より好ましくは、 $R_5$  は、H、ピリミジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、 $R_5$  は、H、ピリミジン - 2 - イル及び 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

10

【0148】

式 (I - 9 b) の化合物の好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、シアノによって単置換された  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、シアノで置換された  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-N=S(O)R_7R_8$  (式中、 $R_7$  及び  $R_8$  は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである)、 $-N(R_9)COR_{10}$  (式中、 $R_9$  及び  $R_{10}$  は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである) 又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$  は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

20

$R_6$  は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

【0149】

式 (I - 9 b) の化合物のより好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルコキシ、シアノによって置換された  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$  又は 2 - ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$  は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$  又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は  $R_6$  は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

30

$R_6$  は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

40

【0150】

式 (I - 9 b) の化合物の特に好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$  は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - ト

50

リフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【0151】

式(I-9b)の化合物の別の特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；より好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【0152】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-9)の化合物又は式(I-9)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-9c)の化合物である。

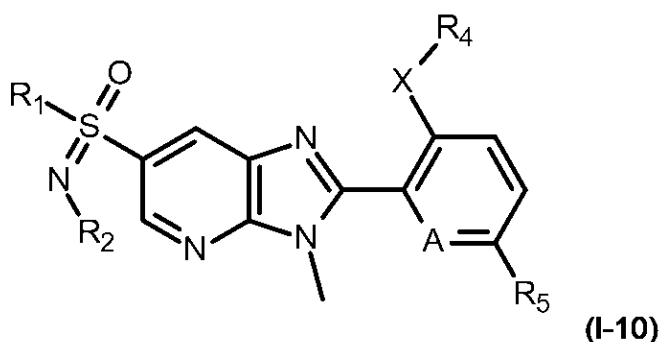
【0153】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-9)の化合物又は式(I-9)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-9e)の化合物である。

【0154】

本発明に係る化合物の別の群は、式I-10

【化13】



(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A、X、 $R_4$ 及び $R_5$ は、上記の式Iで定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドであり；ここで、 $R_5$ は、好ましくは、Hであるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0155】

式I-10の化合物の好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、Hであるか；又はR<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

10

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0156】

式I-10の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル、ピリミジン-2-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択される。

20

【0157】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルであり；好ましくは、R<sub>1</sub>がCH<sub>3</sub>又はCF<sub>3</sub>であり；より好ましくは、R<sub>1</sub>がCF<sub>3</sub>である、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10a)の化合物である。

【0158】

30

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、R<sub>2</sub>がH、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シクロプロピル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C(O)R<sub>3</sub>又はシアノであり；R<sub>3</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>3</sub>がメチルである、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10b)の化合物であり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、COCH<sub>3</sub>、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルである。

【0159】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、XがS又はSO<sub>2</sub>であり、好ましくはSO<sub>2</sub>である、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10c)の化合物である。

40

【0160】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、R<sub>4</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>4</sub>がエチルである、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10d)の化合物である。

【0161】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10e)の化合物である。

【0162】

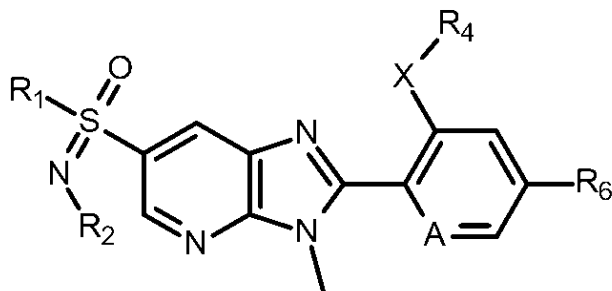
50

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-10)の化合物又は式(I-10)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-10f)の化合物である。

【0163】

本発明に係る化合物の別の群は、式I-11

【化14】



(I-11)

(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、A、X、R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>及びR<sub>12</sub>は、上記の式Iで定義されているとおりである)

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

R<sub>6</sub>は、好ましくは、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノで置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>、-N(R<sub>9</sub>)COR<sub>10</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員~6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0164】

式I-11の化合物の好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、シアノによって置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>又は2-ピリジルオキシであり；最も好ましくは、R<sub>6</sub>は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、-OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、シアノによって単置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>又は2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0165】

式I-11の化合物のより好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、-N=S(O)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>、2-ピリジルオキシ、

無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【0166】

10

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、 $R_1$ が  $C_1 \sim C_4$  アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルであり；好ましくは、 $R_1$ が  $CH_3$  又は  $CF_3$  であり；より好ましくは、 $R_1$ が  $CF_3$  である、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11a) の化合物である。

【0167】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、 $R_2$ が H、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C(O)R_3$  又はシアノであり； $R_3$ が  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ がメチルである、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11b) の化合物であり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

20

【0168】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、Xが S 又は  $SO_2$  であり、好ましくは  $SO_2$  である、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11c) の化合物である。

【0169】

この実施形態による化合物のさらなる好ましい群は、 $R_4$ が  $C_1 \sim C_2$  アルキルであり；好ましくは、 $R_4$ がエチルである、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11d) の化合物である。

30

【0170】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、Aが N である、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11e) の化合物である。

【0171】

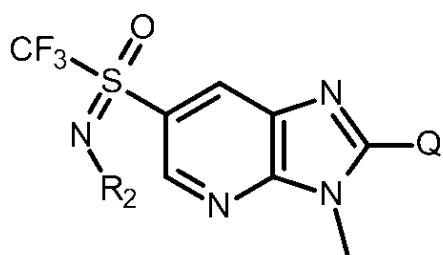
この実施形態による化合物の別の好ましい群は、Aが CH である、式 (I - 11) の化合物又は式 (I - 11) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 11f) の化合物である。

【0172】

本発明に係る化合物の際立った群は、式 (I - 12)

40

【化 15】



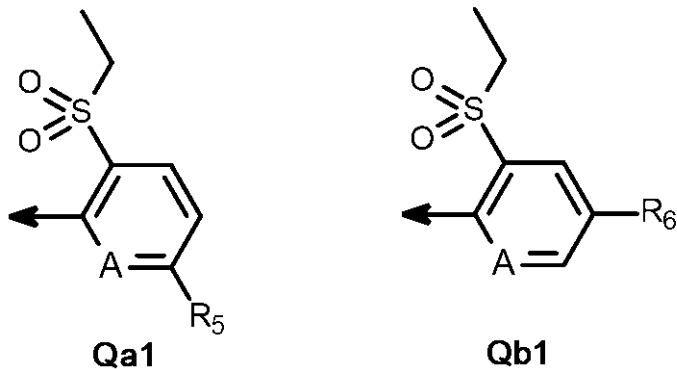
(I-12)

50



(式中、 $R_2$ は、上記の式 I で定義されているとおりであり、及び Q は、式 Q a 1 及び Q b 1

【化 1 6】



10

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

A、 $R_5$ 及び $R_6$ は、上記の式 I で定義されているとおりである )

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

$R_2$ は、好ましくは、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C(O)R_3$ 又はシアノであり； $R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $R_3$ は、メチルである。

20

【0173】

式 I - 12 の化合物の 1 つの好ましい群において、A は、N である。

【0174】

式 I - 12 の化合物の別の好ましい群において、 $R_2$ は、H、シアノ、 $COCH_3$ 、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、 $R_2$ は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、 $R_2$ は、H、メチル、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。

30

【0175】

式 I - 12 の化合物の特に好ましい群において、 $R_2$ は、H、エチル、シクロプロピル又は 2, 2, 2 - トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、 $R_2$ は、H 又はエチルである。

【0176】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、Q が Q a 1 である、式 ( I - 12 ) の化合物又は式 ( I - 12 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 12 a ) の化合物である。

【0177】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、Q が Q b 1 である、式 ( I - 12 ) の化合物又は式 ( I - 12 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 12 b ) の化合物である。

40

【0178】

式 ( I - 12 a ) の化合物の好ましい群において、 $R_5$ は、好ましくは、H であるか；又は

$R_5$ は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

$R_5$ は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であ

50

り、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0179】

式(I-12a)の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、Hであるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【0180】

式(I-12a)の化合物の特に好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル、ピリミジン-2-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択される。

【0181】

式(I-12a)の化合物の際立った群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換C結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合トリアゾリルであり；より好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、ピリミジン-2-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、ピリミジン-2-イル及び1,2,4-トリアゾール-1-イルからなる群から選択される；R<sub>5</sub>がHである場合がさらにより好ましい。

【0182】

式(I-12b)の化合物の好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、シアノによって単置換されたC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、シアノで置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、-N=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>(式中、R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は、相互に独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである)、-N(R<sub>9</sub>)COR<sub>10</sub>(式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、相互に独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである)又は2-ピリジルオキシであるか；又は

R<sub>6</sub>は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個又は2個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>6</sub>は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1個、2個又は3個の環窒素原子を含有する。

【0183】

式(I-12b)の化合物のより好ましい群において、R<sub>6</sub>は、好ましくは、シクロプロ

ピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、シアノによって置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2-ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$ は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

$R_6$ は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

#### 【0184】

式(I-12b)の化合物の特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル、4-トリフルオロメチル-ピリミジン-2-イル、5-シアノ-ピリミジン-2-イル、5-クロロ-ピリミジン-2-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルからなる群から選択される。

#### 【0185】

式(I-12b)の化合物の別の特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジニルであり；より好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル、4-トリフルオロメチル-ピリミジン-2-イル、5-シアノ-ピリミジン-2-イル、5-クロロ-ピリミジン-2-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル、4-トリフルオロメチル-ピリミジン-2-イル、5-クロロ-ピリミジン-2-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル及び3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルからなる群から選択される。

#### 【0186】

式(I-12b)の化合物のさらに特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シアノシクロプロピルであり；より好ましくは、 $R_6$ は、1-シアノシクロプロピルである。

#### 【0187】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式(I-12)の化合物又は式(I-12)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-

10

20

30

40

50

12c)の化合物である。

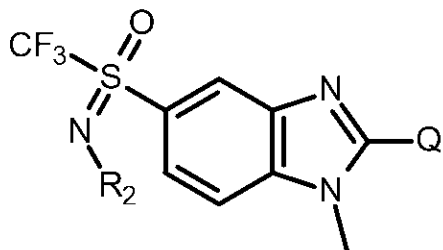
【0188】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式(I-12)の化合物又は式(I-12)の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式(I-12e)の化合物である。

【0189】

本発明に係る化合物の別の際立った群は、式(I-13)

【化17】

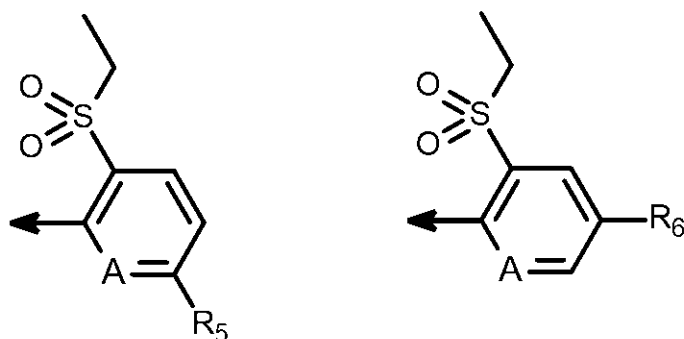


(I-13)

10

(式中、R<sub>2</sub>は、上記の式Iで定義されているとおりであり、及びQは、式Qa1及びQb1

【化18】



Qa1

Qb1

20

30

からなる群から選択される基であり、ここで、矢印は、二環式環の炭素原子に対する結合点を示し；

A、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は、上記の式Iで定義されているとおりである)

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

R<sub>2</sub>は、好ましくは、H、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、シクロプロピル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C(O)R<sub>3</sub>又はシアノであり；R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；好ましくは、R<sub>3</sub>は、メチルである。

【0190】

式I-13の化合物の好ましい群において、Aは、Nである。

【0191】

式I-13の化合物の別の好ましい群において、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、COCH<sub>3</sub>、シクロプロピル、メチル、エチル、トリフルオロエチル又はトリフルオロメチルであり；より好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>2</sub>は、H、メチル、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルである。

【0192】

式I-13の化合物の特に好ましい群において、R<sub>2</sub>は、H、エチル、シクロプロピル又は2,2,2-トリフルオロエチルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>2</sub>は、H又はエチル

40

50

である。

【 0 1 9 3 】

この実施形態による化合物の 1 つの好ましい群は、Q が Q a 1 である、式 ( I - 1 3 ) の化合物又は式 ( I - 1 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 1 3 a ) の化合物である。

【 0 1 9 4 】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、Q が Q b 1 である、式 ( I - 1 3 ) の化合物又は式 ( I - 1 3 ) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 ( I - 1 3 b ) の化合物である。

【 0 1 9 5 】

式 ( I - 1 3 a ) の化合物の好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

【 0 1 9 6 】

式 ( I - 1 3 a ) の化合物のより好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H であるか；又は

R<sub>5</sub>は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

R<sub>5</sub>は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

【 0 1 9 7 】

式 ( I - 1 3 a ) の化合物の特に好ましい群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル、3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル、ピリミジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【 0 1 9 8 】

式 ( I - 1 3 a ) の化合物の際立った群において、R<sub>5</sub>は、好ましくは、H、無置換 C 結合ピリミジニル、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；より好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、ピリミジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、R<sub>5</sub>は、H、ピリミジン - 2 - イル及び 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

【 0 1 9 9 】

10

20

30

40

50

式 (I - 13 a) の化合物のさらに際立った群において、 $R_5$  は、好ましくは、H、或いは無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合トリアゾリルであり；より好ましくは、 $R_5$  は、H、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

#### 【0200】

式 (I - 13 b) の化合物の好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、シアノによって単置換された  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、シアノで置換された  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-N=S(O)R_7R_8$  (式中、 $R_7$  及び  $R_8$  は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである)、 $-N(R_9)COR_{10}$  (式中、 $R_9$  及び  $R_{10}$  は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$  アルキルである) 又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$  は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員 ~ 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個又は 2 個の環窒素原子を含有するか；又は

$R_6$  は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 個、2 個又は 3 個の環窒素原子を含有する。

#### 【0201】

式 (I - 13 b) の化合物のより好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルコキシ、シアノによって置換された  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$  又は 2 - ピリジルオキシであり；最も好ましくは、 $R_6$  は、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_2CF_2CH_3$ 、シアノによって単置換された  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$  又は 2 - ピリジルオキシであるか；又は

$R_6$  は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピリジル及びピリミジニルから選択される 6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されているか；又は

$R_6$  は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されているピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルから選択される 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン及び  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されている。

#### 【0202】

式 (I - 13 b) の化合物の特に好ましい群において、 $R_6$  は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロピオキシ、シアノイソプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る N 結合ピラゾリル、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得る C 結合ピリミジニルであり；よりさらに好ましくは、 $R_6$  は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び 3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

#### 【0203】

10

20

30

40

50

式 (I - 13 b) の化合物の別の特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロエトキシ、ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、無置換であるか又はクロロ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るN結合ピラゾール、或いは無置換であるか又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るC結合ピリミジンであり；より好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択され；よりさらに好ましくは、 $R_6$ は、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2 - ピリジルオキシ、ピリミジン - 2 - イル、4 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリミジン - 2 - イル、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル及び3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルからなる群から選択される。

10

## 【0204】

式 (I - 13 b) の化合物のさらに特に好ましい群において、 $R_6$ は、好ましくは、シアノシクロプロピル、2 - ピリジルオキシ又はシアノによって単置換され得るC結合ピリミジンであり；より好ましくは、 $R_6$ は、1 - シアノシクロプロピル、2 - ピリジルオキシ又は5 - シアノ - ピリミジン - 2 - イルである。

20

## 【0205】

この実施形態による化合物の1つの好ましい群は、AがNである、式 (I - 13) の化合物又は式 (I - 13) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 13 c) の化合物である。

## 【0206】

この実施形態による化合物の別の好ましい群は、AがCHである、式 (I - 13) の化合物又は式 (I - 13) の化合物の好ましい実施形態のいずれかの化合物である式 (I - 13 e) の化合物である。

## 【0207】

30

本発明に係る化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの生物学的活性又は農芸化学的有効成分として用いられるための優れた特性（例えば、高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル、向上した物理化学的特性又は高い生分解性又は環境プロファイル）を含むいずれかの数の有益性を有し得る。特に、特定の式 (I) の化合物は、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者といった非標的節足動物に対して有利な安全性プロファイルを示し得ることが意外なことに見出された。最も具体的には、セイヨウミツバチ (*Apis mellifera*) である。

## 【0208】

他の態様において、本発明は、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、実施形態1、2若しくは3（上記）のいずれか又は式 (I - 1)、(I - 2)、(I - 3)、(I - 4)、(I - 5)、(I - 6)、(I - 7)、(I - 8)、(I - 9)、(I - 10)、(I - 11)、(I - 12)若しくは(I - 13)の化合物に係る実施形態のいずれかに定義されている式 (I) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドと、任意に助剤又は希釈剤とを含む組成物を提供する。

40

## 【0209】

さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、実施形態1、2若しく

50

は3(上記)のいずれか又は式(I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)、(I-8)、(I-9)、(I-10)、(I-11)、(I-12)若しくは(I-13)(上記)の化合物に係る実施形態のいずれかに定義されている式(I)の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド或いは上記に定義されている組成物を適用する工程を含む方法を提供する。

#### 【0210】

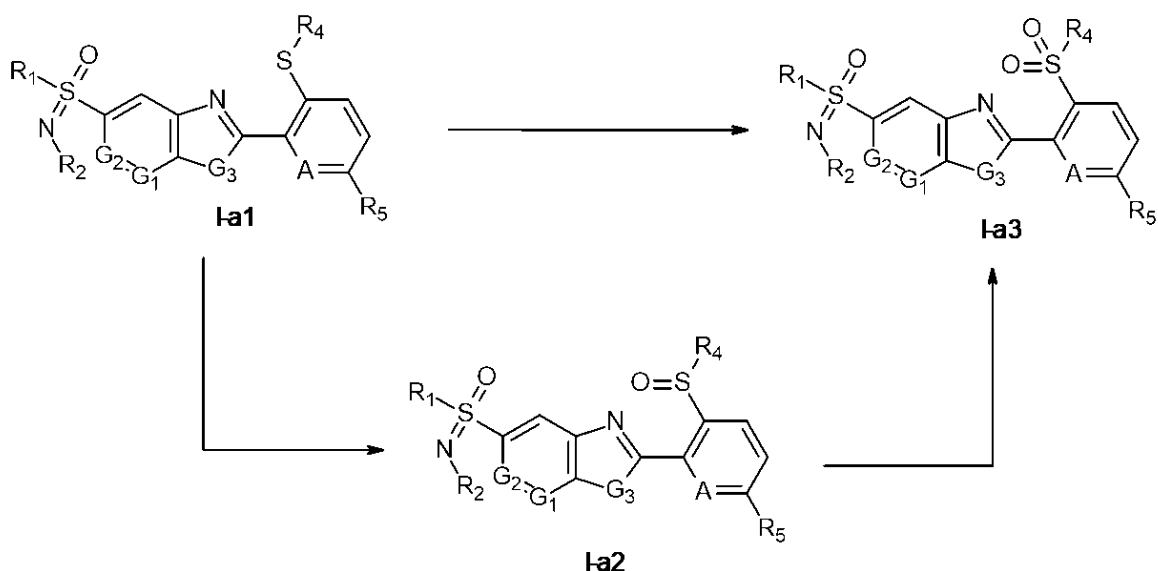
さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、繁殖材料又は繁殖材料が植えられている場所を、上記に定義されている組成物で処理する工程を含む方法を提供する。

#### 【0211】

式Iの化合物を調製するための本発明に係るプロセスは、当業者に公知の方法によって行われる。式I-a3(式中、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びAは、上記の式Iに定義されている)の化合物は、式I-a2(式中、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びAは、上記の式Iに定義されている)の化合物の酸化によって調製され得る。反応は、試薬、例えば過酸、例えば過酢酸若しくはm-クロロ過安息香酸又はヒドロペルオキシド、例えば過酸化水素若しくはtert-ブチル-ヒドロペルオキシド又は無機酸化剤、例えばモノペルオキシ二硫酸塩若しくは過マンガン酸カリウムによって行うことができる。同様に、式I-a2(式中、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びAは、上記の式Iに定義されている)の化合物は、上記の類似の条件下で式I-a1(式中、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びAは、上記の式Iに定義されている)の化合物の酸化によって調製され得る。これらの反応は、これらの条件に適合した様々な有機又は水性溶媒中で0 未満~溶媒系の沸点までの温度で行うことができる。反応において使用される溶媒の例は、脂肪族ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン及びクロロホルム、アルコール、例えばメタノール及びエタノール、酢酸、水；並びにこれらの混合物を含む。式I-a1の化合物は、上記のような同様の条件下で式I-a3の化合物にも直接酸化することができる。式I-a2及びI-a3の化合物への式I-a1の化合物の変換は、スキーム1において表される。

#### スキーム1

#### 【化19】



#### 【0212】

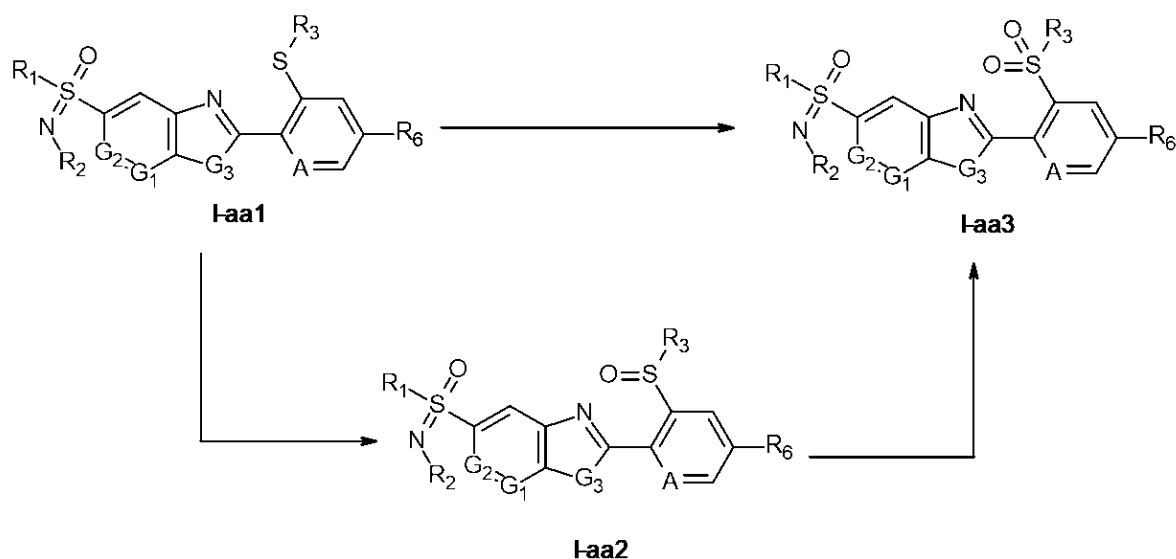
式I-a3(スキーム2)(式中、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びAは、上記の式Iに定義されている)の化合物は、式I-a3の化合物の合



成のためのスキーム 1 において記載されているような類似の手順により、式 I - a a 2 の化合物又は式 I - a a 1 (式中、X は、 $\text{SO}_2$ であり、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{R}_4$ 、 $\text{R}_6$ 、 $\text{G}_1$ 、 $\text{G}_2$ 、 $\text{G}_3$ 及び A は、上記の式 I に定義されている)の化合物から調製され得る。

スキーム 2

【化 2 0】



10

20

【 0 2 1 3】

代わりに、式 I - a 5 (式中、 $\text{R}_1$ 、 $\text{G}_1$ 、 $\text{G}_2$ 、 $\text{G}_3$ 及び Q は、上記の式 I に定義されており、 $\text{R}_2$ は、Hである)の化合物は、超原子価ヨウ素試薬、例えばジアセトキシオードベンゼン  $\text{PhI}(\text{OAc})_2$  の存在下、溶媒、例えばトルエン、アセトニトリル又はアルコール(好ましくはとりわけメタノール、2, 2, 2 - トリフルオロエタノール又は 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5 - オクタフルオロペンタン - 1 - オール)中、0 ~ 100 °C、好ましくは概ね室温の温度において、例えば Chem. Commun. 2017, 53, 348 - 351 (及びその中で引用されている参考文献)に見出される記載と類似して、式 II (式中、 $\text{R}_1$ 、 $\text{G}_1$ 、 $\text{G}_2$ 、 $\text{G}_3$ 及び Q は、上記の式 I に定義されている)のスルフィド化合物と、好適な窒素源、例えばアンモニア、カルバミン酸アンモニウム又は酢酸アンモニウム(好ましくはカルバミン酸アンモニウム)とを反応させることによって調製することができる(スキーム 3)。

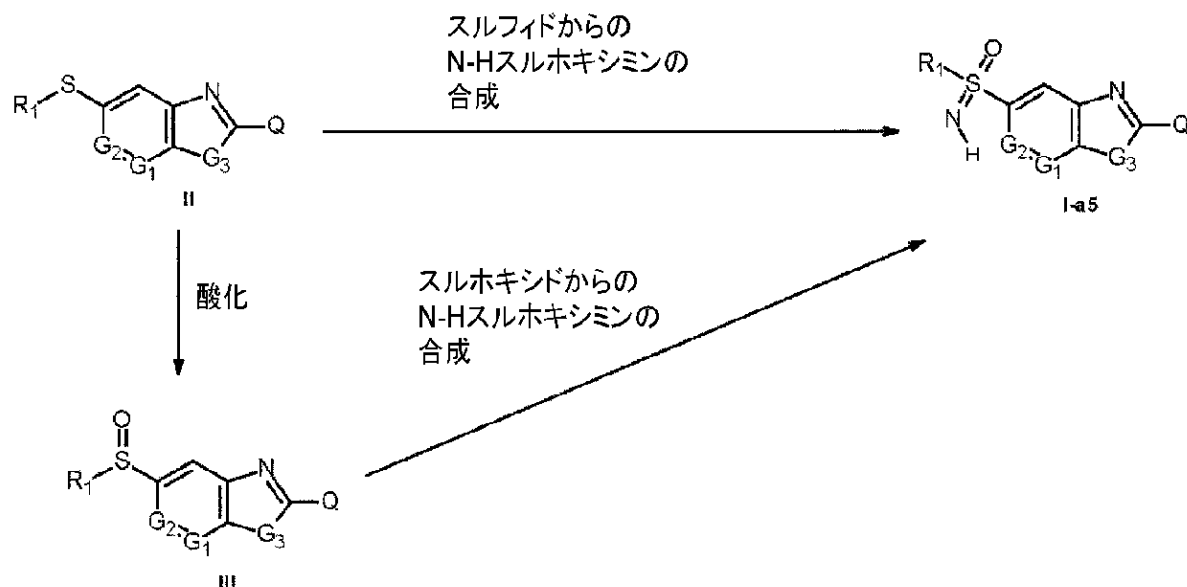
スキーム 3

30

40

50

## 【化 2 1】



10

代わりに、式 I I I (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びQは、上記の式 I に定義されている) のスルホキシド化合物は、とりわけ、酸触媒、例えば硫酸、トリフルオロ酢酸、メタン  
 スルホン酸、イートン試薬の存在下、0 ~ 100 の温度において、溶媒、例えば他の  
 ハロゲン化溶媒中でトルエン、ジクロロメタン、クロロホルム中においてアジ化ナトリウ  
 ム又はトリメチルシリルアジドと反応して、式 I - a 5 (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及び  
 Qは、上記の式 I に定義されており、R<sub>2</sub>は、Hである) の化合物を形成することができる  
 。このような反応は、例えば、Org. Process Res. Dev. 2015, 1  
 9 (8), 1062 - 1067 及び国際公開第 16 / 180695 号に記載されている。

20

## 【0214】

式 I I I (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びQは、上記の式 I に定義されている) のスル  
 ホキシド化合物は、スキーム 1 及び 2 において上記で既に記載した条件下で式 I I (式中  
 、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びQは、上記の式 I に定義されている) のスルフィド化合物の酸化  
 によって調製され得る。

30

## 【0215】

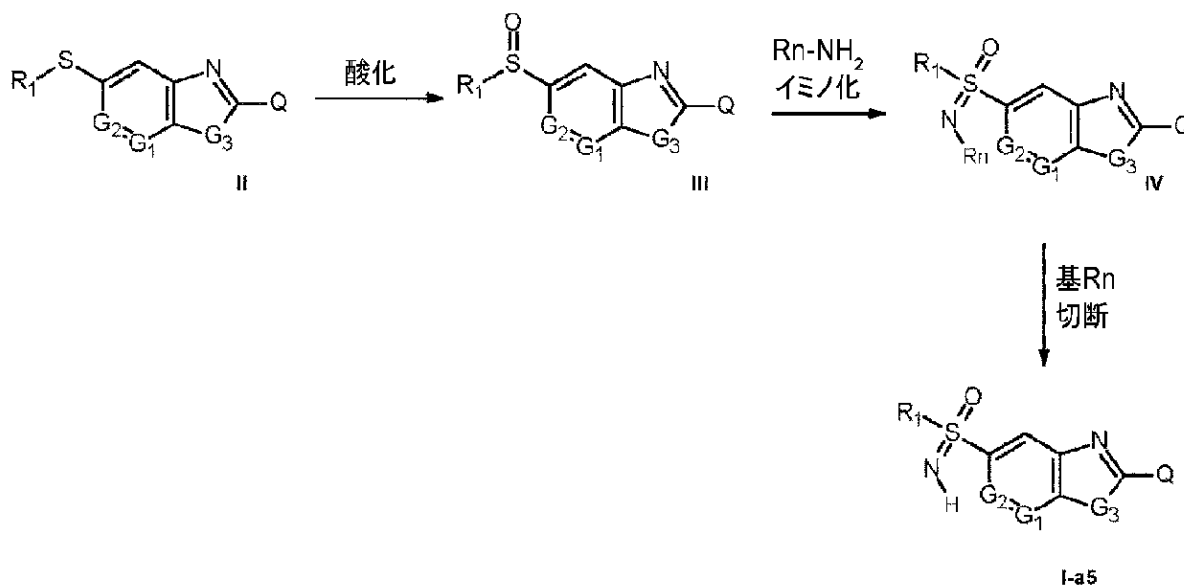
代わりに、式 I - a 5 (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びQは、上記の式 I に定義されて  
 おり、R<sub>2</sub>は、Hである) の化合物は、スルホキシミン N 結合官能基 R<sub>n</sub> の脱保護反応によ  
 り、式 I V (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>及びQは、上記の式 I に定義されており、R<sub>n</sub>は  
 、CN、-C=O (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-C=O (C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル) 又は SO<sub>2</sub>  
 -アリアルである) の化合物から調製することができる (スキーム 4)。

スキーム 4

40

50

## 【化 2 2】



10

例えば、式IV（式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式Iに定義されており、 $R_n$ は、CNである）の化合物は、例えば、O. G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. 2007, 9, 3809 - 3811に記載されているように、溶媒、例えばジクロロメタン中のトリフルオロ酢酸無水物による処理により、式IV（式中、 $R_n$ は、 $C(O)CF_3$ である）の化合物に変換され得る。式IV（式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式Iに定義されており、 $R_n$ は、 $C(O)CF_3$ である）の化合物は、例えば、H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. 2004, 6, 1305 - 1307に記載されているように、極性プロトン性溶媒、例えばメタノール又はエタノール中の塩基、例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウムによる処置によって式I-a5化合物に変換され得る。

20

## 【0216】

式IV（式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式Iに定義されており、 $R_n$ は、CN、 $-C(=O)(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-C(=O)(C_1 \sim C_6 \text{ハロアルキル})$ 又は $SO_2$ -アリールである）の化合物は、式 $R_nNH_2$ （式中、 $R_n$ は、上記で定義されているとおりである）の試薬の存在下において、例えばH. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. 2004, 6, 1305 - 1307; H. Okamura, C. Bolm, Chem. Lett. 2004, 33, 482 - 487; D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacote, M. Malacria, Chem. Eur. J. 2004, 10, 906 - 916; 又はM. Reggelin, C. Zur, Synthesis, 2000, 1 - 64に記載されているように、式III（式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式Iに定義されている）の化合物をイミノ化反応条件に供することによって調製することができる。代替のイミノ化試薬/条件は、 $NaN_3/H_2SO_4$ 、O-メシチレンスルホニル-ヒドロキシルアミン(MSH)又は金属を触媒とする方法 [O. G. Mancheno, C. Bolm, Chem. Eur. J. 2007, 13, 6674 - 6681を参照されたい]、例えば $R_n-N_3/FeCl_2$ 、 $R_n-NH_2/Fe(acac)_3/PhI=O$ 、 $PhI=N-R_n/Fe(OTf)_2$ 、 $PhI=N-R_n/CuOTf$ 、 $PhI=N-R_n/Cu(OTf)_2$ 、 $PhI=N-R_n/CuPF_6$ 、 $PhI(OAc)_2/R_n-NH_2/MgO/Rh_2(OAc)_4$ 又はオキサジリジン（例えば、3-(4-シアノ-フェニル)-オキサジリジン-2-カルボン酸tert-ブチルエステル）として定義され得る。

30

40

## 【0217】

特に関心があるのは、G. Y. Cho, C. Bolm, Tetrahedron Lett.

50

tt. 2005, 46, 8007-8008に記載されているような、 $R_n-NH_2$ 及び酸化剤、例えば  $PhI(OAc)_2 / R_n-NH_2$ ；又は C. Bolm et al., Synthesis 2010, No. 17, 2922-2925に記載されているような、N-ブロモスクシンイミド(NBS) /  $R_n-NH_2$ 及び塩基、例えばナトリウム又はカリウムter-ブトキシドを伴う無金属のイミノ化方法である。例えば、O. G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. 2007, 9, 3809-3811に記載されているように、酸化剤、例えばN-ヨードスクシンイミド(NIS)又はヨウ素も代わりに使用し得る。酸化剤として使用される次亜塩素酸塩の一例、例えば次亜塩素酸ナトリウム  $NaOCl$  又は次亜塩素酸カルシウム  $Ca(OCl)_2$  は、国際公開第2008/10600号に記載された。

10

#### 【0218】

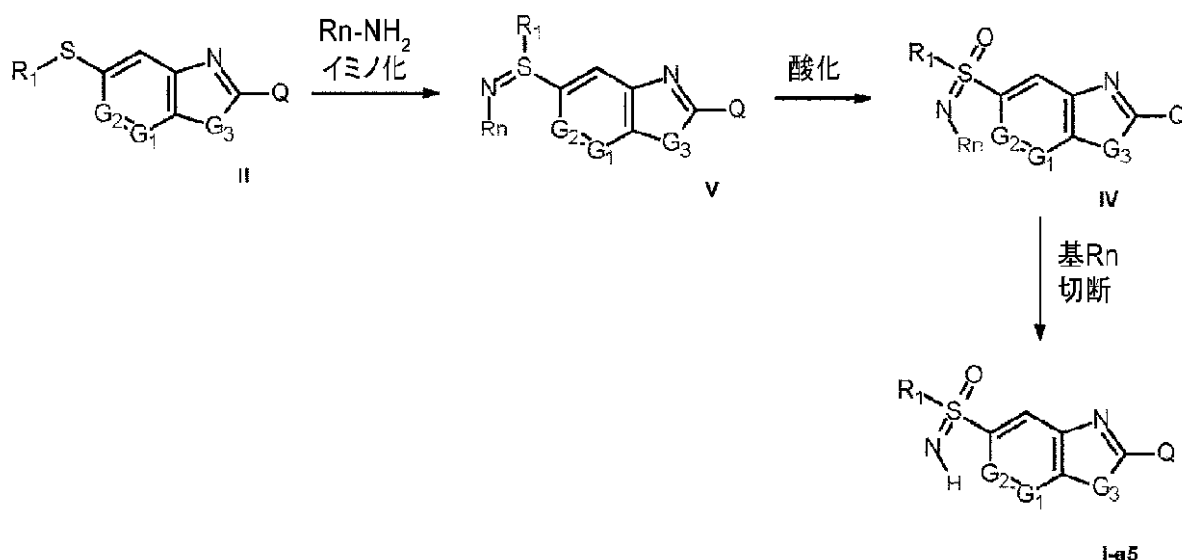
式III(式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及びQは、上記の式Iに定義されている)の化合物は、スキーム3に記載されるように式II(式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及びQは、上記の式Iに定義されている)の化合物から調製することができる。

#### 【0219】

逆に、2つの酸化ノイミノ化工程の順序は、スキーム5に示されるように逆戻りされ得る。

スキーム5

#### 【化23】



20

30

#### 【0220】

したがって、式IVの化合物は、スキーム4における上記のような同じ化学反応を伴うことによる、酸化によって式Vの化合物から調製され得；式Vの化合物は、イミノ化によって式IIの化合物から調製され得る。

#### 【0221】

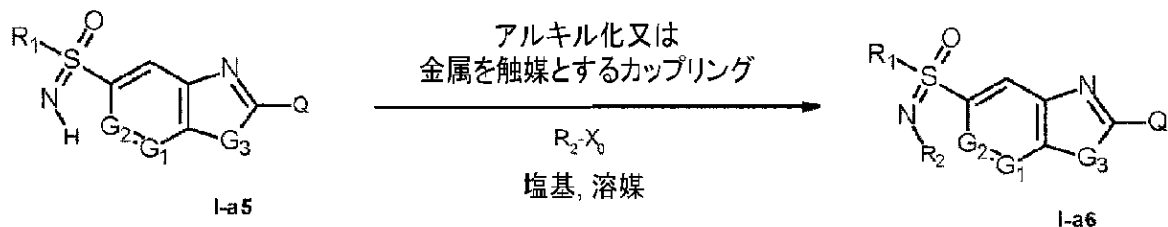
代わりに、式I-a6(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及びQは、上記の式Iに定義されている)の化合物は、式I-a5(式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及びQは、上記の式Iに定義されており、 $R_2$ は、Hである)の化合物と、試薬  $R_2-X_0$ (式中、 $R_2$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、 $X_0$ は、脱離基、例えばハロゲン化物、例えばクロロ、プロモ若しくはヨード又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである)とのアルキル化又は金属を触媒とするカップリングによって調製され得る(スキーム6)。

スキーム6

40

50

## 【化 2 4】



塩基、例えばとりわけ水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸セシウム、トリエチルアミンの存在下、溶媒、例えばとりわけジクロロメタン、ジクロロエタン、DMF、DMSO、エタノール、メタノールの存在下、0 ~ 溶媒の沸点の温度においてアルキル化反応を行うことができる。式 I - a 5 の化合物からの式 I - a 6 の化合物の調製のための金属を触媒とするカップリングは、塩基、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウムの存在下、不活性溶媒、例えばトルエン、ジメチル - ホルムアミド DMF、N - メチルピロリジン NMP、ジメチルスルホキシド DMSO、ジオキサン、テトラヒドロフラン THF などにおいて、任意に触媒、例えば酢酸パラジウム (II)、ビス (ジベンジリデンアセトン) パラジウム (0) (Pd(dba)<sub>2</sub>) 又は トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>、任意にクロロホルム付加体の形態) 又はパラジウムプレ触媒、例えば *tert* - BuBrettPhos Pd G3 [ (2 - ジ - *tert* - ブチルホスフィノ - 3, 6 - ジメトキシ - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフェニル) - 2 - (2' - アミノ - 1, 1' - ビフェニル) ] パラジウム (II) メタンスルホネート又は BrettPhos Pd G3 [ (2 - ジ - シクロヘキシルホスフィノ - 3, 6 - ジメトキシ - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフェニル) - 2 - (2' - アミノ - 1, 1' - ビフェニル) ] パラジウム (II) メタンスルホネートの存在下、任意にリガンド、例えば SPhos、*t* - BuBrettPhos 又はキサントホスの存在下で 60 ~ 120 の温度において任意にマイクロ波照射下で行うことができる。

## 【0 2 2 2】

式 I - a 6 (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式 I に定義されており、 $R_2$ は、 $-C(O)R_3$ であり、 $R_3$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである) の化合物は、任意にアシル化触媒、例えば 4 - ジメチルアミノピリジン (DMAP) の存在下、好ましくは塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン又はピリジンの存在下、不活性溶媒中で 0 ~ 50 の温度において、式  $LG_1 - C(O)R_3$  の試薬又は式  $R_3C(O) - O - C(O)R_3$  の無水試薬 (式中、 $R_3$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 $LG_1$ は、脱離基、例えばハロゲン (特に塩素) である) による処理により、式 I - a 5 (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式 I に定義されている) の化合物から調製され得る。使用する溶媒の例は、エーテル、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert* - ブチルメチルエーテル及び 1, 4 - ジオキサン、芳香族炭化水素、例えばトルエン及びキシレン、ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン及びクロロホルム、ニトリル、例えばアセトニトリル又は極性非プロトン性溶媒、例えば N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチル - 2 - ピロリドン又はジメチルスルホキシドを含む。反応は、過剰な塩基 (その後、溶媒又は賦形剤としても作用し得る) の存在下で行い得る。このような条件は、例えば、国際公開第 15 / 071180 号に記載されている。

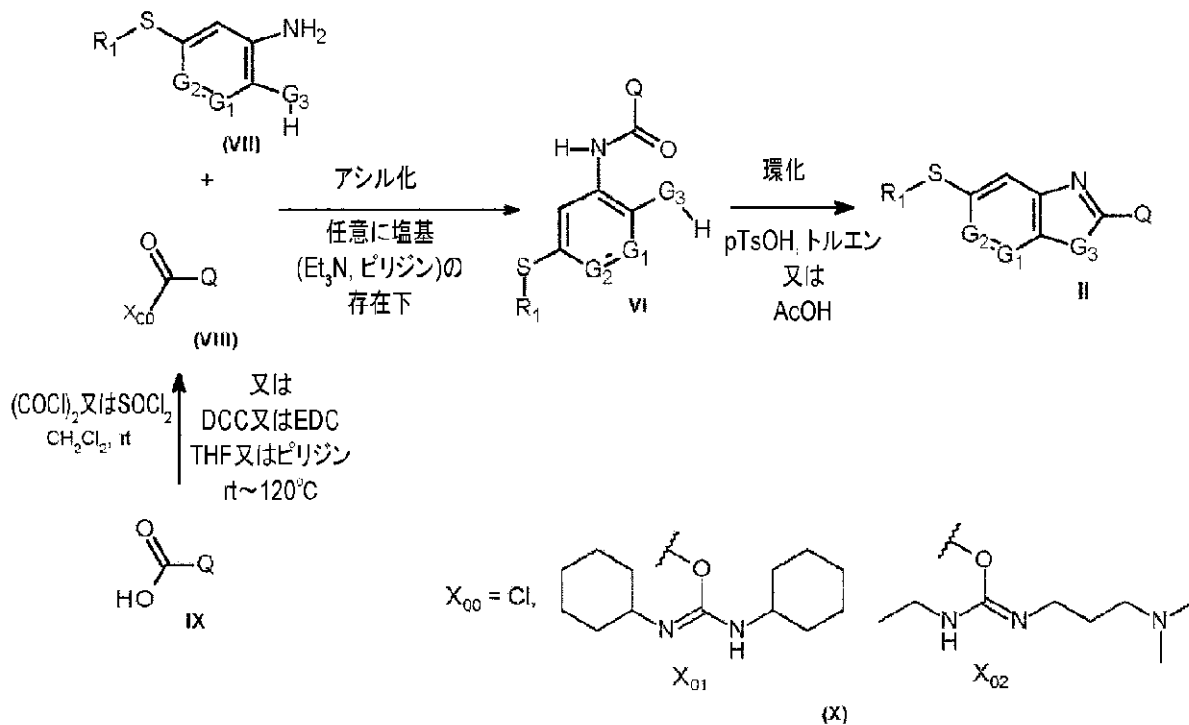
## 【0 2 2 3】

式 II (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式 I に定義されている) の化合物は、例えば、0 ~ 180、好ましくは 20 ~ 150 の温度において、任意にマイクロ波照射下で酢酸又はトリフルオロ酢酸 (好ましくは  $G_3$  が NMe であるとき) 中での加熱により、式 (VI) (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 及び $Q$ は、上記の式 I に定義されている) の化合物を調製することができる。

の化合物を環化することによって調製され得る（スキーム 7）。

スキーム 7

【化 2 5】



10

20

30

40

50

リジンの存在下、不活性溶媒、例えばジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、酢酸エチル又はトルエン中において 0 ~ 50 の温度で式 (VII) (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$  及び  $G_3$  は、式 I に定義されているとおりである) の化合物による活性化種 (VII) の処理を行い、式 (VI) の化合物を形成させる。

【0225】

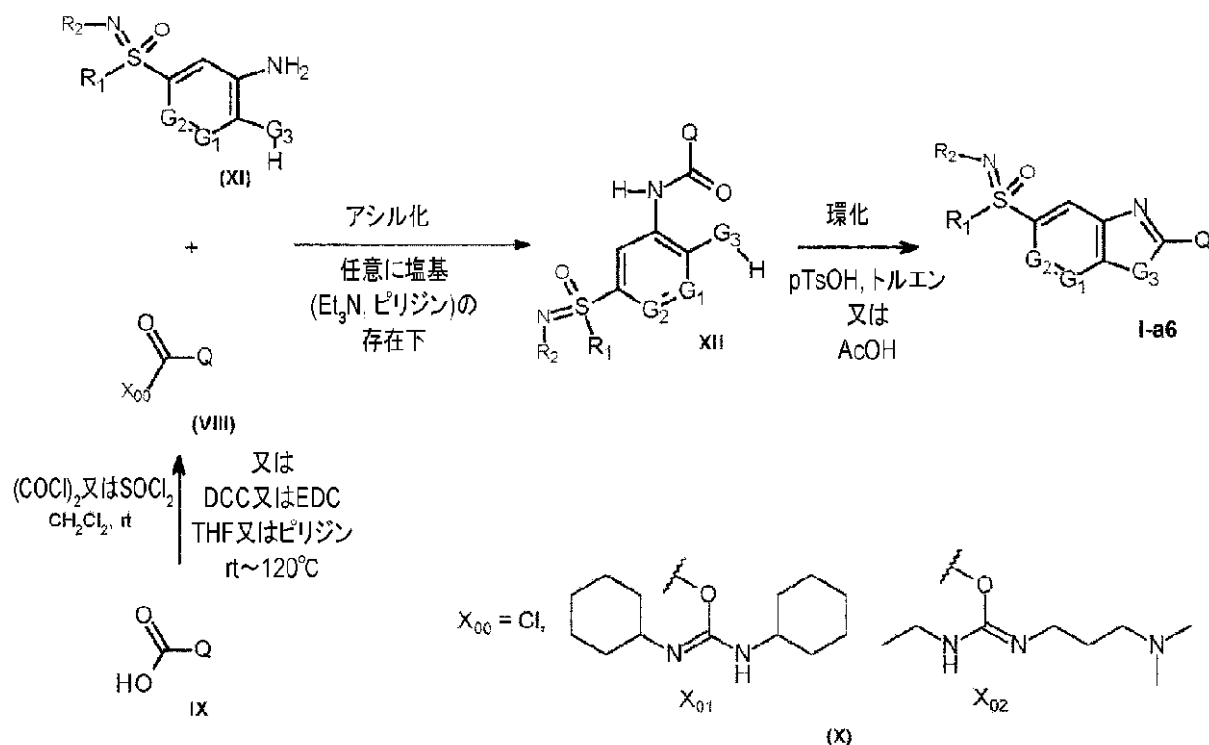
式 (VII) (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$  及び  $G_3$  は、式 I に定義されているとおりである) の化合物は、公知であるか、市販されているか、又は当業者に公知である方法によって調製され得る。

【0226】

代わりに、式 I - a6 (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$  及び  $Q$  は、上記の式 I に定義されているとおりである) の化合物は、スキーム 7 に記載されているような手順と類似のスキーム 8 に従って調製され得る。従前に記述した全ての置換基の定義は、有効なままである。

スキーム 8

【化 26】



【0227】

式 XI (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$  及び  $G_3$  は、上記の式 I に定義されているとおりである) の化合物は、スキーム 9 に従って調製され得る。

スキーム 9

10

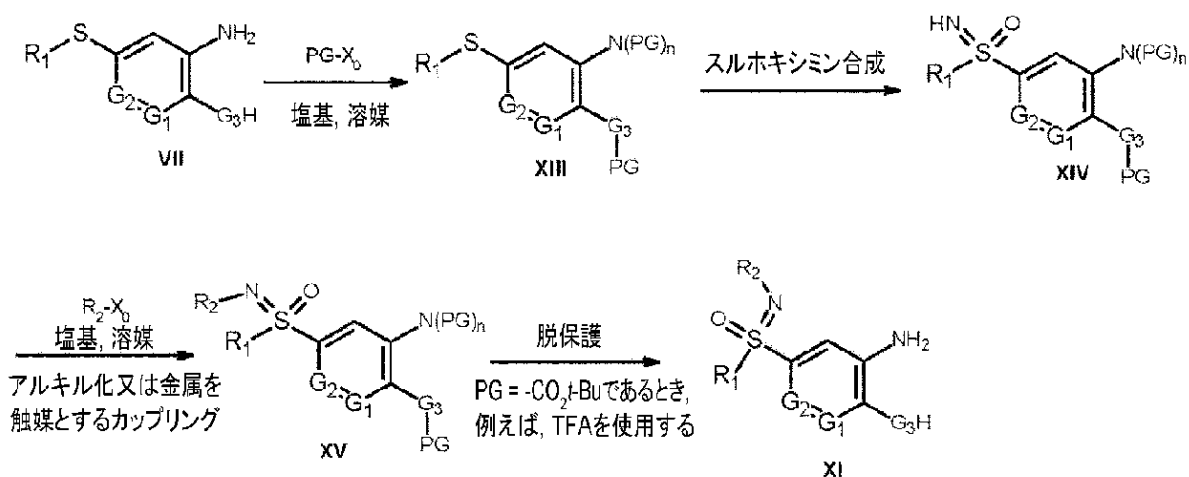
20

30

40

50

## 【化 2 7】



10

20

30

式 VII (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びG<sub>3</sub>は、上記の式 I に定義されているとおりである) の化合物は、PG-X<sub>0</sub> (式中、PG は、ベンジル、パラ-メトキシベンジル、ベンゾイル、アセチル若しくはtert-ブチルオキシカルボニル又は当業者に公知のNH若しくはOH官能基のための同様の他の好適な保護基であり、X<sub>0</sub>は、脱離基、例えばハロゲン化物、例えばクロロ、ブromo若しくはヨード又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) と反応して、式 XIII (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びG<sub>3</sub>は、式 I に定義されているとおりであり、PG は、ベンジル、パラ-メトキシベンジル、ベンゾイル、アセチル若しくはtert-ブチルオキシカルボニル又はNH若しくはOH官能基のための同様の他の好適な保護基であり、n は、1又は2である) の化合物を形成することができる。式 XIII の化合物は、スキーム 3 及び 4 並びにスキーム 6 に記載されている化学反応及び条件を適用することにより、式 XV (式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びG<sub>3</sub>は、式 I に定義されているとおりであり、PG は、ベンジル、パラ-メトキシベンジル、ベンゾイル、アセチル若しくはtert-ブチルオキシカルボニル又はNH若しくはOH官能基のための同様の他の好適な保護基であり、n は、1又は2である) の化合物に変換することができる。式 XV の化合物は、アミノ又はアルコール官能基の脱保護反応により、式 XI (式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びG<sub>3</sub>は、上記の式 I に定義されているとおりである) の化合物に変換することができる。一例として、PG が式 XV の化合物中の -CO<sub>2</sub>t-Bu 基であるとき、これは、酸、例えばトリフルオロ酢酸、塩酸、硫酸を使用して脱保護され、式 XI の化合物を形成することができる。

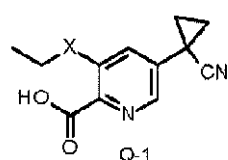
## 【0228】

式 IX (式中、Q は、上記の式 I に定義されているとおりである) のある特定の化合物は市販されている。式 IX (式中、Q は、上記の式 I に定義されているとおりである) の他の化合物は、文献において公知であり (例えば、下記の化合物 Q-1 ~ Q-10)、例えば Q-1 (X は、S である) の合成について国際公開第 18/108726 号において、及び Q-2 の合成について国際公開第 16/046071 号において、及び Q-3 の合成について国際公開第 17/146226 号において記載されている。

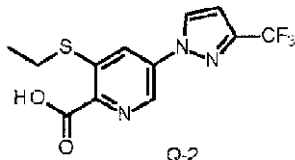
40



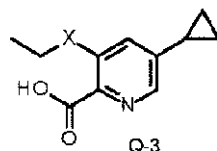
## 【化 2 8】



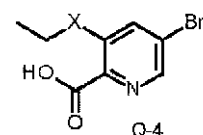
Xは、Sである CAS 2225113-77-7  
Xは、SO<sub>2</sub>である CAS 1879108-82-7



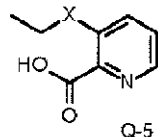
CAS 1889393-25-2



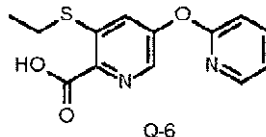
Xは、Sである CAS 1975148-58-3  
Xは、SO<sub>2</sub>である CAS 2173047-84-0



Xは、Sである CAS 1857366-13-2  
Xは、SO<sub>2</sub>である CAS 2098699-89-7



Xは、Sである CAS 14440-97-2  
Xは、SO<sub>2</sub>である CAS 1421953-17-4



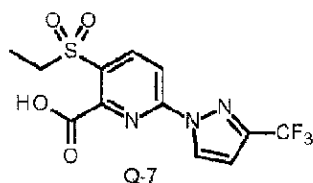
CAS 2448153-73-7

10

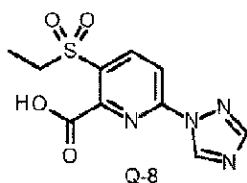
## 【 0 2 2 9】

式 I X のまた他の化合物は、化合物 Q - 1 ~ Q - 10 の合成のために記載されている方法と類似して当業者が調製され得る（「CAS」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する）。

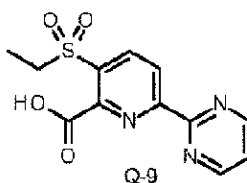
## 【化 2 9】



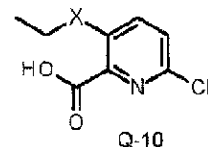
CAS 1970134-16-7



CAS 2016034-28-7



CAS 1970134-19-0



Xは、Sである CAS 2059118-28-2  
Xは、SO<sub>2</sub>である CAS 1848219-28-2

20

## 【 0 2 3 0】

式 I（式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>は、上記の式 I に定義されているとおりであり、Q は、Q b として定義され、A、X、R<sub>4</sub> 及び R<sub>6</sub> は、式 I に定義されているとおりである）の化合物のサブグループは、式 I - Q b の化合物として定義され得る（スキーム 10）。

## 【 0 2 3 1】

スキーム 10 中の特定の状況において、R<sub>6</sub> が、環窒素原子を介して、基 A を含有する環に結合されている任意に置換されていてもよいトリアゾールであるとき、式 I - Q b（式中、X は、S O 又は S O<sub>2</sub> である）の化合物は、溶媒、例えばアルコール（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール又は高沸点直鎖状若しくは分岐状アルコール）、ピリジン又は酢酸中、任意にさらなる塩基、例えば炭酸カリウム K<sub>2</sub>C O<sub>3</sub> 又は炭酸セシウム C s<sub>2</sub>C O<sub>3</sub> の存在下、任意に銅触媒、例えばヨウ化銅（I）の存在下、30 ~ 180 の温度において、任意にマイクロ波照射下、任意に置換されていてもよいトリアゾール R<sub>6</sub> - H（適当な NH 官能基を含有する）（X V I I a a）（式中、R<sub>6</sub> は、N 結合トリアゾリルである）との反応（C - N 結合形成）により、式 X V I b（式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A 及び R<sub>4</sub> は、上記の式 I に定義されているとおりであり、X は、S O 又は S O<sub>2</sub> であり、X<sub>b</sub> は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである）の化合物から調製され得る。

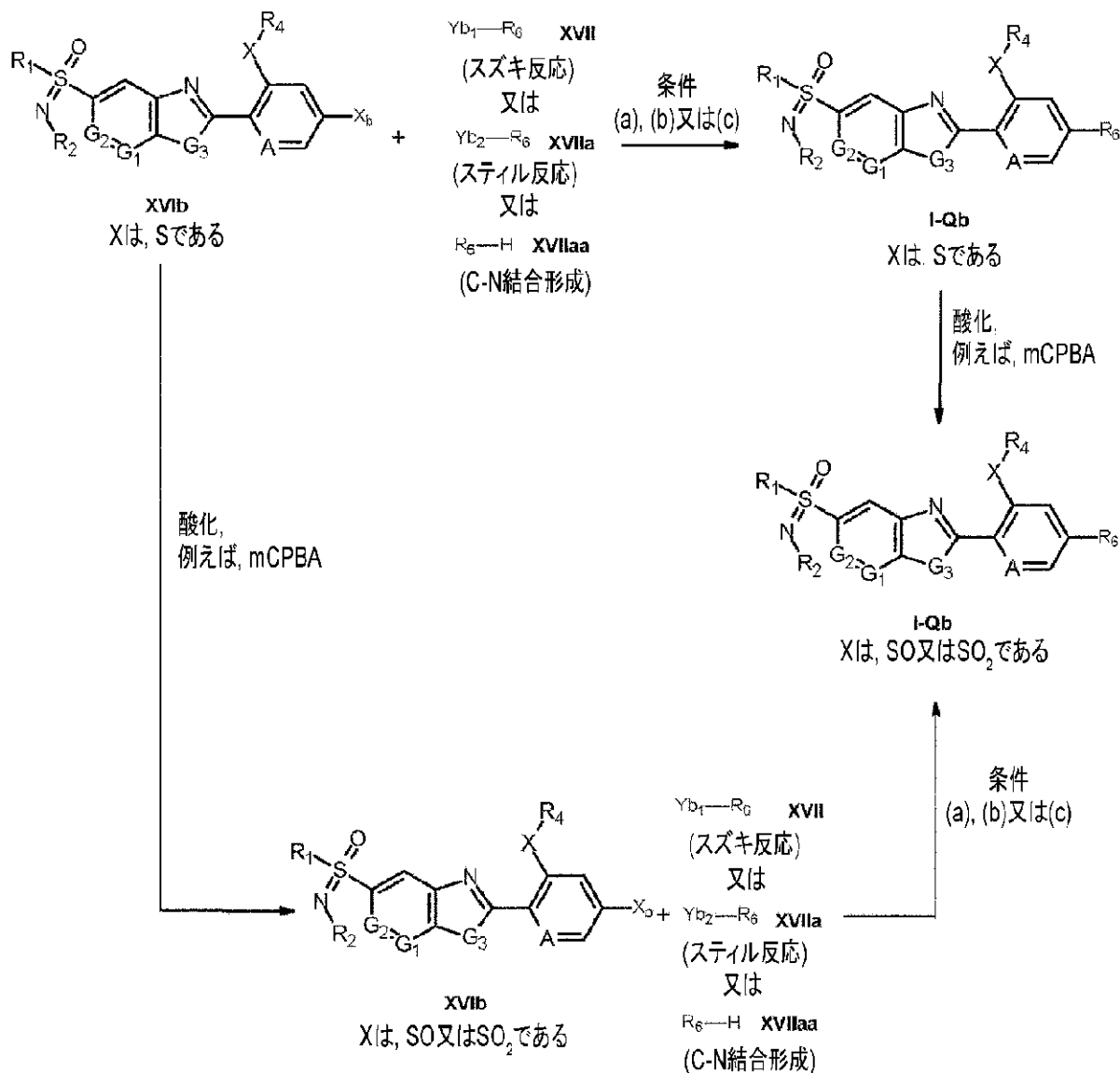
スキーム 10

30

40

50

## 【化 3 0】



10

20

30

## 【0 2 3 2】

(a) スズキ反応：Pd 触媒（例えば、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ ）又は  $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ ）、塩基（例えば、 $\text{Na}_2\text{CO}_3$ ）、溶媒（例えば、1, 2 - ジメトキシエタン / 水）、25 ~ 180 。

(b) スティーブ反応：Pd 触媒（例えば、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ ）又は  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)\text{Cl}_2$ ）、溶媒（例えば、トルエン）、25 ~ 180 。

(c) C - N 結合形成：任意の塩基（例えば、 $\text{K}_2\text{CO}_3$ 又は $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ ）、銅又はパラジウム触媒の任意の存在、任意の添加物（例えば、N, N' - ジメチルエチレンジアミン）、任意のリガンド（例えば、キサントホス）、溶媒（例えば、ジオキサン、ピリジン又はN, N - ジメチルホルムアミドDMF）、25 ~ 180 。

40

## 【0 2 3 3】

代わりに、式 I - Qb（式中、X は、SO 又は  $\text{SO}_2$  である）の化合物は、例えば、式 XVIb（式中、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{G}_1$ 、 $\text{G}_2$ 、 $\text{G}_3$ 、A 及び  $\text{R}_4$  は、上記の式 I に定義されているとおりであり、X は、SO 又は  $\text{SO}_2$  であり、 $\text{Xb}$  は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである）の化合物と、式 (XVII)（式中、 $\text{R}_6$  は、式 I に定義されているとおりであり、 $\text{Yb}_1$  は、ホウ素由来官能基、例えば  $\text{B}(\text{OH})_2$  又は  $\text{B}(\text{OR}_{b1})_2$  であり得、 $\text{R}_{b1}$  は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である得るか、

50

又は2個の基 $OR_{b1}$ は、ホウ素原子と一緒にあって、例えばピナコールボロン酸エステルとしての5員環を形成することができる)の化合物とを反応させることを伴うスズキ反応によって調製され得る。反応は、塩基、例えば炭酸ナトリウム、リン酸三カリウム又はフッ化セシウムの存在下、溶媒又は溶媒混合物、例えばジオキサン、アセトニトリル、N,N-ジメチル-ホルムアミド、1,2-ジメトキシエタン及び水の混合物、又はジオキサン/水の混合物、又はトルエン/水の混合物中、好ましくは不活性雰囲気下において、パラジウム系触媒、例えばテトラキス(トリフェニル-ホスフィン)パラジウム(0)、(1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン)ジクロロ-パラジウム-ジクロロメタン(1:1錯体)又はクロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム(II)(XPhosパラダサイクル)によって触媒され得る。反応温度は、優先的には、室温~反応混合物の沸点の範囲であり得るか、又は反応は、マイクロ波照射下で行われ得る。このようなスズキ反応は、当業者に周知であり、例えばJ. Org. Chem. 576, 1999, 147-168においてレビューされている。

#### 【0234】

代わりに、式I-Qb(式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である)の化合物は、式(XVIIa)(式中、R<sub>6</sub>は、上記で定義されているとおりであり、Y<sub>b2</sub>は、トリアルキルスズ誘導体、好ましくはトリ-n-ブチルスズ又はトリ-メチル-スズである)の化合物及び式XVIIb(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである)の化合物間のスティル反応によって調製され得る。このようなスティル反応は、通常、パラジウム触媒、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)又はビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリドの存在下、不活性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、トルエン又はジオキサン中、任意に添加物、例えばフッ化セシウム又は塩化リチウムの存在下、任意にさらなる触媒、例えばヨウ化銅(I)の存在下で行われる。このようなスティルカップリングも当業者に周知であり、例えばJ. Org. Chem., 2005, 70, 8601-8604, J. Org. Chem., 2009, 74, 5599-5602及びAngew. Chem. Int. Ed., 2004, 43, 1132-1136において記載されている。

#### 【0235】

R<sub>6</sub>が、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であるとき、式I-Qb(式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である)の化合物は、塩基、例えば炭酸カリウムK<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>又は炭酸セシウムCs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>の存在下、任意に銅触媒、例えばヨウ化銅(I)の存在下、添加物、例えばL-プロリン、N,N'-ジメチルシクロヘキサン-1,2-ジアミン又はN,N'-ジメチル-エチレン-ジアミンを伴うか又は伴わず、不活性溶媒、例えばN-メチルピロリドンNMP又はN,N-ジメチルホルムアミドDMF中、30~150の温度において、任意にマイクロ波照射下、複素環R<sub>6</sub>-H(適当なNH官能基を含有する)(XVIIaa)(式中、R<sub>6</sub>は、上記で定義されているとおりである)との反応により、式XVIIb(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである)の化合物から調製され得る。

#### 【0236】

スキーム10中の特定の状況において、R<sub>6</sub>が-N(R<sub>9</sub>)C(=O)R<sub>10</sub>(式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、式Iに定義されているとおりである)であるとき、式I-Qb(式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である)の化合物は、HN(R<sub>9</sub>)COR<sub>10</sub>(式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、式Iに定義されているとおりである)に対する均等物である試薬R<sub>6</sub>-H(XVIIaa)と

の反応（C - N結合形成）により、式XV I b（式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>であり、Xbは、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである）の化合物から調製され得る。このような反応は、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下、トルエン、ジメチルホルムアミドDMF、N - メチルピロリジンNMP、ジメチルスルホキシドDMSO、ジオキサン、テトラヒドロフランTHF等などの不活性溶剤中、任意に例えば酢酸パラジウム（II）、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム（0）（Pd（dba）<sub>2</sub>）若しくはトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（Pd<sub>2</sub>（dba）<sub>3</sub>）、任意にクロロホルム付加物の形態）又は例えばt - BuBrettPhos Pd G3 [（2 - ジ - t - ブチルホスフィノ - 3, 6 - ジメトキシ - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフェニル） - 2 - （2' - アミノ - 1, 1' - ビフェニル）]パラジウム（II）メタンスルホン酸若しくはBrettPhos Pd G3 [（2 - ジ - シクロヘキシルホスフィノ - 3, 6 - ジメトキシ - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフェニル） - 2 - （2' - アミノ - 1, 1' - ビフェニル）]パラジウム（II）メタンスルホン酸などのパラジウムプレ触媒といった触媒の存在下及び任意に例えばSPhos、t - BuBrettPhos又はキサントホスといったリガンドの存在下、60 ~ 120 の温度で任意にマイクロ波の照射下において行われる。

#### 【0237】

スキーム10中の特定の状況において、 $R_6$ がN（ $R_{11}$ ） $R_{12}$ （式中、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ は、式Iに定義されているとおりである）であるとき、式I - Q b（式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である）の化合物は、HN（ $R_{11}$ ） $R_{12}$ 又はその塩（例えば、ハロゲン化水素酸塩、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又は任意の他の均等な塩）（式中、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ は、式Iに定義されているとおりである）に対する均等物である試薬 $R_6 - H$ （XV I I a a）との反応（C - N結合形成）により、式XV I b（式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>であり、Xbは、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである）の化合物から調製され得る。このような反応は、通常、アルコール、アミド、エステル、エーテル、ニトリル及び水などの不活性溶剤、特に好ましくはメタノール、エタノール、2, 2, 2 - トリフルオロエタノール、プロパノール、イソプロパノール、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、水又はこれらの混合物といった不活性溶剤中、0 ~ 150 の温度において、任意にマイクロ波の照射下又はオートクレーブを用いた加圧条件下、任意に銅粉末、ヨウ化銅（I）若しくは硫酸銅（任意に水和物の形態）などの銅触媒又はこれらの混合物の存在下、任意に例えばジアミンリガンド（例えば、N, N' - ジメチルエチレンジアミン若しくはトランス - シクロヘキシルジアミン）、又はジベンジリデンアセトン（dba）、又は1, 10 - フェナントロリンといったリガンドの存在下及び任意にリン酸カリウムなどの塩基の存在下で行われる。

#### 【0238】

試薬HN（ $R_{11}$ ） $R_{12}$ 及びHN（ $R_9$ ）C（=O） $R_{10}$ （式中、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 及び $R_{12}$ は、式Iに定義されているとおりである）は、公知であるか、市販されているか、又は当業者に公知である方法によって調製され得る。

#### 【0239】

スキーム10中の特定の状況において、 $R_6$ が - N = S（O） $R_7R_8$ （式中、 $R_7$ 及び $R_8$ は、式Iに定義されているとおりである）であるとき、式I - Q b（式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である）の化合物は、HN = S（O） $R_7R_8$ （式中、 $R_7$ 及び $R_8$ は、式Iに定義されているとおりである）に対する均等物である試薬 $R_6 - H$ （XV I I a a）との反応（

C - N結合形成)により、式XV Ib (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) 又はアリアルスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) の化合物から調製され得る。このような反応は、例えば、国際公開第18099812号に見出される記載と類似して行い得る。

#### 【0240】

試薬HN = S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub> (式中、 $R_7$ 及び $R_8$ は、式Iに定義されているとおりである) は、公知であるか、市販されているか、又は当業者に公知である方法によって調製され得る。

10

#### 【0241】

式XV Ib (式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である) の化合物への、好適な酸化剤による式XV Ib (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) 又はアリアルスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) の化合物の酸化は、上記で既に記載した条件下で達成され得る。

#### 【0242】

多数の式(XVII)、(XVIIa)及び(XVIIaa)の化合物は、市販されているか、又は当業者が調製することができる。

20

#### 【0243】

代わりに、式I - Qb (式中、Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である) の化合物は、式XV Ib (式中、Xは、S (スルフィド) である) の化合物から、上記のような同じ化学反応を伴うが、工程の順序を変更することにより (すなわちスズキ、スティル又はC - N結合形成を介してXV Ib (Xは、Sである) からI - Qb (Xは、Sである) へのシーケンスを実施し、それに続いて酸化工程を行い、I - Qb (Xは、SO又はSO<sub>2</sub>である) を形成させることにより調製され得る。

#### 【0244】

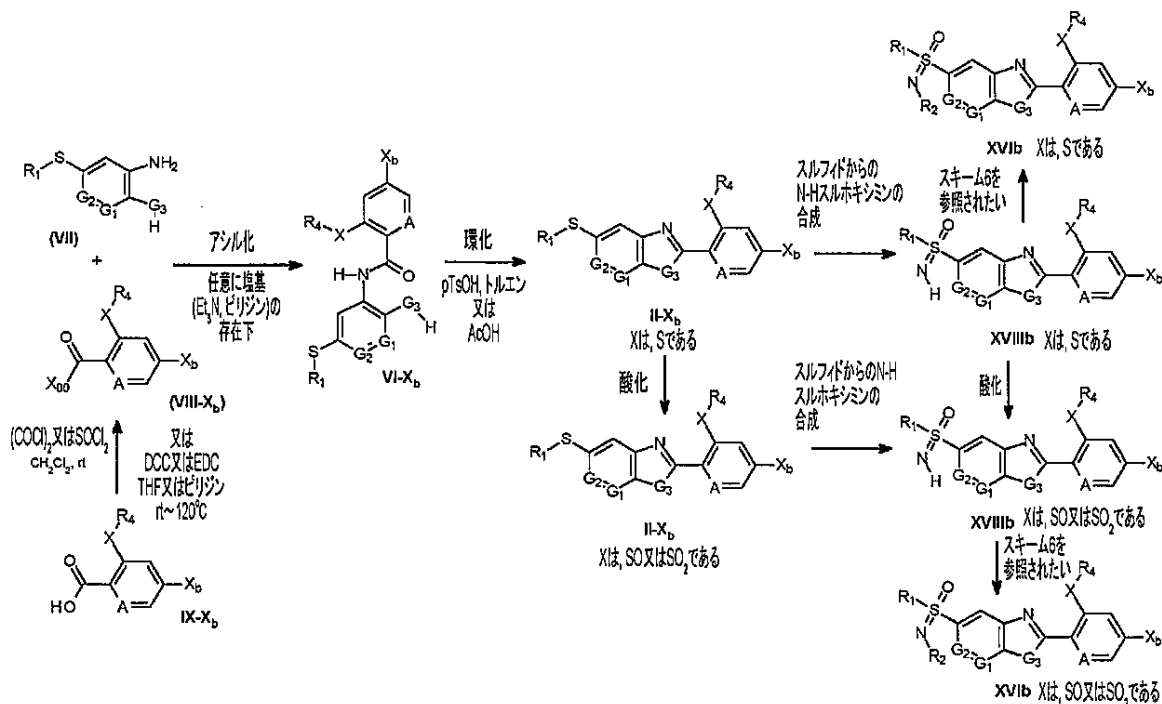
式XV Ib (式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) 又はアリアルスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) の化合物は、スキーム6において既に開示した化学反応に従って、式XVII Ib (式中、 $R_1$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、A及び $R_4$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) 又はアリアルスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) の化合物から調製され得る (スキーム10a)。

30

スキーム10a

40

【化 3 1】



10

20

【 0 2 4 5】

式XVIIb (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) 又はアリールスルホネート若しくはアルキルスルホネート、例えばトリフルオロメタンスルホネートである) の化合物は、スキーム3において既に開示した化学反応及び上記で記載した酸化条件を適用することにより、式II-X<sub>b</sub> (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、上記に定義されているような脱離基である) の化合物から調製され得る。

30

【 0 2 4 6】

式II-X<sub>b</sub> (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、上記に定義されているような脱離基である) の化合物は、スキーム7において既に開示した化学反応に従うことにより、式VI-X<sub>b</sub> (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、上記に定義されているような脱離基である) の中間体を介して、式IX-X<sub>b</sub> (式中、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、上記に定義されているような脱離基である) の化合物及び式VII (式中、R<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びG<sub>3</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりである) の化合物から調製され得る。

40

【 0 2 4 7】

式IX-X<sub>b</sub> (式中、A及びR<sub>4</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Xは、Sであり、X<sub>b</sub>は、脱離基、例えば塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) である) の化合物は、公知であるか (例えば、上記で考察したQ-4を参照されたい) 、市販されているか、又は当業者に公知である方法によって調製され得る。

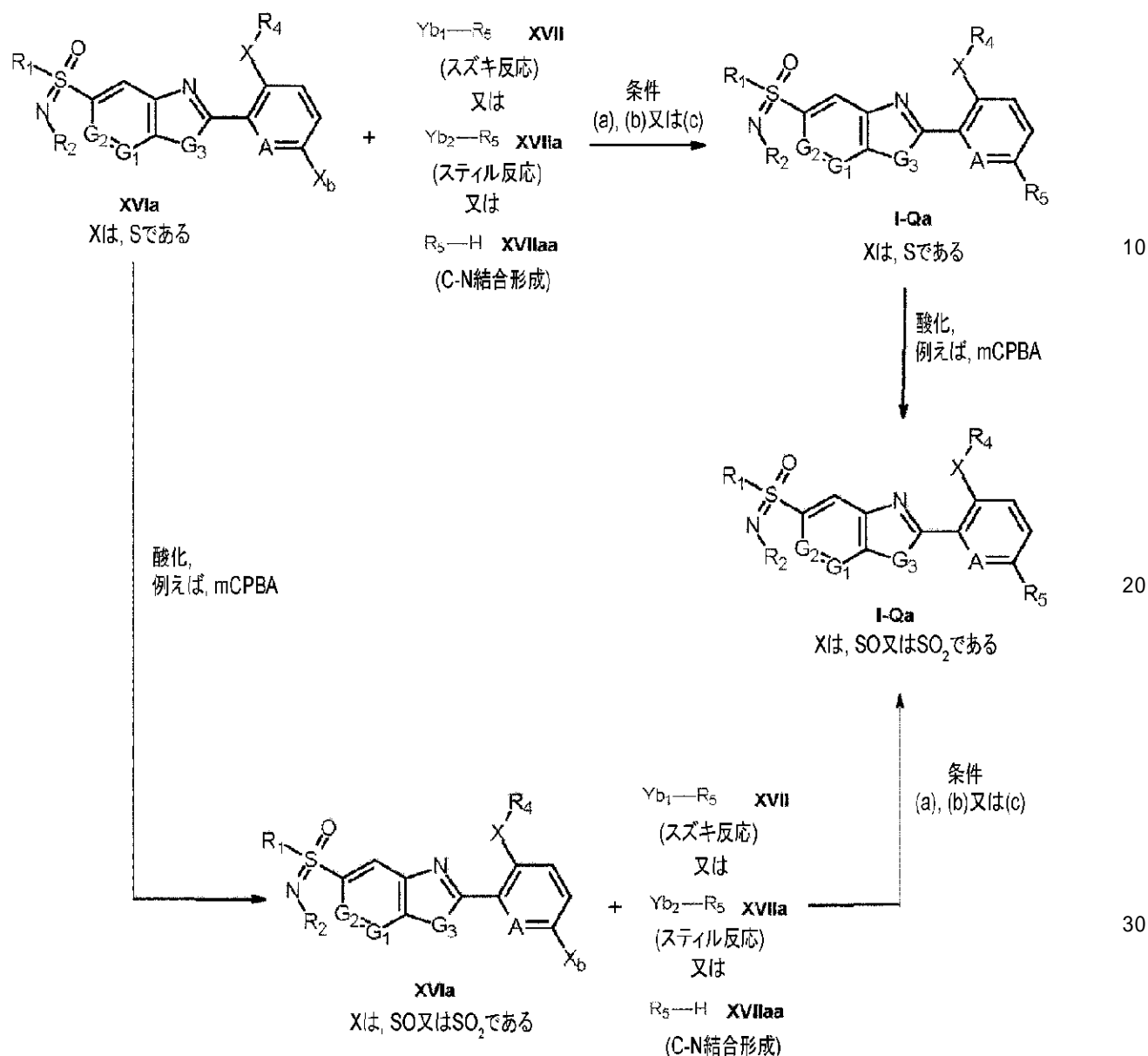
【 0 2 4 8】

式I (式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、G<sub>3</sub>は、上記の式Iに定義されているとおりであり、Qは、Q<sub>a</sub>として定義され、A、X、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、式Iに定義されているとおりである) の化合物のサブグループは、式I-Q<sub>a</sub>の化合物として定義され得る (スキーム11)。

50

## スキーム 11

## 【化32】



## 【0249】

(a) スズキ反応: Pd触媒 (例えば、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>) または Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>、塩基 (例えば、Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>)、溶媒 (例えば、1,2-ジメトキシエタン/水)、25 ~ 180 。

(b) スティーラー反応: Pd触媒 (例えば、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>) または Pd(PPh<sub>3</sub>)Cl<sub>2</sub>、溶媒 (例えば、トルエン)、25 ~ 180 。

(c) C-N結合形成: 任意の塩基 (例えば、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>又はCs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>)、銅又はパラジウム触媒の任意の存在、任意の添加物 (例えば、N,N'-ジメチルエチレンジアミン)、任意のリガンド (例えば、キサントホス)、溶媒 (例えば、ジオキサン、ピリジン又はN,N-ジメチルホルムアミドDMF)、25 ~ 180 。

## 【0250】

式XVIbの化合物から式I-Qbの化合物にアクセスするためのスキーム10において従前に記載した化学反応は、式XVIaの化合物からの式I-Qaの化合物の調製のために類似して適用することができ(スキーム11)、ここで、従前に記述した全ての置換基の定義は、有効なままである。

10

20

30

40

50

## 【0251】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。好適な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属ジアルキルアミド又はアルカリ金属又はアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離又はN - アルキル化飽和又は不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert - ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N - シクロヘキシル - N, N - ジメチルアミン、N, N - ジエチルアニリン、ピリジン、4 - (N, N - ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N - メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ - 7 - エン(DBU)である。

10

## 【0252】

反応剤は、そのまま、すなわち溶媒又は希釈剤を加えずに互いに反応され得る。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶媒又は希釈剤又はこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N - メチルモルホリン又はN, N - ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒又は希釈剤としての役割も果たし得る。

20

## 【0253】

反応は、約 - 80 ~ 約 + 140、好ましくは約 - 30 ~ 約 + 100 の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約 + 80 の範囲で行われるのが有利である。

## 【0254】

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

30

## 【0255】

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基が同じ反応工程において本発明に係る他の置換基で置換され得る。

## 【0256】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩が好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩が好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

## 【0257】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理により、遊離化合物Iの酸付加塩に、且つ例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理により、塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

40

## 【0258】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中において、例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転化され得る。

## 【0259】

手順又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が遊離形態又は塩の形態

50



で得られる。

【0260】

式Ⅰの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態において、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて、且つ／又は分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び／若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態において又は鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物若しくはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能なすべての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

10

【0261】

式Ⅰの化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、いずれの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態において、例えば分別結晶化、蒸留及び／又はクロマトグラフィにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【0262】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィ、例えば好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィ（HPLC）により、例えば1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により又はジアステレオマー塩への転化により、例えば塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばショウノウ酸、酒石酸若しくはリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を、例えば異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることによって光学対掌体に分解され得る。

20

【0263】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従って、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法によっても、例えば立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによっても得られる。

30

【0264】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式Ⅰの化合物を好適な酸化剤、例えばH<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32(12), 2561-73, 1989又は国際公開第2000/15615号といった文献から公知である。

【0265】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体若しくはジアステレオマー又は異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物又はジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

40

【0266】

式Ⅰの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態、必要に応じて水和物の形態で得ることもでき、且つ／又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

【0267】

以下の表A-1～A-96、表C-1～C-96、表E-1～E-96、表F-1～F-96、表G-1～G-96及び表H-1～H-96に係る化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下の例は、本発明を例示することを意図したものであり、好ましい式Ⅰの化合物を示す。

50

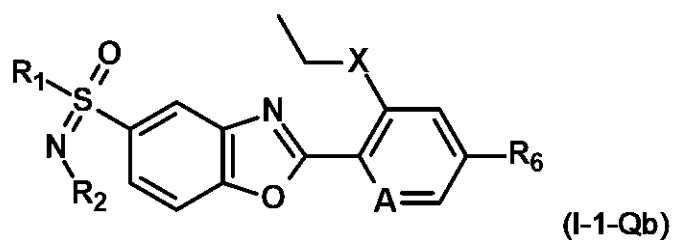
【 0 2 6 8 】

以下の表 A - 1 ~ A - 9 6 は、本発明の特定の化合物を示す。

【 0 2 6 9 】

「 c P r 」は、シクロプロピルを表す。

【 化 3 3 】



10

【 0 2 7 0 】

表 A - 1 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 A - 1 . 0 0 1 ~ A - 1 . 0 1 4 を 提 供 し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 7 1 】

20

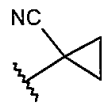
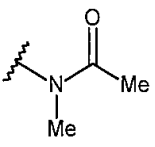
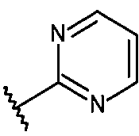
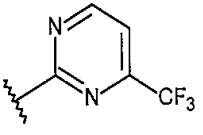
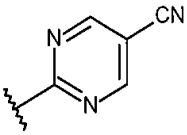
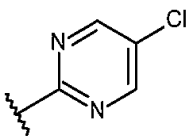
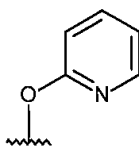
30


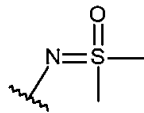
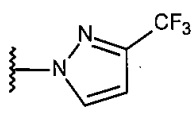
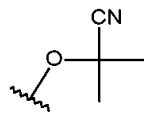
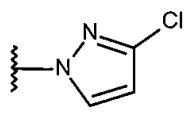
40

50

## 【表 1】

表 B: R<sub>6</sub> の置換基定義

インデックス	R <sub>6</sub>
1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
8	

インデックス	R <sub>6</sub>
9	
10	
11	
12	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Me
13	
14	

10

20

30

40

## 【0272】

表 A - 2 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 2 . 001 ~ A - 2 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【0273】

表 A - 3 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 3 . 001 ~ A - 3 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【0274】

50

表 A - 4 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 4 . 0 0 1 ~ A - 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 7 5 】

表 A - 5 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 5 . 0 0 1 ~ A - 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 7 6 】

表 A - 6 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 6 . 0 0 1 ~ A - 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

【 0 2 7 7 】

表 A - 7 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 7 . 0 0 1 ~ A - 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 7 8 】

表 A - 8 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 8 . 0 0 1 ~ A - 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 7 9 】

20

表 A - 9 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 9 . 0 0 1 ~ A - 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 0 】

表 A - 1 0 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 0 . 0 0 1 ~ A - 1 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 1 】

表 A - 1 1 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 1 . 0 0 1 ~ A - 1 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

【 0 2 8 2 】

表 A - 1 2 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 2 . 0 0 1 ~ A - 1 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 3 】

表 A - 1 3 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 3 . 0 0 1 ~ A - 1 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 4 】

40

表 A - 1 4 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 4 . 0 0 1 ~ A - 1 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 5 】

表 A - 1 5 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 5 . 0 0 1 ~ A - 1 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【 0 2 8 6 】

表 A - 1 6 は、式 I - 1 - Q b の 1 4 種の化合物 A - 1 6 . 0 0 1 ~ A - 1 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、

50

Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0287】

表A-17は、式I-1-Qbの14種の化合物A-17.001~A-17.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0288】

表A-18は、式I-1-Qbの14種の化合物A-18.001~A-18.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0289】

表A-19は、式I-1-Qbの14種の化合物A-19.001~A-19.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0290】

表A-20は、式I-1-Qbの14種の化合物A-20.001~A-20.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0291】

表A-21は、式I-1-Qbの14種の化合物A-21.001~A-21.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0292】

表A-22は、式I-1-Qbの14種の化合物A-22.001~A-22.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0293】

表A-23は、式I-1-Qbの14種の化合物A-23.001~A-23.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0294】

表A-24は、式I-1-Qbの14種の化合物A-24.001~A-24.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0295】

表A-25は、式I-1-Qbの14種の化合物A-25.001~A-25.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0296】

表A-26は、式I-1-Qbの14種の化合物A-26.001~A-26.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0297】

表A-27は、式I-1-Qbの14種の化合物A-27.001~A-27.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0298】

表A-28は、式I-1-Qbの14種の化合物A-28.001~A-28.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0299】

10

20

30

40

50

表 A - 29 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 29 . 001 ~ A - 29 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0300】

表 A - 30 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 30 . 001 ~ A - 30 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0301】

表 A - 31 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 31 . 001 ~ A - 31 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、S であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

【0302】

表 A - 32 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 32 . 001 ~ A - 32 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SO であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0303】

表 A - 33 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 33 . 001 ~ A - 33 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0304】

20

表 A - 34 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 34 . 001 ~ A - 34 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、S であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0305】

表 A - 35 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 35 . 001 ~ A - 35 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SO であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0306】

表 A - 36 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 36 . 001 ~ A - 36 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

【0307】

表 A - 37 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 37 . 001 ~ A - 37 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、S であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0308】

表 A - 38 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 38 . 001 ~ A - 38 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0309】

40

表 A - 39 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 39 . 001 ~ A - 39 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0310】

表 A - 40 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 40 . 001 ~ A - 40 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、S であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0311】

表 A - 41 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 41 . 001 ~ A - 41 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、

50

Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0312】

表A-42は、式I-1-Qbの14種の化合物A-42.001~A-42.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0313】

表A-43は、式I-1-Qbの14種の化合物A-43.001~A-43.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0314】

表A-44は、式I-1-Qbの14種の化合物A-44.001~A-44.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0315】

表A-45は、式I-1-Qbの14種の化合物A-45.001~A-45.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0316】

表A-46は、式I-1-Qbの14種の化合物A-46.001~A-46.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0317】

表A-47は、式I-1-Qbの14種の化合物A-47.001~A-47.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0318】

表A-48は、式I-1-Qbの14種の化合物A-48.001~A-48.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0319】

表A-49は、式I-1-Qbの14種の化合物A-49.001~A-49.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0320】

表A-50は、式I-1-Qbの14種の化合物A-50.001~A-50.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0321】

表A-51は、式I-1-Qbの14種の化合物A-51.001~A-51.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0322】

表A-52は、式I-1-Qbの14種の化合物A-52.001~A-52.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0323】

表A-53は、式I-1-Qbの14種の化合物A-53.001~A-53.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0324】

10

20

30

40

50

表 A - 54 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 54 . 001 ~ A - 54 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0325】

表 A - 55 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 55 . 001 ~ A - 55 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0326】

表 A - 56 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 56 . 001 ~ A - 56 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

【0327】

表 A - 57 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 57 . 001 ~ A - 57 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0328】

表 A - 58 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 58 . 001 ~ A - 58 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0329】

20

表 A - 59 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 59 . 001 ~ A - 59 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0330】

表 A - 60 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 60 . 001 ~ A - 60 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0331】

表 A - 61 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 61 . 001 ~ A - 61 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

【0332】

表 A - 62 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 62 . 001 ~ A - 62 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0333】

表 A - 63 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 63 . 001 ~ A - 63 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0334】

40

表 A - 64 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 64 . 001 ~ A - 64 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0335】

表 A - 65 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 65 . 001 ~ A - 65 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0336】

表 A - 66 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 66 . 001 ~ A - 66 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、

50



Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0337】

表A-67は、式I-1-Qbの14種の化合物A-67.001~A-67.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0338】

表A-68は、式I-1-Qbの14種の化合物A-68.001~A-68.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0339】

表A-69は、式I-1-Qbの14種の化合物A-69.001~A-69.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0340】

表A-70は、式I-1-Qbの14種の化合物A-70.001~A-70.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0341】

表A-71は、式I-1-Qbの14種の化合物A-71.001~A-71.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0342】

表A-72は、式I-1-Qbの14種の化合物A-72.001~A-72.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0343】

表A-73は、式I-1-Qbの14種の化合物A-73.001~A-73.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0344】

表A-74は、式I-1-Qbの14種の化合物A-74.001~A-74.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0345】

表A-75は、式I-1-Qbの14種の化合物A-75.001~A-75.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0346】

表A-76は、式I-1-Qbの14種の化合物A-76.001~A-76.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0347】

表A-77は、式I-1-Qbの14種の化合物A-77.001~A-77.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0348】

表A-78は、式I-1-Qbの14種の化合物A-78.001~A-78.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0349】

10

20

30

40

50

表 A - 79 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 79 . 001 ~ A - 79 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0350】

表 A - 80 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 80 . 001 ~ A - 80 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0351】

表 A - 81 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 81 . 001 ~ A - 81 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

【0352】

表 A - 82 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 82 . 001 ~ A - 82 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0353】

表 A - 83 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 83 . 001 ~ A - 83 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0354】

20

表 A - 84 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 84 . 001 ~ A - 84 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0355】

表 A - 85 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 85 . 001 ~ A - 85 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0356】

表 A - 86 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 86 . 001 ~ A - 86 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

【0357】

表 A - 87 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 87 . 001 ~ A - 87 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0358】

表 A - 88 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 88 . 001 ~ A - 88 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0359】

40

表 A - 89 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 89 . 001 ~ A - 89 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0360】

表 A - 90 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 90 . 001 ~ A - 90 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

【0361】

表 A - 91 は、式 I - 1 - Q b の 14 種の化合物 A - 91 . 001 ~ A - 91 . 014 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、

50

Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0362】

表A-92は、式I-1-Qbの14種の化合物A-92.001~A-92.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0363】

表A-93は、式I-1-Qbの14種の化合物A-93.001~A-93.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0364】

表A-94は、式I-1-Qbの14種の化合物A-94.001~A-94.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0365】

表A-95は、式I-1-Qbの14種の化合物A-95.001~A-95.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

【0366】

表A-96は、式I-1-Qbの14種の化合物A-96.001~A-96.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

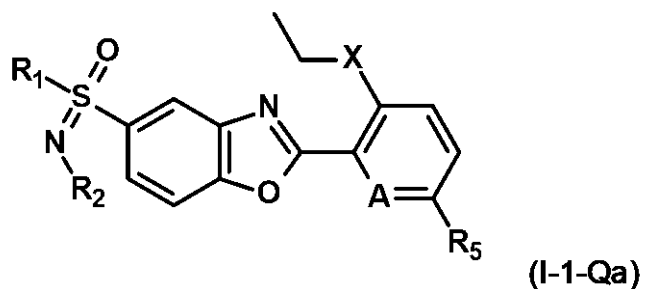
【0367】

下記の表C-1~C-96は、本発明の特定の化合物をさらに例示する。

【0368】

「cPr」は、シクロプロピルを表す。

【化34】



【0369】

表C-1は、式I-1-Qaの7種の化合物C-1.001~C-1.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0370】

10

20

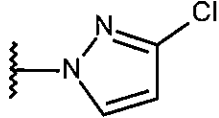
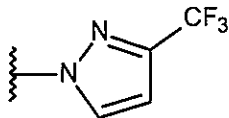
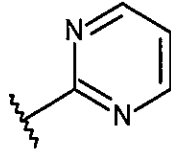
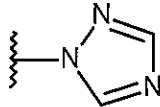
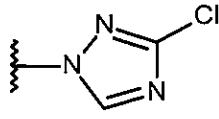
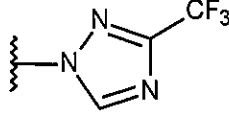
30

40

50

【表 2】

表 D: R<sub>5</sub> の置換基定義

インデックス	R <sub>5</sub>
1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	H

10

20

30

40

【0371】

表C - 2は、式I - 1 - Q aの7種の化合物C - 2 . 001 ~ C - 2 . 007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0372】

表C - 3は、式I - 1 - Q aの7種の化合物C - 3 . 001 ~ C - 3 . 007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0373】

表C - 4は、式I - 1 - Q aの7種の化合物C - 4 . 001 ~ C - 4 . 007を提供し

50

、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0374】

表C-5は、式I-1-Qaの7種の化合物C-5.001~C-5.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0375】

表C-6は、式I-1-Qaの7種の化合物C-6.001~C-6.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0376】

表C-7は、式I-1-Qaの7種の化合物C-7.001~C-7.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0377】

表C-8は、式I-1-Qaの7種の化合物C-8.001~C-8.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0378】

表C-9は、式I-1-Qaの7種の化合物C-9.001~C-9.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0379】

表C-10は、式I-1-Qaの7種の化合物C-10.001~C-10.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0380】

表C-11は、式I-1-Qaの7種の化合物C-11.001~C-11.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0381】

表C-12は、式I-1-Qaの7種の化合物C-12.001~C-12.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0382】

表C-13は、式I-1-Qaの7種の化合物C-13.001~C-13.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0383】

表C-14は、式I-1-Qaの7種の化合物C-14.001~C-14.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0384】

表C-15は、式I-1-Qaの7種の化合物C-15.001~C-15.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0385】

表C-16は、式I-1-Qaの7種の化合物C-16.001~C-16.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【0386】

表C-17は、式I-1-Qaの7種の化合物C-17.001~C-17.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0387】

表C-18は、式I-1-Qaの7種の化合物C-18.001~C-18.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0388】

表C-19は、式I-1-Qaの7種の化合物C-19.001~C-19.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

## 【0389】

表C-20は、式I-1-Qaの7種の化合物C-20.001~C-20.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0390】

表C-21は、式I-1-Qaの7種の化合物C-21.001~C-21.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

## 【0391】

表C-22は、式I-1-Qaの7種の化合物C-22.001~C-22.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0392】

表C-23は、式I-1-Qaの7種の化合物C-23.001~C-23.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0393】

表C-24は、式I-1-Qaの7種の化合物C-24.001~C-24.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

## 【0394】

表C-25は、式I-1-Qaの7種の化合物C-25.001~C-25.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0395】

表C-26は、式I-1-Qaの7種の化合物C-26.001~C-26.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

## 【0396】

表C-27は、式I-1-Qaの7種の化合物C-27.001~C-27.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0397】

表C-28は、式I-1-Qaの7種の化合物C-28.001~C-28.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0398】

表C-29は、式I-1-Qaの7種の化合物C-29.001~C-29.007を

50

提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0399】

表C-30は、式I-1-Qaの7種の化合物C-30.001~C-30.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0400】

表C-31は、式I-1-Qaの7種の化合物C-31.001~C-31.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CHF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0401】

表C-32は、式I-1-Qaの7種の化合物C-32.001~C-32.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0402】

表C-33は、式I-1-Qaの7種の化合物C-33.001~C-33.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0403】

表C-34は、式I-1-Qaの7種の化合物C-34.001~C-34.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0404】

表C-35は、式I-1-Qaの7種の化合物C-35.001~C-35.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0405】

表C-36は、式I-1-Qaの7種の化合物C-36.001~C-36.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0406】

表C-37は、式I-1-Qaの7種の化合物C-37.001~C-37.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0407】

表C-38は、式I-1-Qaの7種の化合物C-38.001~C-38.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0408】

表C-39は、式I-1-Qaの7種の化合物C-39.001~C-39.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0409】

表C-40は、式I-1-Qaの7種の化合物C-40.001~C-40.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0410】

表C-41は、式I-1-Qaの7種の化合物C-41.001~C-41.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 4 1 1 】

表 C - 4 2 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 2 . 0 0 1 ~ C - 4 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C N であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 1 2 】

表 C - 4 3 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 3 . 0 0 1 ~ C - 4 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 1 3 】

表 C - 4 4 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 4 . 0 0 1 ~ C - 4 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

10

## 【 0 4 1 4 】

表 C - 4 5 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 5 . 0 0 1 ~ C - 4 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 1 5 】

表 C - 4 6 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 6 . 0 0 1 ~ C - 4 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

20

## 【 0 4 1 6 】

表 C - 4 7 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 7 . 0 0 1 ~ C - 4 7 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 1 7 】

表 C - 4 8 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 8 . 0 0 1 ~ C - 4 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 1 8 】

表 C - 4 9 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 4 9 . 0 0 1 ~ C - 4 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、H であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

30

## 【 0 4 1 9 】

表 C - 5 0 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 5 0 . 0 0 1 ~ C - 5 0 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C N であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 2 0 】

表 C - 5 1 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 5 1 . 0 0 1 ~ C - 5 1 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

40

## 【 0 4 2 1 】

表 C - 5 2 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 5 2 . 0 0 1 ~ C - 5 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 2 2 】

表 C - 5 3 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 5 3 . 0 0 1 ~ C - 5 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 2 3 】

表 C - 5 4 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 5 4 . 0 0 1 ~ C - 5 4 . 0 0 7 を

50



提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0424】

表C-55は、式I-1-Qaの7種の化合物C-55.001~C-55.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0425】

表C-56は、式I-1-Qaの7種の化合物C-56.001~C-56.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0426】

表C-57は、式I-1-Qaの7種の化合物C-57.001~C-57.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0427】

表C-58は、式I-1-Qaの7種の化合物C-58.001~C-58.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0428】

表C-59は、式I-1-Qaの7種の化合物C-59.001~C-59.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0429】

表C-60は、式I-1-Qaの7種の化合物C-60.001~C-60.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0430】

表C-61は、式I-1-Qaの7種の化合物C-61.001~C-61.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0431】

表C-62は、式I-1-Qaの7種の化合物C-62.001~C-62.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0432】

表C-63は、式I-1-Qaの7種の化合物C-63.001~C-63.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0433】

表C-64は、式I-1-Qaの7種の化合物C-64.001~C-64.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0434】

表C-65は、式I-1-Qaの7種の化合物C-65.001~C-65.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0435】

表C-66は、式I-1-Qaの7種の化合物C-66.001~C-66.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 4 3 6 】

表 C - 6 7 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 6 7 . 0 0 1 ~ C - 6 7 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 3 7 】

表 C - 6 8 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 6 8 . 0 0 1 ~ C - 6 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 3 8 】

表 C - 6 9 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 6 9 . 0 0 1 ~ C - 6 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

10

## 【 0 4 3 9 】

表 C - 7 0 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 0 . 0 0 1 ~ C - 7 0 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 0 】

表 C - 7 1 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 1 . 0 0 1 ~ C - 7 1 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

20

## 【 0 4 4 1 】

表 C - 7 2 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 2 . 0 0 1 ~ C - 7 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 2 】

表 C - 7 3 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 3 . 0 0 1 ~ C - 7 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、H であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 3 】

表 C - 7 4 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 4 . 0 0 1 ~ C - 7 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C N であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

30

## 【 0 4 4 4 】

表 C - 7 5 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 5 . 0 0 1 ~ C - 7 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 5 】

表 C - 7 6 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 6 . 0 0 1 ~ C - 7 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

40

## 【 0 4 4 6 】

表 C - 7 7 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 7 . 0 0 1 ~ C - 7 7 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 7 】

表 C - 7 8 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 8 . 0 0 1 ~ C - 7 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 4 8 】

表 C - 7 9 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 7 9 . 0 0 1 ~ C - 7 9 . 0 0 7 を

50

提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0449】

表C-80は、式I-1-Qaの7種の化合物C-80.001~C-80.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0450】

表C-81は、式I-1-Qaの7種の化合物C-81.001~C-81.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0451】

表C-82は、式I-1-Qaの7種の化合物C-82.001~C-82.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0452】

表C-83は、式I-1-Qaの7種の化合物C-83.001~C-83.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0453】

表C-84は、式I-1-Qaの7種の化合物C-84.001~C-84.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0454】

表C-85は、式I-1-Qaの7種の化合物C-85.001~C-85.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0455】

表C-86は、式I-1-Qaの7種の化合物C-86.001~C-86.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0456】

表C-87は、式I-1-Qaの7種の化合物C-87.001~C-87.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0457】

表C-88は、式I-1-Qaの7種の化合物C-88.001~C-88.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0458】

表C-89は、式I-1-Qaの7種の化合物C-89.001~C-89.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0459】

表C-90は、式I-1-Qaの7種の化合物C-90.001~C-90.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0460】

表C-91は、式I-1-Qaの7種の化合物C-91.001~C-91.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 4 6 1 】

表 C - 9 2 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 9 2 . 0 0 1 ~ C - 9 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 6 2 】

表 C - 9 3 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 9 3 . 0 0 1 ~ C - 9 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 6 3 】

表 C - 9 4 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 9 4 . 0 0 1 ~ C - 9 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

10

## 【 0 4 6 4 】

表 C - 9 5 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 9 5 . 0 0 1 ~ C - 9 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 4 6 5 】

表 C - 9 6 は、式 I - 1 - Q a の 7 種の化合物 C - 9 6 . 0 0 1 ~ C - 9 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

20

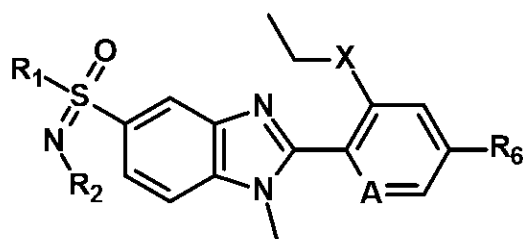
## 【 0 4 6 6 】

下記の表 E - 1 ~ E - 9 6 は、本発明の特定の化合物をさらに例示する。

## 【 0 4 6 7 】

「c P r」は、シクロプロピルを表す。

## 【 化 3 5 】



(I-2-Qb)

30

## 【 0 4 6 8 】

表 E - 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 . 0 0 1 ~ E - 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S であり、R<sub>6</sub> は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 6 9 】

表 E - 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 2 . 0 0 1 ~ E - 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S O であり、R<sub>6</sub> は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 4 7 0 】

表 E - 3 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 . 0 0 1 ~ E - 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>6</sub> は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 1 】

表 E - 4 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 4 . 0 0 1 ~ E - 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>6</sub> は、表 B に定義されているとおりである。

50

## 【 0 4 7 2 】

表 E - 5 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 5 . 0 0 1 ~ E - 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、H であり、A は、CH であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 3 】

表 E - 6 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 6 . 0 0 1 ~ E - 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、H であり、A は、CH であり、X は、SO<sub>2</sub> であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 4 】

表 E - 7 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 7 . 0 0 1 ~ E - 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、N であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 4 7 5 】

表 E - 8 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 . 0 0 1 ~ E - 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、N であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 6 】

表 E - 9 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 9 . 0 0 1 ~ E - 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、N であり、X は、SO<sub>2</sub> であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 4 7 7 】

表 E - 1 0 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 0 . 0 0 1 ~ E - 1 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、CH であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 8 】

表 E - 1 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 1 . 0 0 1 ~ E - 1 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、CH であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 7 9 】

表 E - 1 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 2 . 0 0 1 ~ E - 1 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、CN であり、A は、CH であり、X は、SO<sub>2</sub> であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 4 8 0 】

表 E - 1 3 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 3 . 0 0 1 ~ E - 1 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、COCH<sub>3</sub> であり、A は、N であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 8 1 】

表 E - 1 4 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 4 . 0 0 1 ~ E - 1 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、COCH<sub>3</sub> であり、A は、N であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 4 8 2 】

表 E - 1 5 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 5 . 0 0 1 ~ E - 1 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、COCH<sub>3</sub> であり、A は、N であり、X は、SO<sub>2</sub> であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 8 3 】

表 E - 1 6 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 6 . 0 0 1 ~ E - 1 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$  は、Me であり、 $R_2$  は、COCH<sub>3</sub> であり、A は、CH であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 8 4 】

表 E - 1 7 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 1 7 . 0 0 1 ~ E - 1 7 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $\text{COCH}_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0485】

表E-18は、式I-2-Qbの14種の化合物E-18.001~E-18.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $\text{COCH}_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0486】

表E-19は、式I-2-Qbの14種の化合物E-19.001~E-19.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0487】

表E-20は、式I-2-Qbの14種の化合物E-20.001~E-20.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0488】

表E-21は、式I-2-Qbの14種の化合物E-21.001~E-21.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0489】

表E-22は、式I-2-Qbの14種の化合物E-22.001~E-22.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0490】

表E-23は、式I-2-Qbの14種の化合物E-23.001~E-23.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0491】

表E-24は、式I-2-Qbの14種の化合物E-24.001~E-24.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0492】

表E-25は、式I-2-Qbの14種の化合物E-25.001~E-25.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0493】

表E-26は、式I-2-Qbの14種の化合物E-26.001~E-26.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0494】

表E-27は、式I-2-Qbの14種の化合物E-27.001~E-27.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0495】

表E-28は、式I-2-Qbの14種の化合物E-28.001~E-28.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0496】

表E-29は、式I-2-Qbの14種の化合物E-29.001~E-29.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50

## 【 0 4 9 7 】

表 E - 3 0 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 0 . 0 0 1 ~ E - 3 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 9 8 】

表 E - 3 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 1 . 0 0 1 ~ E - 3 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 4 9 9 】

表 E - 3 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 2 . 0 0 1 ~ E - 3 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 5 0 0 】

表 E - 3 3 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 3 . 0 0 1 ~ E - 3 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 1 】

表 E - 3 4 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 4 . 0 0 1 ~ E - 3 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 5 0 2 】

表 E - 3 5 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 5 . 0 0 1 ~ E - 3 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 3 】

表 E - 3 6 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 6 . 0 0 1 ~ E - 3 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 4 】

表 E - 3 7 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 7 . 0 0 1 ~ E - 3 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 5 0 5 】

表 E - 3 8 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 8 . 0 0 1 ~ E - 3 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 6 】

表 E - 3 9 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 3 9 . 0 0 1 ~ E - 3 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 5 0 7 】

表 E - 4 0 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 4 0 . 0 0 1 ~ E - 4 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 8 】

表 E - 4 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 4 1 . 0 0 1 ~ E - 4 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 0 9 】

表 E - 4 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 4 2 . 0 0 1 ~ E - 4 2 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0510】

表E-43は、式I-2-Qbの14種の化合物E-43.001~E-43.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0511】

表E-44は、式I-2-Qbの14種の化合物E-44.001~E-44.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0512】

表E-45は、式I-2-Qbの14種の化合物E-45.001~E-45.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0513】

表E-46は、式I-2-Qbの14種の化合物E-46.001~E-46.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0514】

表E-47は、式I-2-Qbの14種の化合物E-47.001~E-47.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0515】

表E-48は、式I-2-Qbの14種の化合物E-48.001~E-48.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0516】

表E-49は、式I-2-Qbの14種の化合物E-49.001~E-49.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0517】

表E-50は、式I-2-Qbの14種の化合物E-50.001~E-50.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0518】

表E-51は、式I-2-Qbの14種の化合物E-51.001~E-51.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0519】

表E-52は、式I-2-Qbの14種の化合物E-52.001~E-52.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0520】

表E-53は、式I-2-Qbの14種の化合物E-53.001~E-53.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0521】

表E-54は、式I-2-Qbの14種の化合物E-54.001~E-54.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50



## 【0522】

表E-55は、式I-2-Qbの14種の化合物E-55.001~E-55.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0523】

表E-56は、式I-2-Qbの14種の化合物E-56.001~E-56.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0524】

表E-57は、式I-2-Qbの14種の化合物E-57.001~E-57.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

10

## 【0525】

表E-58は、式I-2-Qbの14種の化合物E-58.001~E-58.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0526】

表E-59は、式I-2-Qbの14種の化合物E-59.001~E-59.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

20

## 【0527】

表E-60は、式I-2-Qbの14種の化合物E-60.001~E-60.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0528】

表E-61は、式I-2-Qbの14種の化合物E-61.001~E-61.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0529】

表E-62は、式I-2-Qbの14種の化合物E-62.001~E-62.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

30

## 【0530】

表E-63は、式I-2-Qbの14種の化合物E-63.001~E-63.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0531】

表E-64は、式I-2-Qbの14種の化合物E-64.001~E-64.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

40

## 【0532】

表E-65は、式I-2-Qbの14種の化合物E-65.001~E-65.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0533】

表E-66は、式I-2-Qbの14種の化合物E-66.001~E-66.014を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表Bに定義されているとおりである。

## 【0534】

表E-67は、式I-2-Qbの14種の化合物E-67.001~E-67.014

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0535】

表E-68は、式I-2-Qbの14種の化合物E-68.001~E-68.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0536】

表E-69は、式I-2-Qbの14種の化合物E-69.001~E-69.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0537】

表E-70は、式I-2-Qbの14種の化合物E-70.001~E-70.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0538】

表E-71は、式I-2-Qbの14種の化合物E-71.001~E-71.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0539】

表E-72は、式I-2-Qbの14種の化合物E-72.001~E-72.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0540】

表E-73は、式I-2-Qbの14種の化合物E-73.001~E-73.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0541】

表E-74は、式I-2-Qbの14種の化合物E-74.001~E-74.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0542】

表E-75は、式I-2-Qbの14種の化合物E-75.001~E-75.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0543】

表E-76は、式I-2-Qbの14種の化合物E-76.001~E-76.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0544】

表E-77は、式I-2-Qbの14種の化合物E-77.001~E-77.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0545】

表E-78は、式I-2-Qbの14種の化合物E-78.001~E-78.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0546】

表E-79は、式I-2-Qbの14種の化合物E-79.001~E-79.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Et$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50

## 【 0 5 4 7 】

表 E - 8 0 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 0 . 0 0 1 ~ E - 8 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 4 8 】

表 E - 8 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 1 . 0 0 1 ~ E - 8 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 4 9 】

表 E - 8 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 2 . 0 0 1 ~ E - 8 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 5 5 0 】

表 E - 8 3 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 3 . 0 0 1 ~ E - 8 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 1 】

表 E - 8 4 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 4 . 0 0 1 ~ E - 8 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 5 5 2 】

表 E - 8 5 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 5 . 0 0 1 ~ E - 8 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 3 】

表 E - 8 6 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 6 . 0 0 1 ~ E - 8 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 4 】

表 E - 8 7 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 7 . 0 0 1 ~ E - 8 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 5 5 5 】

表 E - 8 8 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 8 . 0 0 1 ~ E - 8 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 6 】

表 E - 8 9 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 8 9 . 0 0 1 ~ E - 8 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 5 5 7 】

表 E - 9 0 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 9 0 . 0 0 1 ~ E - 9 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CH_2CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 8 】

表 E - 9 1 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 9 1 . 0 0 1 ~ E - 9 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 5 5 9 】

表 E - 9 2 は、式 I - 2 - Q b の 1 4 種の化合物 E - 9 2 . 0 0 1 ~ E - 9 2 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0560】

表E-93は、式I-2-Qbの14種の化合物E-93.001~E-93.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0561】

表E-94は、式I-2-Qbの14種の化合物E-94.001~E-94.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0562】

表E-95は、式I-2-Qbの14種の化合物E-95.001~E-95.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0563】

表E-96は、式I-2-Qbの14種の化合物E-96.001~E-96.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0564】

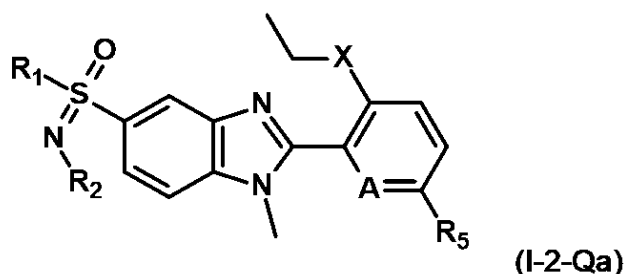
下記の表F-1~F-96は、本発明の特定の化合物をさらに例示する。

20

【0565】

「cPr」は、シクロプロピルを表す。

【化36】



30

【0566】

表F-1は、式I-2-Qaの7種の化合物F-1.001~F-1.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $H$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0567】

表F-2は、式I-2-Qaの7種の化合物F-2.001~F-2.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0568】

表F-3は、式I-2-Qaの7種の化合物F-3.001~F-3.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0569】

表F-4は、式I-2-Qaの7種の化合物F-4.001~F-4.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0570】

表F-5は、式I-2-Qaの7種の化合物F-5.001~F-5.007を提供し

50

、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0571】

表F-6は、式I-2-Qaの7種の化合物F-6.001~F-6.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0572】

表F-7は、式I-2-Qaの7種の化合物F-7.001~F-7.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0573】

表F-8は、式I-2-Qaの7種の化合物F-8.001~F-8.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0574】

表F-9は、式I-2-Qaの7種の化合物F-9.001~F-9.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0575】

表F-10は、式I-2-Qaの7種の化合物F-10.001~F-10.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0576】

表F-11は、式I-2-Qaの7種の化合物F-11.001~F-11.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0577】

表F-12は、式I-2-Qaの7種の化合物F-12.001~F-12.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0578】

表F-13は、式I-2-Qaの7種の化合物F-13.001~F-13.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0579】

表F-14は、式I-2-Qaの7種の化合物F-14.001~F-14.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0580】

表F-15は、式I-2-Qaの7種の化合物F-15.001~F-15.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0581】

表F-16は、式I-2-Qaの7種の化合物F-16.001~F-16.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0582】

表F-17は、式I-2-Qaの7種の化合物F-17.001~F-17.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【0583】

表F-18は、式I-2-Qaの7種の化合物F-18.001~F-18.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0584】

表F-19は、式I-2-Qaの7種の化合物F-19.001~F-19.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0585】

表F-20は、式I-2-Qaの7種の化合物F-20.001~F-20.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

## 【0586】

表F-21は、式I-2-Qaの7種の化合物F-21.001~F-21.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0587】

表F-22は、式I-2-Qaの7種の化合物F-22.001~F-22.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

## 【0588】

表F-23は、式I-2-Qaの7種の化合物F-23.001~F-23.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0589】

表F-24は、式I-2-Qaの7種の化合物F-24.001~F-24.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0590】

表F-25は、式I-2-Qaの7種の化合物F-25.001~F-25.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

## 【0591】

表F-26は、式I-2-Qaの7種の化合物F-26.001~F-26.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0592】

表F-27は、式I-2-Qaの7種の化合物F-27.001~F-27.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

## 【0593】

表F-28は、式I-2-Qaの7種の化合物F-28.001~F-28.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0594】

表F-29は、式I-2-Qaの7種の化合物F-29.001~F-29.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0595】

表F-30は、式I-2-Qaの7種の化合物F-30.001~F-30.007を

50

提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0596】

表F-31は、式I-2-Qaの7種の化合物F-31.001~F-31.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0597】

表F-32は、式I-2-Qaの7種の化合物F-32.001~F-32.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0598】

表F-33は、式I-2-Qaの7種の化合物F-33.001~F-33.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0599】

表F-34は、式I-2-Qaの7種の化合物F-34.001~F-34.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0600】

表F-35は、式I-2-Qaの7種の化合物F-35.001~F-35.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、OCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0601】

表F-36は、式I-2-Qaの7種の化合物F-36.001~F-36.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0602】

表F-37は、式I-2-Qaの7種の化合物F-37.001~F-37.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0603】

表F-38は、式I-2-Qaの7種の化合物F-38.001~F-38.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0604】

表F-39は、式I-2-Qaの7種の化合物F-39.001~F-39.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0605】

表F-40は、式I-2-Qaの7種の化合物F-40.001~F-40.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0606】

表F-41は、式I-2-Qaの7種の化合物F-41.001~F-41.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0607】

表F-42は、式I-2-Qaの7種の化合物F-42.001~F-42.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【0608】

表F-43は、式I-2-Qaの7種の化合物F-43.001~F-43.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0609】

表F-44は、式I-2-Qaの7種の化合物F-44.001~F-44.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0610】

表F-45は、式I-2-Qaの7種の化合物F-45.001~F-45.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

## 【0611】

表F-46は、式I-2-Qaの7種の化合物F-46.001~F-46.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0612】

表F-47は、式I-2-Qaの7種の化合物F-47.001~F-47.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

## 【0613】

表F-48は、式I-2-Qaの7種の化合物F-48.001~F-48.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0614】

表F-49は、式I-2-Qaの7種の化合物F-49.001~F-49.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0615】

表F-50は、式I-2-Qaの7種の化合物F-50.001~F-50.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

## 【0616】

表F-51は、式I-2-Qaの7種の化合物F-51.001~F-51.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0617】

表F-52は、式I-2-Qaの7種の化合物F-52.001~F-52.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

## 【0618】

表F-53は、式I-2-Qaの7種の化合物F-53.001~F-53.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0619】

表F-54は、式I-2-Qaの7種の化合物F-54.001~F-54.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0620】

表F-55は、式I-2-Qaの7種の化合物F-55.001~F-55.007を

50



提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0621】

表F-56は、式I-2-Qaの7種の化合物F-56.001~F-56.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0622】

表F-57は、式I-2-Qaの7種の化合物F-57.001~F-57.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0623】

表F-58は、式I-2-Qaの7種の化合物F-58.001~F-58.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0624】

表F-59は、式I-2-Qaの7種の化合物F-59.001~F-59.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0625】

表F-60は、式I-2-Qaの7種の化合物F-60.001~F-60.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0626】

表F-61は、式I-2-Qaの7種の化合物F-61.001~F-61.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0627】

表F-62は、式I-2-Qaの7種の化合物F-62.001~F-62.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0628】

表F-63は、式I-2-Qaの7種の化合物F-63.001~F-63.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0629】

表F-64は、式I-2-Qaの7種の化合物F-64.001~F-64.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0630】

表F-65は、式I-2-Qaの7種の化合物F-65.001~F-65.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0631】

表F-66は、式I-2-Qaの7種の化合物F-66.001~F-66.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0632】

表F-67は、式I-2-Qaの7種の化合物F-67.001~F-67.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 6 3 3 】

表 F - 6 8 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 6 8 . 0 0 1 ~ F - 6 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 3 4 】

表 F - 6 9 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 6 9 . 0 0 1 ~ F - 6 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 3 5 】

表 F - 7 0 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 0 . 0 0 1 ~ F - 7 0 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

10

## 【 0 6 3 6 】

表 F - 7 1 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 1 . 0 0 1 ~ F - 7 1 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 3 7 】

表 F - 7 2 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 2 . 0 0 1 ~ F - 7 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

20

## 【 0 6 3 8 】

表 F - 7 3 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 3 . 0 0 1 ~ F - 7 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、H であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 3 9 】

表 F - 7 4 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 4 . 0 0 1 ~ F - 7 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C N であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 4 0 】

表 F - 7 5 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 5 . 0 0 1 ~ F - 7 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

30

## 【 0 6 4 1 】

表 F - 7 6 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 6 . 0 0 1 ~ F - 7 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 4 2 】

表 F - 7 7 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 7 . 0 0 1 ~ F - 7 7 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

40

## 【 0 6 4 3 】

表 F - 7 8 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 8 . 0 0 1 ~ F - 7 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 4 4 】

表 F - 7 9 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 7 9 . 0 0 1 ~ F - 7 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 6 4 5 】

表 F - 8 0 は、式 I - 2 - Q a の 7 種の化合物 F - 8 0 . 0 0 1 ~ F - 8 0 . 0 0 7 を

50

提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0646】

表F-81は、式I-2-Qaの7種の化合物F-81.001~F-81.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0647】

表F-82は、式I-2-Qaの7種の化合物F-82.001~F-82.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0648】

表F-83は、式I-2-Qaの7種の化合物F-83.001~F-83.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0649】

表F-84は、式I-2-Qaの7種の化合物F-84.001~F-84.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0650】

表F-85は、式I-2-Qaの7種の化合物F-85.001~F-85.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0651】

表F-86は、式I-2-Qaの7種の化合物F-86.001~F-86.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0652】

表F-87は、式I-2-Qaの7種の化合物F-87.001~F-87.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0653】

表F-88は、式I-2-Qaの7種の化合物F-88.001~F-88.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0654】

表F-89は、式I-2-Qaの7種の化合物F-89.001~F-89.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0655】

表F-90は、式I-2-Qaの7種の化合物F-90.001~F-90.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0656】

表F-91は、式I-2-Qaの7種の化合物F-91.001~F-91.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0657】

表F-92は、式I-2-Qaの7種の化合物F-92.001~F-92.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 6 5 8 】

表 F - 9 3 は、式 I - 2 - Q a の 7 種 の 化 合 物 F - 9 3 . 0 0 1 ~ F - 9 3 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 5 9 】

表 F - 9 4 は、式 I - 2 - Q a の 7 種 の 化 合 物 F - 9 4 . 0 0 1 ~ F - 9 4 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 0 】

表 F - 9 5 は、式 I - 2 - Q a の 7 種 の 化 合 物 F - 9 5 . 0 0 1 ~ F - 9 5 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 1 】

表 F - 9 6 は、式 I - 2 - Q a の 7 種 の 化 合 物 F - 9 6 . 0 0 1 ~ F - 9 6 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

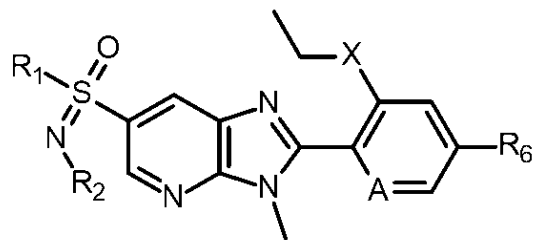
## 【 0 6 6 2 】

下 記 の 表 G - 1 ~ G - 9 6 は、本 発 明 の 特 定 の 化 合 物 を さ ら に 例 示 す る。

## 【 0 6 6 3 】

「 c P r 」 は、シ ク ロ プ ロ ピ ル を 表 す。

## 【 化 3 7 】



(I-3-Qb)

## 【 0 6 6 4 】

表 G - 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 1 . 0 0 1 ~ G - 1 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S であり、R<sub>6</sub> は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 5 】

表 G - 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 2 . 0 0 1 ~ G - 2 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S O であり、R<sub>6</sub> は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 6 】

表 G - 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 3 . 0 0 1 ~ G - 3 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、N であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>6</sub> は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 7 】

表 G - 4 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 4 . 0 0 1 ~ G - 4 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、C H であり、X は、S であり、R<sub>6</sub> は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 8 】

表 G - 5 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 5 . 0 0 1 ~ G - 5 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、R<sub>1</sub> は、M e であり、R<sub>2</sub> は、H であり、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>6</sub> は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 6 6 9 】

表 G - 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 . 0 0 1 ~ G - 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 0 】

表 G - 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 7 . 0 0 1 ~ G - 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 1 】

表 G - 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 8 . 0 0 1 ~ G - 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 6 7 2 】

表 G - 9 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 9 . 0 0 1 ~ G - 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 3 】

表 G - 1 0 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 0 . 0 0 1 ~ G - 1 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 6 7 4 】

表 G - 1 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 1 . 0 0 1 ~ G - 1 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 5 】

表 G - 1 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 2 . 0 0 1 ~ G - 1 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CNであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 6 】

表 G - 1 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 3 . 0 0 1 ~ G - 1 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 6 7 7 】

表 G - 1 4 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 4 . 0 0 1 ~ G - 1 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 7 8 】

表 G - 1 5 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 5 . 0 0 1 ~ G - 1 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 6 7 9 】

表 G - 1 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 6 . 0 0 1 ~ G - 1 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 8 0 】

表 G - 1 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 7 . 0 0 1 ~ G - 1 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 8 1 】

表 G - 1 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 1 8 . 0 0 1 ~ G - 1 8 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $\text{COCH}_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0682】

表G-19は、式I-3-Qbの14種の化合物G-19.001~G-19.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0683】

表G-20は、式I-3-Qbの14種の化合物G-20.001~G-20.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0684】

表G-21は、式I-3-Qbの14種の化合物G-21.001~G-21.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、Nであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0685】

表G-22は、式I-3-Qbの14種の化合物G-22.001~G-22.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0686】

表G-23は、式I-3-Qbの14種の化合物G-23.001~G-23.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0687】

表G-24は、式I-3-Qbの14種の化合物G-24.001~G-24.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、cPrであり、Aは、CHであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0688】

表G-25は、式I-3-Qbの14種の化合物G-25.001~G-25.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0689】

表G-26は、式I-3-Qbの14種の化合物G-26.001~G-26.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0690】

表G-27は、式I-3-Qbの14種の化合物G-27.001~G-27.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、Nであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0691】

表G-28は、式I-3-Qbの14種の化合物G-28.001~G-28.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0692】

表G-29は、式I-3-Qbの14種の化合物G-29.001~G-29.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0693】

表G-30は、式I-3-Qbの14種の化合物G-30.001~G-30.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、Meであり、Aは、CHであり、Xは、 $\text{SO}_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50

## 【 0 6 9 4 】

表 G - 3 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 1 . 0 0 1 ~ G - 3 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 9 5 】

表 G - 3 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 2 . 0 0 1 ~ G - 3 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 9 6 】

表 G - 3 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 3 . 0 0 1 ~ G - 3 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 6 9 7 】

表 G - 3 4 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 4 . 0 0 1 ~ G - 3 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 6 9 8 】

表 G - 3 5 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 5 . 0 0 1 ~ G - 3 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 6 9 9 】

表 G - 3 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 6 . 0 0 1 ~ G - 3 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、Etであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 0 0 】

表 G - 3 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 7 . 0 0 1 ~ G - 3 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 0 1 】

表 G - 3 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 8 . 0 0 1 ~ G - 3 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 7 0 2 】

表 G - 3 9 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 3 9 . 0 0 1 ~ G - 3 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 0 3 】

表 G - 4 0 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 4 0 . 0 0 1 ~ G - 4 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 7 0 4 】

表 G - 4 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 4 1 . 0 0 1 ~ G - 4 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 0 5 】

表 G - 4 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 4 2 . 0 0 1 ~ G - 4 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、R<sub>1</sub>は、Meであり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>6</sub>は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 0 6 】

表 G - 4 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 4 3 . 0 0 1 ~ G - 4 3 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0707】

表G-44は、式I-3-Qbの14種の化合物G-44.001~G-44.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0708】

表G-45は、式I-3-Qbの14種の化合物G-45.001~G-45.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0709】

表G-46は、式I-3-Qbの14種の化合物G-46.001~G-46.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0710】

表G-47は、式I-3-Qbの14種の化合物G-47.001~G-47.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0711】

表G-48は、式I-3-Qbの14種の化合物G-48.001~G-48.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、Meであり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0712】

表G-49は、式I-3-Qbの14種の化合物G-49.001~G-49.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0713】

表G-50は、式I-3-Qbの14種の化合物G-50.001~G-50.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0714】

表G-51は、式I-3-Qbの14種の化合物G-51.001~G-51.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0715】

表G-52は、式I-3-Qbの14種の化合物G-52.001~G-52.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0716】

表G-53は、式I-3-Qbの14種の化合物G-53.001~G-53.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SOであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0717】

表G-54は、式I-3-Qbの14種の化合物G-54.001~G-54.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、Hであり、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0718】

表G-55は、式I-3-Qbの14種の化合物G-55.001~G-55.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、CNであり、Aは、Nであり、Xは、Sであり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50



## 【 0 7 1 9 】

表 G - 5 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 5 6 . 0 0 1 ~ G - 5 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 0 】

表 G - 5 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 5 7 . 0 0 1 ~ G - 5 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 1 】

表 G - 5 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 5 8 . 0 0 1 ~ G - 5 8 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

10

## 【 0 7 2 2 】

表 G - 5 9 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 5 9 . 0 0 1 ~ G - 5 9 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 3 】

表 G - 6 0 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 0 . 0 0 1 ~ G - 6 0 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

20

## 【 0 7 2 4 】

表 G - 6 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 1 . 0 0 1 ~ G - 6 1 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 5 】

表 G - 6 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 2 . 0 0 1 ~ G - 6 2 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 6 】

表 G - 6 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 3 . 0 0 1 ~ G - 6 3 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

30

## 【 0 7 2 7 】

表 G - 6 4 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 4 . 0 0 1 ~ G - 6 4 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 2 8 】

表 G - 6 5 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 5 . 0 0 1 ~ G - 6 5 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

40

## 【 0 7 2 9 】

表 G - 6 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 6 . 0 0 1 ~ G - 6 6 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 3 0 】

表 G - 6 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 7 . 0 0 1 ~ G - 6 7 . 0 1 4 を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表 B に定義されているとおりである。

## 【 0 7 3 1 】

表 G - 6 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種の化合物 G - 6 8 . 0 0 1 ~ G - 6 8 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0732】

表G-69は、式I-3-Qbの14種の化合物G-69.001~G-69.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0733】

表G-70は、式I-3-Qbの14種の化合物G-70.001~G-70.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0734】

表G-71は、式I-3-Qbの14種の化合物G-71.001~G-71.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0735】

表G-72は、式I-3-Qbの14種の化合物G-72.001~G-72.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0736】

表G-73は、式I-3-Qbの14種の化合物G-73.001~G-73.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

20

【0737】

表G-74は、式I-3-Qbの14種の化合物G-74.001~G-74.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0738】

表G-75は、式I-3-Qbの14種の化合物G-75.001~G-75.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

30

【0739】

表G-76は、式I-3-Qbの14種の化合物G-76.001~G-76.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0740】

表G-77は、式I-3-Qbの14種の化合物G-77.001~G-77.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0741】

表G-78は、式I-3-Qbの14種の化合物G-78.001~G-78.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

40

【0742】

表G-79は、式I-3-Qbの14種の化合物G-79.001~G-79.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Et$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0743】

表G-80は、式I-3-Qbの14種の化合物G-80.001~G-80.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Et$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

50

## 【 0 7 4 4 】

表 G - 8 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 1 . 0 0 1 ~ G - 8 1 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、Et であり、A は、N であり、X は、 $SO_2$  であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 4 5 】

表 G - 8 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 2 . 0 0 1 ~ G - 8 2 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、Et であり、A は、CH であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 4 6 】

表 G - 8 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 3 . 0 0 1 ~ G - 8 3 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、Et であり、A は、CH であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

10

## 【 0 7 4 7 】

表 G - 8 4 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 4 . 0 0 1 ~ G - 8 4 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、Et であり、A は、CH であり、X は、 $SO_2$  であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 4 8 】

表 G - 8 5 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 5 . 0 0 1 ~ G - 8 5 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、N であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

20

## 【 0 7 4 9 】

表 G - 8 6 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 6 . 0 0 1 ~ G - 8 6 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、N であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 5 0 】

表 G - 8 7 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 7 . 0 0 1 ~ G - 8 7 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、N であり、X は、 $SO_2$  であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 5 1 】

表 G - 8 8 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 8 . 0 0 1 ~ G - 8 8 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、CH であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

30

## 【 0 7 5 2 】

表 G - 8 9 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 8 9 . 0 0 1 ~ G - 8 9 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、CH であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 5 3 】

表 G - 9 0 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 9 0 . 0 0 1 ~ G - 9 0 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CH_2CF_3$  であり、A は、CH であり、X は、 $SO_2$  であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

40

## 【 0 7 5 4 】

表 G - 9 1 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 9 1 . 0 0 1 ~ G - 9 1 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CF_3$  であり、A は、N であり、X は、S であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 5 5 】

表 G - 9 2 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 9 2 . 0 0 1 ~ G - 9 2 . 0 1 4 を 提 供 し、こ こ で、 $R_1$  は、 $CF_3$  であり、 $R_2$  は、 $CF_3$  であり、A は、N であり、X は、SO であり、 $R_6$  は、表 B に 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

## 【 0 7 5 6 】

表 G - 9 3 は、式 I - 3 - Q b の 1 4 種 の 化 合 物 G - 9 3 . 0 0 1 ~ G - 9 3 . 0 1 4

50

を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0757】

表G-94は、式I-3-Qbの14種の化合物G-94.001~G-94.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0758】

表G-95は、式I-3-Qbの14種の化合物G-95.001~G-95.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

10

【0759】

表G-96は、式I-3-Qbの14種の化合物G-96.001~G-96.014を提供し、ここで、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CF_3$ であり、 $A$ は、 $CH$ であり、 $X$ は、 $SO_2$ であり、 $R_6$ は、表Bに定義されているとおりである。

【0760】

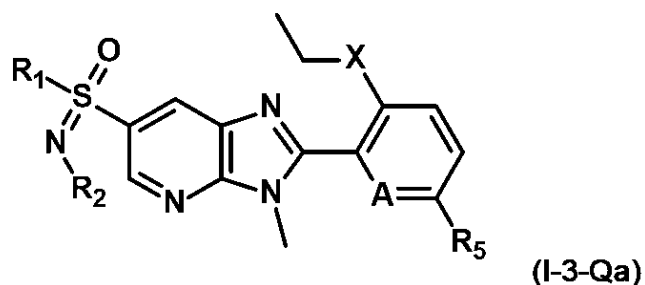
下記の表H-1~H-96は、本発明の特定の化合物をさらに例示する。

【0761】

「cPr」は、シクロプロピルを表す。

【化38】

20



【0762】

表H-1は、式I-3-Qaの7種の化合物H-1.001~H-1.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $H$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0763】

表H-2は、式I-3-Qaの7種の化合物H-2.001~H-2.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $CN$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0764】

表H-3は、式I-3-Qaの7種の化合物H-3.001~H-3.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $COCH_3$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0765】

表H-4は、式I-3-Qaの7種の化合物H-4.001~H-4.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $cPr$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0766】

表H-5は、式I-3-Qaの7種の化合物H-5.001~H-5.007を提供し、ここで、 $A$ は、 $N$ であり、 $X$ は、 $S$ であり、 $R_1$ は、 $CF_3$ であり、 $R_2$ は、 $Me$ であり、 $R_5$ は、表Dに定義されているとおりである。

【0767】

表H-6は、式I-3-Qaの7種の化合物H-6.001~H-6.007を提供し

50

、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0768】

表H-7は、式I-3-Qaの7種の化合物H-7.001~H-7.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0769】

表H-8は、式I-3-Qaの7種の化合物H-8.001~H-8.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0770】

表H-9は、式I-3-Qaの7種の化合物H-9.001~H-9.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0771】

表H-10は、式I-3-Qaの7種の化合物H-10.001~H-10.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0772】

表H-11は、式I-3-Qaの7種の化合物H-11.001~H-11.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0773】

表H-12は、式I-3-Qaの7種の化合物H-12.001~H-12.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0774】

表H-13は、式I-3-Qaの7種の化合物H-13.001~H-13.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0775】

表H-14は、式I-3-Qaの7種の化合物H-14.001~H-14.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0776】

表H-15は、式I-3-Qaの7種の化合物H-15.001~H-15.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0777】

表H-16は、式I-3-Qaの7種の化合物H-16.001~H-16.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0778】

表H-17は、式I-3-Qaの7種の化合物H-17.001~H-17.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0779】

表H-18は、式I-3-Qaの7種の化合物H-18.001~H-18.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 7 8 0 】

表 H - 1 9 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 1 9 . 0 0 1 ~ H - 1 9 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 1 】

表 H - 2 0 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 0 . 0 0 1 ~ H - 2 0 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、c P r で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 2 】

表 H - 2 1 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 1 . 0 0 1 ~ H - 2 1 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、M e で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

10

## 【 0 7 8 3 】

表 H - 2 2 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 2 . 0 0 1 ~ H - 2 2 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、E t で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 4 】

表 H - 2 3 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 3 . 0 0 1 ~ H - 2 3 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

20

## 【 0 7 8 5 】

表 H - 2 4 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 4 . 0 0 1 ~ H - 2 4 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 6 】

表 H - 2 5 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 5 . 0 0 1 ~ H - 2 5 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、H で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 7 】

表 H - 2 6 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 6 . 0 0 1 ~ H - 2 6 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、C N で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

30

## 【 0 7 8 8 】

表 H - 2 7 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 7 . 0 0 1 ~ H - 2 7 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 8 9 】

表 H - 2 8 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 8 . 0 0 1 ~ H - 2 8 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、c P r で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

40

## 【 0 7 9 0 】

表 H - 2 9 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 2 9 . 0 0 1 ~ H - 2 9 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、M e で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 9 1 】

表 H - 3 0 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 3 0 . 0 0 1 ~ H - 3 0 . 0 0 7 を 提 供 し、こ こ で、A は、N で あり、X は、S O で あり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> で あり、R<sub>2</sub> は、E t で あり、R<sub>5</sub> は、表 D に 定 義 さ れ て い る と お り で あり。

## 【 0 7 9 2 】

表 H - 3 1 は、式 I - 3 - Q a の 7 種 の 化 合 物 H - 3 1 . 0 0 1 ~ H - 3 1 . 0 0 7 を

50

提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0793】

表H-32は、式I-3-Qaの7種の化合物H-32.001~H-32.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0794】

表H-33は、式I-3-Qaの7種の化合物H-33.001~H-33.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0795】

表H-34は、式I-3-Qaの7種の化合物H-34.001~H-34.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0796】

表H-35は、式I-3-Qaの7種の化合物H-35.001~H-35.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0797】

表H-36は、式I-3-Qaの7種の化合物H-36.001~H-36.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0798】

表H-37は、式I-3-Qaの7種の化合物H-37.001~H-37.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0799】

表H-38は、式I-3-Qaの7種の化合物H-38.001~H-38.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0800】

表H-39は、式I-3-Qaの7種の化合物H-39.001~H-39.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0801】

表H-40は、式I-3-Qaの7種の化合物H-40.001~H-40.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0802】

表H-41は、式I-3-Qaの7種の化合物H-41.001~H-41.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0803】

表H-42は、式I-3-Qaの7種の化合物H-42.001~H-42.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0804】

表H-43は、式I-3-Qaの7種の化合物H-43.001~H-43.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【0805】

表H-44は、式I-3-Qaの7種の化合物H-44.001~H-44.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0806】

表H-45は、式I-3-Qaの7種の化合物H-45.001~H-45.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0807】

表H-46は、式I-3-Qaの7種の化合物H-46.001~H-46.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

## 【0808】

表H-47は、式I-3-Qaの7種の化合物H-47.001~H-47.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0809】

表H-48は、式I-3-Qaの7種の化合物H-48.001~H-48.007を提供し、ここで、Aは、Nであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

## 【0810】

表H-49は、式I-3-Qaの7種の化合物H-49.001~H-49.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0811】

表H-50は、式I-3-Qaの7種の化合物H-50.001~H-50.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0812】

表H-51は、式I-3-Qaの7種の化合物H-51.001~H-51.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

## 【0813】

表H-52は、式I-3-Qaの7種の化合物H-52.001~H-52.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0814】

表H-53は、式I-3-Qaの7種の化合物H-53.001~H-53.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

## 【0815】

表H-54は、式I-3-Qaの7種の化合物H-54.001~H-54.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0816】

表H-55は、式I-3-Qaの7種の化合物H-55.001~H-55.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

## 【0817】

表H-56は、式I-3-Qaの7種の化合物H-56.001~H-56.007を

50



提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0818】

表H-57は、式I-3-Qaの7種の化合物H-57.001~H-57.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0819】

表H-58は、式I-3-Qaの7種の化合物H-58.001~H-58.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0820】

表H-59は、式I-3-Qaの7種の化合物H-59.001~H-59.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0821】

表H-60は、式I-3-Qaの7種の化合物H-60.001~H-60.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0822】

表H-61は、式I-3-Qaの7種の化合物H-61.001~H-61.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0823】

表H-62は、式I-3-Qaの7種の化合物H-62.001~H-62.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0824】

表H-63は、式I-3-Qaの7種の化合物H-63.001~H-63.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0825】

表H-64は、式I-3-Qaの7種の化合物H-64.001~H-64.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、Sであり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0826】

表H-65は、式I-3-Qaの7種の化合物H-65.001~H-65.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0827】

表H-66は、式I-3-Qaの7種の化合物H-66.001~H-66.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0828】

表H-67は、式I-3-Qaの7種の化合物H-67.001~H-67.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0829】

表H-68は、式I-3-Qaの7種の化合物H-68.001~H-68.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SOであり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 8 3 0 】

表 H - 6 9 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 6 9 . 0 0 1 ~ H - 6 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 1 】

表 H - 7 0 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 0 . 0 0 1 ~ H - 7 0 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 2 】

表 H - 7 1 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 1 . 0 0 1 ~ H - 7 1 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

10

## 【 0 8 3 3 】

表 H - 7 2 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 2 . 0 0 1 ~ H - 7 2 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 4 】

表 H - 7 3 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 3 . 0 0 1 ~ H - 7 3 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、H であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

20

## 【 0 8 3 5 】

表 H - 7 4 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 4 . 0 0 1 ~ H - 7 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C N であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 6 】

表 H - 7 5 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 5 . 0 0 1 ~ H - 7 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C O C H<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 7 】

表 H - 7 6 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 6 . 0 0 1 ~ H - 7 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、c P r であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

30

## 【 0 8 3 8 】

表 H - 7 7 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 7 . 0 0 1 ~ H - 7 7 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、M e であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 3 9 】

表 H - 7 8 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 8 . 0 0 1 ~ H - 7 8 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

40

## 【 0 8 4 0 】

表 H - 7 9 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 7 9 . 0 0 1 ~ H - 7 9 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 4 1 】

表 H - 8 0 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 8 0 . 0 0 1 ~ H - 8 0 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 4 2 】

表 H - 8 1 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 8 1 . 0 0 1 ~ H - 8 1 . 0 0 7 を

50

提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0843】

表H-82は、式I-3-Qaの7種の化合物H-82.001~H-82.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0844】

表H-83は、式I-3-Qaの7種の化合物H-83.001~H-83.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

10

【0845】

表H-84は、式I-3-Qaの7種の化合物H-84.001~H-84.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0846】

表H-85は、式I-3-Qaの7種の化合物H-85.001~H-85.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0847】

表H-86は、式I-3-Qaの7種の化合物H-86.001~H-86.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Etであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

20

【0848】

表H-87は、式I-3-Qaの7種の化合物H-87.001~H-87.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0849】

表H-88は、式I-3-Qaの7種の化合物H-88.001~H-88.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CF<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

30

【0850】

表H-89は、式I-3-Qaの7種の化合物H-89.001~H-89.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Hであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0851】

表H-90は、式I-3-Qaの7種の化合物H-90.001~H-90.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、CNであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0852】

表H-91は、式I-3-Qaの7種の化合物H-91.001~H-91.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、COCH<sub>3</sub>であり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

40

【0853】

表H-92は、式I-3-Qaの7種の化合物H-92.001~H-92.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、cPrであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

【0854】

表H-93は、式I-3-Qaの7種の化合物H-93.001~H-93.007を提供し、ここで、Aは、CHであり、Xは、SO<sub>2</sub>であり、R<sub>1</sub>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sub>2</sub>は、Meであり、R<sub>5</sub>は、表Dに定義されているとおりである。

50

## 【 0 8 5 5 】

表 H - 9 4 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 9 4 . 0 0 1 ~ H - 9 4 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、E t であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 5 6 】

表 H - 9 5 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 9 5 . 0 0 1 ~ H - 9 5 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 5 7 】

表 H - 9 6 は、式 I - 3 - Q a の 7 種の化合物 H - 9 6 . 0 0 1 ~ H - 9 6 . 0 0 7 を提供し、ここで、A は、C H であり、X は、S O<sub>2</sub> であり、R<sub>1</sub> は、C H<sub>3</sub> であり、R<sub>2</sub> は、C F<sub>3</sub> であり、R<sub>5</sub> は、表 D に定義されているとおりである。

## 【 0 8 5 8 】

本発明に係る式 I の化合物は、低施用量でも、有害生物防除分野における予防的及び / 又は治療的に価値の高い有効成分であり、これらは、きわめて好ましい殺生物範囲を有すると共に、温血種、魚類及び植物類による良好な耐性を示す。本発明に係る有効成分は、通常、感受性であるが、耐性でもある昆虫又は代表的なダニ目などの動物有害生物の成長段階のすべて又は各々に対して作用する。本発明に係る有効成分の殺虫活性又は殺ダニ活性は、それ自体、直接的に顕在化（すなわち直後又は一定時間が経過した後にのみ（例えば、脱皮中）生じる有害生物の駆除）されるか、又は間接的に顕在化（例えば、産卵及び / 又は孵化率の低下、少なくとも 5 0 ~ 6 0 % の駆除割合（死亡率）に相当する良好な活性）され得る。

## 【 0 8 5 9 】

上記の動物有害生物の例は、以下のとおりである：

ダニ目 (Acarina) から、例えばアカリツス属 (Acalitus spp)、アカルス属 (Aculus spp)、アカリカルス属 (Acaricalus spp)、アセリア属 (Aceria spp)、アシフトコナダニ (Acarus siro)、キララマダニ属 (Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属 (Argas spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.)、ブレビバルパス属 (Brevipalpus spp.)、ブリオビア属 (Bryobia spp)、カリピトリメルス属 (Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (Chorioptes spp.)、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス属 (Dermatophagoides spp)、エオテトラニカス属 (Eotetranychus spp)、エリオフィエス属 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属 (Hemitarsonemus spp)、イボマダニ属 (Hyalomma spp.)、タネガタマダニ属 (Ixodes spp.)、オリゴニクス属 (Oligonychus spp)、カズキダニ属 (Ornithodoros spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス (Polyphagotarsonella latius)、パノニクス属 (Panonychus spp.)、ミカンサビダニ (Phyllocoptruta oleivora)、フィトネムス属 (Phytonemus spp)、ポリファゴタロソネムス属 (Polyphagotarsonemus spp)、キュウセンヒゼンダニ属 (Psoroptes spp.)、コイタマダニ属 (Rhhipicephalus spp.)、リゾグリフス属 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属 (Sarcoptes spp.)、ステネオタルソネムス属 (Steneotarsonemus spp)、ホコリダニ属 (Tarsonemus spp.) 及びテトラニクス属 (Tetranychus spp.) ；

シラミ目 (Anoplura) から、例えばブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.) 及びフィロキセラ属 (Phylloxera spp.) ；

10

20

30

40

50

鞘翅目 (Coleoptera) から、例えばアグリオテス属 (Agriotes spp.)、アンフィマロン・マジアレ (Amphimallon majale)、セマダラコガネ (Anomala orientalis)、アントノムス属 (Anthrenus spp.)、マグソコガネ属 (Aphodius spp.)、アスチラス・アトロマクラタス (Astylus atromaculatus)、アテニウス属 (Ateneius spp.)、アトマリア・リネアリス (Atomaria linearis)、カエトクネマ・チピアリス (Chaetocnema tibialis)、セロトマ属 (Cerotoma spp.)、コノデルス属 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属 (Cosmopolites spp.)、コチニス・ニチダ (Cotinis nitida)、クルクリオ属 (Curculio spp.)、シクロセファラ属 (Cyclocephala spp.)、デルメステス属 (Dermestes spp.)、ジアブロチカ属 (Diabrotica spp.)、アブデルスツノカブトムシ (Diloboderus abderus)、エピラクナ属 (Epilachna spp.)、エレムヌス属 (Eremnus spp.)、ヘテロニクス・アラトル (Heteronychus arator)、コーヒーノミキクイムシ (Hypothenemus hampei)、ラグリア・フイロサ (Lagria villosa)、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata)、リッソルホプトルス属 (Lissorhopterus spp.)、リオゲニス属 (Liogenys spp.)、マエコラスピス属 (Maecolaspis spp.)、アカピロウドコガネ (Maladera castanea)、メガセリス属 (Megascelis spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、メロロンタ属 (Melolontha spp.)、マイオクロウス・アルマツス (Myochrous armatus)、オリカエフィルス属 (Orycaephilus spp.)、オチオリンクス属 (Otiorynchus spp.)、フィロファガ属 (Phyllophaga spp.)、フリクチヌス属 (Phlyctinus spp.)、ポピリア属 (Popillia spp.)、プシリオデス属 (Psylliodes spp.)、リソマツス・アウブチリス (Rhyssomatus aubtilis)、リゾベルタ属 (Rhizopertha spp.)、コガネムシ科 (Scarabeidae)、シトフィルス属 (Sitophilus spp.)、シトトルガ属 (Sitotroga spp.)、ソマチカス属 (Somaticus spp.)、スフェノフォラス属 (Sphenophorus spp.)、ステルネクススプ・シグナツス (Sternechus subsignatus)、ゴミムシダマシ属 (Tenebrio spp.)、トリボリウム属 (Tribolium spp.) 及びトロゴデルマ属 (Trogoderma spp.) ;

双翅目 (Diptera) から、例えばヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (Antherigona soccata)、オリーブミバエ (Bactrocea oleae)、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、ブラジシア属 (Bradysia spp.)、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、セラチチス属 (Ceratitis spp.)、オビキンバエ属 (Chrysomyia spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、クテレブラ属 (Cuterebra spp.)、ダクス属 (Dacus spp.)、デリア属 (Delia spp.)、キイロショウジョウバエ (Drosophila melanogaster)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ガストロフィルス属 (Gastrophilus spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (Geomyza tripunctata)、ツェツェバエ属 (Glossina spp.)、ヒフバエ属 (Hypoderma spp.)、ヒツポボスカ属 (Hyppobosca spp.)、リリオミザ属 (Liriomyza spp.)、キンバエ属 (Lucilia spp.)、メラナグロミザ属 (Melanagromyza spp.)、イエバエ属 (Musca spp.)、ヒツジバエ属 (Oestrus spp.)、オルセオリア属 (Orseolia spp.)、キモグリバエ (Oscinella frit)、アカザモグリハナバエ (Pegomyia hyosc

10

20

30

40

50

yami)、ホルビア属(*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属(*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ(*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属(*Scatella* spp.)、キノコバエ属(*Sciara* spp.)、サシバエ属(*Stomoxys* spp.)、アブ属(*Tabanus* spp.)、タニア属(*Tannia* spp.)及びガガンボ属(*Tipula* spp.);

半翅目(Hemiptera)から、例えばアカントコリス・スカブラトル(*Acanthocoris scabrator*)、アクロステルナム属(*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ(*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ(*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・タラシナ(*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属(*Blissus* spp.)、トコジラミ属(*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントシコリス(*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属(*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ(*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス(*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属(*Dysdercus* spp.)、エデッサ属(*Edeessa* spp.)、ユースキスツス属(*Euschistus* spp.)、ヒメナガメ(*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属(*Eurygaster* spp.)、クサギカメムシ(*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス(*Horcias nobilellus*)、レプトコリス属(*Leptocoris* spp.)、メクラカメムシ属(*Lygus* spp.)、マルガロデス属(*Margarodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク(*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属(*Neomegalotomus* spp.)、タバコカスミカメムシ(*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属(*Nezara* spp.)、ニシウス・シムランズ(*Nysius simulans*)、オエバルス・インストラリス(*Oebalus insularis*)、ピエスマ属(*Piesma* spp.)、ピエゾドルス属(*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属(*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス(*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア(*Scaptocoris castanea*)、スコチノファラ属(*Scotinophara* spp.)、チアンタ属(*Thyanta* spp.)、サシガメ属(*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス(*Vatiga illudens*);

アシルトシウム・ピスム(*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属(*Adalgas* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ(*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ(*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属(*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属(*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・パロデンシス(*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコス(*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ(*Aleyrodes brassicae*)、フタテンミドリヨコバイ(*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ(*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属(*Aonidiella* spp.)、アリマキ科(*Aphididae*)、ワタアブラムシ属(*Aphis* spp.)、アスピジオツス属(*Aspidiotus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(*Aulacorthum solani*)、バクテリセラ・コッケレリ(*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属(*Bemisia* spp.)、ブラキカウズス属(*Brachycaudus* spp.)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属(*Cacopsylla* spp.)、ニンジンフタオアブラムシ(*Cavariella aegopodii* Scop.)、セロプラスタ属(*Ceroplaster* spp.)、クリソムファルス・アオニジウム(*Chrysomphalus aonidium*)、オンシツマルカイガラムシ(*Chrysomphalus dictyospermi*)、シ

10

20

30

40

50

カデラ属 (*Cicadella* spp)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp)、シカデュリナ属 (*Cicadulina* spp)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属 (*Dialeurodes* spp)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis* spp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythron eura* spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp.)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblecombei*)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp)、ヒペロミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobiasca lybica*)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes* spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* spp)、メタカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシソプテラ属 (*Neotoxoptera* sp)、ツماغロヨコバイ属 (*Nephotettix* spp.)、ニラパルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats)、オドナスピス・ルタエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Oregma lanigera* Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera* spp)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シュウダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Pseudococcus* spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus*)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、ブルビナリア・エチオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Quadraspidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum* spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Schizaphis* spp.)、シトビオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Tarophagus Proserpina*)、トキシソプテラ属 (*Toxoptera* spp)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes* spp)、トリジスカス・スポロボリ (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus* spp)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginiidia scutellaris*) ;

10

20

30

40

50

膜翅目 (Hymenoptera) から、例えばヒメハキリアリ属 (Acromyrmex)、アルゲ属 (Arge spp.)、ハキリアリ属 (Atta spp.)、セフス属 (Cephus spp.)、ジプリオン属 (Diprion spp.)、マツハバチ科 (Diprionidae)、シマトウヒハバチ (Gilpinia polytoma)、ホブロカンパ属 (Hoplocampa spp.)、ケアリ属 (Lasius spp.)、イエヒメアリ (Monomorium pharaonis)、ネオジプリオン属 (Neodiprion spp.)、シュウカクアリ属 (Pogonomyrmex spp.)、スレノプシス・インビクタ (Slenopsis invicta)、ソレノプシス属 (Solenopsis spp.) 及びベスパ属 (Vespa spp.) ;

等翅目 (Isoptera) から、例えばコプトテルメス属 (Coptotermes spp.)、コルニテルネス・クムランス (Cornitermes cumulans)、インシシテルメス属 (Incisitermes spp.)、マクロテルメス属 (Macrotermes spp.)、マストテルメス属 (Mastotermes spp.)、ミクロテルメス属 (Microtermes spp.)、ヤマトシロアリ属 (Reticulitermes spp.) ; ソレノプシス・ゲミナテ (Solenopsis geminate)

鱗翅目 (Lepidoptera) から、例えばアクレリス属 (Accleris spp.)、アドキシフィエス属 (Adoxophyes spp.)、アエゲリア属 (Aegeria spp.)、アグロティス属 (Agrotis spp.)、アラバマ・アルギラセア (Alabama argillaceae)、アミロイス属 (Amylois spp.)、アンチカルシア・ゲマトリス (Anticarsia gemmatalis)、アルチップス属 (Archips spp.)、アルギレスチア属 (Argyresthia spp.)、アルギロタエニア属 (Argyrotaenia spp.)、アウトグラファ属 (Autographa spp.)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、アフリカズイム (Busseola fusca)、スジマラダメイガ (Cadra cautella)、モモシンクイガ (Carposina nipponensis)、チロ属 (Chilo spp.)、コリストネウラ属 (Choristoneura spp.)、クリソテウチア・トピアリア (Chrysoteuchia topiaria)、ブドウホソハマキ (Clysia ambiguella)、クナファロクロシス属 (Cnaphalocrocis spp.)、クネファシア属 (Cnephasia spp.)、コチリス属 (Cochylis spp.)、コレオフォラ属 (Coleophora spp.)、コリアス・レスビア (Colias lesbia)、ワタアカキリバ (Cosmophila flava)、クラムバス属 (Crambus spp.)、ケブカノメイガ (Crociodomia binotalis)、クリプトフレビア・ロイコトレタ (Cryptophlebia leucotreta)、シダリマ・ペルスペクトリス (Cydalima perspectalis)、シジア属 (Cydia spp.)、ジアファニア・ペルスペクトリス (Diaphania perspectalis)、ジアトラエア属 (Diatraea spp.)、ジパロプシス・カスターネア (Diparopsis castanea)、エアリアス属 (Earias spp.)、エルダナ・サッカリナ (Elidana saccharina)、エフェスチア属 (Ephestia spp.)、エピノチア属 (Epinotia spp.)、エスチグメネ・アクレア (Estigmene acrea)、エチエラ・ジンキネラ (Etiella zinckinella)、ユーコスマ属 (Eucosma spp.)、ブドウホソハマキ (Eupoecilia ambiguella)、ユープロクチス属 (Euproctis spp.)、ユークソア属 (Euxoa spp.)、フェルチア・ジャクリフェリア (Feltia jaculiferia)、グラホリタ属 (Grapholita spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ (Hedya nubiferana)、ヘリオティス属 (Heliothis spp.)、ハイマダラノメイガ (Hellula undalis)、ヘルペトグラマ属 (Herpetogramma spp.)、アメリカシロヒトリ (Hyphantria

10

20

30

40

50



cunea)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ(*Lasmpalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属(*Lithocollethis* spp.)、ホソバヒメハマキ(*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス(*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属(*Lymantria* spp.)、リオネチア属(*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属(*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ(*Manduca sexta*)、ミチムナ属(*Mythimna* spp.)、ノクツア属(*Noctua* spp.)、オペロフテラ属(*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ(*Orniodes indica*)、アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属(*Pammene* spp.)、パンデミス属(*Pandemis* spp.)、マツキリガ(*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス(*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ(*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ(*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ(*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae*)、ピエリス属(*Pieris* spp.)、コナガ(*Plutella xylostella*)、プレイス属(*Prays* spp.)、シュードブルシア属(*Pseudoplusia* spp.)、ラキブルシア・ヌ(*Rachiplusia* nu)、リチア・アルピコスタ(*Richia albicosta*)、シルポファガ属(*Scirpophaga* spp.)、セサミア属(*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属(*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属(*Spodoptera* spp.)、シレプタ・デロガテ(*Sylepta derogate*)、シナンテドン属(*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア属(*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属(*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ(*Tuta absoluta*)及びスガ属(*Yponomeuta* spp.) ;

食毛目(*Mallophaga*)から、例えばダマリネア属(*Damalinae* spp.)及びケモノハジラミ属(*Trichodectes* spp.) ;

直翅目(*Orthoptera*)から、例えばゴキブリ属(*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属(*Blattella* spp.)、ケラ属(*Gryllotalpa* spp.)、マデラゴキブリ(*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属(*Locusta* spp.)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ(*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属(*Periplaneta* spp.)、スカプテリスカス属(*Scapteriscus* spp)及びコオロギ属(*Schistocerca* spp.) ;

チャタテムシ目(*Psocoptera*)から、例えばリボセリス属(*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目(*Siphonaptera*)から、例えばナガノミ属(*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属(*Ctenocephalides* spp.)及びケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅目(*Thysanoptera*)から、例えばカリオトリプス・ファセオリ(*Caliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属(*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属(*Heliothrips* spp)、ヘルシノトリプス属(*Hercinothrips* spp.)、バルテノトリプス属(*Parthenothrips* spp)、シルトトリプス・アウランチイ(*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ(*Sericothrips variabilis*)、タエニオトリプス属(*Taeniothrips* spp.)、アザミウマ属(*Thrips* spp) ;

10

20

30

40

50

シミ目 (Thysanura) から、例えばセイヨウシミ (Lepisma saccharina)。

【0860】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎若しくは根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合により、後の時点で形成される植物器官でさえこれらの有害生物から保護されたままである。

【0861】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ又はソルガムなどの穀物；テンサイ又は飼料用ビートなどのビート；果実、例えばリンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ又は液果類、例えばイチゴ、ラズベリー又はブラックベリーなどの仁果類、核果類又は柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ又はダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオ又はアメリカホドイモ (ground nut) などの油脂作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻又はジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの柑橘類の果物；ホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモン又はショウノウなどのクスノキ科 (Lauraceae) の植物；及びさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物及びラテックス植物である。

【0862】

本発明の組成物及び/又は方法は、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び/又は野菜作物にも用いられ得る。

【0863】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属 (Ageratum spp.)、アロンソア属 (Alonsoa spp.)、イチリンソウ属 (Anemone spp.)、アニソドンテア・カペンシス (Anisodonteacapsensis)、アンセミス属 (Anthemis spp.)、キンギョソウ属 (Antirrhinum spp.)、シオン属 (Aster spp.)、ペゴニア属 (Begonia spp.) (例えば、エラチオールペゴニア (Belatior)、シキザキペゴニア (B.semperflorens)、B.チューベレウクス (B.tubereux))、ブーゲンビリア属 (Bougainvillea spp.)、ブラキスコメ属 (Brachycome spp.)、アブラナ属 (Brassica spp.) (観賞植物)、カルセオラリア属 (Calceolaria spp.)、トウガラシ (Capsicum annum)、ニチニチソウ (Catharanthus roseus)、カンナ属 (Canna spp.)、ヤグルマギク属 (Centauraea spp.)、キク属 (Chrysanthemum spp.)、シネラリア属 (Cineraria spp.) (シロタエギク (C.maritime))、ハルシャギク属 (Coreopsis spp.)、クラッスラ・コッキネア (Crassulacoccinea)、クフエア・イグネア (Cupheaignea)、ダリア属 (Dahlia spp.)、デルフィニウム属 (Delphinium spp.)、ケマンソウ (Dicentra spectabilis)、ドロテアンツス属 (Dorotheantus spp.)、トルコギキョウ (Eustoma grandiflorum)、レンギョウ属 (Forsythia spp.)、フクシア属 (Fuchsia spp.)、ゼラニウム・グナファリウム (Geranium gnaphalium)、ガーベラ属 (Gerbera spp.)、センニチコウ (Gomphrena globosa)、キダチルリソウ属 (Heliotropium spp.)、ヒマワリ属 (Helianthus spp.)、フヨウ属 (Hibiscus spp.)、アジサイ属 (H

10

20

30

40

50

ortensia spp.)、アジサイ属 (Hydrangea spp.)、ソバカス  
 ソウ (Hypoestes phyllostachya)、ツリフネソウ属 (Impa  
 tiens spp.) (アフリカホウセンカ (I. Walleriana))、イレシ  
 ネ属 (Iresines spp.)、カラコエ属 (Kalanchoe spp.)、  
 ランタナ (Lantana camara)、ハナアオイ (Lavatera trime  
 stris)、カエンキセワタ (Leonotis leonurus)、ユリ属 (Li  
 lium spp.)、メセンブリアンテマ属 (Mesembryanthemum sp  
 p.)、ミゾホオズキ属 (Mimulus spp.)、ヤグルマハッカ属 (Monar  
 da spp.)、ネメシア属 (Nemesia spp.)、タゲテス属 (Tagete  
 s spp.)、ナデシコ属 (Dianthus spp.) (カーネーション)、カンナ  
 属 (Canna spp.)、カタバミ属 (Oxalis spp.)、ヒナギク属 (Be  
 llis spp.)、テンジクアオイ属 (Pelargonium spp.) (アイビ  
 ーゼラニウム (P. peltatum)、モンテンジクアオイ (P. Zonale))、  
 スミレ属 (Viola spp.) (パンジー)、ペチュニア属 (Petunia spp  
 .)、フロックス属 (Phlox spp.)、プレクトランサス属 (Plecthra  
 nthus spp.)、ポインセチア種 (Poinsettia spp.)、ツタ属 (P  
 arthenocissus spp.) (アメリカツタ (P. quinquefol  
 ia)、ツタ (P. tricuspidata))、サクラソウ属 (Primula s  
 pp.)、キンボウゲ属 (Ranunculus spp.)、ツツジ属 (Rhodod  
 endron spp.)、バラ属 (Rosa spp.) (バラ)、オオハンゴンソウ属  
 (Rudbeckia spp.)、セントポーリア属 (Saintpaulia spp  
 .)、アキギリ属 (Salvia spp.)、ブルーファンフラワー (Scaevola  
 aemola)、コチヨウソウ (Schizanthus wisetonensis)  
 、マンネングサ属 (Sedum spp.)、ナス属 (Solanum spp.)、サフ  
 ィニア種 (Surfinia spp.)、タゲテス属 (Tagetes spp.)、タ  
 バコ属 (Nicotinia spp.)、バーベナ種 (Verbena spp.)、ヒ  
 ャクニチソウ属 (Zinnia spp.) 及び他の花壇用の植物。

#### 【0864】

例えば、本発明は、以下の野菜種のいずれかに使用され得る：ネギ属 (Allium  
 spp.) (ニンニク (A. sativum)、タマネギ (A. cepa)、エシャロ  
 ット (A. oschaninii)、リーキ (A. Porrum)、シャロット (A. a  
 scalonicum)、ネギ (A. fistulosum)、チャービル (Anth  
 riscus cerefolium)、セロリ (Apium graveolus)、ア  
 スパラガス (Asparagus officinalis)、テンサイ (Beta vu  
 lgarus)、アブラナ属 (Brassica spp.) (ヤセイカンラン (B. O  
 leracea)、ハクサイ (B. Pekinensis)、カブ (B. rapa))、  
 トウガラシ (Capsicum annuum)、ヒヨコマメ (Cicer ariet  
 inum)、エンダイブ (Cichorium endivia)、キクニガナ属 (Cic  
 horum spp.) (チコリー (C. intybus)、エンダイブ (C. endi  
 via))、スイカ (Citrillus lanatus)、キュウリ属 (Cucum  
 is spp.) (サフラン (C. sativus)、メロン (C. melo))、カボ  
 チャ属 (Cucurbita spp.) (ペポカボチャ (C. pepo)、西洋カボチ  
 ヤ (C. maxima))、チョウセンアザミ属 (Cyanara spp.) (アーテ  
 イチョーク (C. scolymus)、カルドン (C. cardunculus))、黒  
 人参 (Daucus carota)、フェンネル (Foeniculum vulgare)、  
 オトギリソウ属 (Hypericum spp.)、レタス (Lactuca sa  
 tiva)、トマト属 (Lycopersicon spp.) (トマト (L. escu  
 lentum)、トマト (L. lycopersicum))、ハッカ属 (Mentha  
 spp.)、バジル (Ocimum basilicum)、パセリ (Petrosel  
 inum crispum)、インゲンマメ属 (Phaseolus spp.) (インゲ

10

20

30

40

50

ンマメ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*)、エンドウ (*Pisum sativum*)、ハツカダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属 (*Rosemarinus* spp.)、アキギリ属 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、ノヂシャ属 (*Valerianella* spp.) (ノヂシャ (*V. locusta*)、イタリアンコーンサラダ (*V. eriocarpa*) ) 及びソラマメ (*Vicia faba*)。

#### 【0865】

好ましい観賞植物種としては、セントポーリア (*African violet*)、ベゴニア属 (*Begonia*)、ダリア属 (*Dahlia*)、ガーベラ属 (*Gerbera*)、アジサイ属 (*Hydrangea*)、クマツヅラ属 (*Verbena*)、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア (*Poinsettia*)、シオン属 (*Aster*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、ハルシャギク属 (*Coreopsis*)、デルフィニウム属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、オオハンゴンソウ属 (*Rudbeckia*)、マンネングサ属 (*Sedum*)、ペチュニア属 (*Petunia*)、スミレ属 (*Viola*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens*)、フウロソウ属 (*Geranium*)、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア属 (*Fuchsia*)、アキギリ属 (*Salvia*)、アジサイ属 (*Hortensia*)、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリ (*St. Johnswort*)、ミント、ピーマン、トマト及びキュウリが挙げられる。

#### 【0866】

本発明に係る有効成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物におけるマメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る有効成分は、さらに、マメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは野菜中)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモ中) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネ中) を防除するのに特に好適である。

#### 【0867】

本発明に係る有効成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る有効成分は、さらに、マメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは野菜中)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモ中) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネ中) を防除するのに特に好適である。

#### 【0868】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性、半内部寄生性及び外部寄生性線虫)、特にネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyn e hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incogn*

10

20

30

40

50

ita)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) 種; シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種; ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*) 及び他のヘテロデラ属 (*Heterodera*) 種; タネコブセンチュウ、アングナ属 (*Anguina*) 種; クキセンチュウ 10  
 及びハセンチュウ、アフエレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) 種; 刺毛センチュウ (*Sting nematode*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) 及び他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) 種; マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 及び他のバーサフエレンカス属 (*Bursaphelenchus*) 種; ワセンチュウ (*Ring nematode*)、クリコネマ属 (*Criconema*) 種、クリコネメラ属 (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス属 (*Criconemoides*) 種、メソクリコネマ属 (*Mesocriconema*) 種; クキ及びリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 及び他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) 種; キリセンチュウ (*Awl nematode*)、ドリコドルス属 (*Dolichodorus*) 種; ラセンセンチュウ (*Spiral nematode*)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) 及び他のヘリオコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) 種; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種及びヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoides*) 種; ヒルスマンニエラ属 (*Hirshmanniella*) 種; ヤリセンチュウ (*Lance nematode*)、ホプロライムス (*Hoploaimus*) 種; ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) 種; ハリセンチュウ (*Needle nematode*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロンギドルス属 (*Longidorus*) 種; ピンセンチュウ (*Pin nematode*)、プラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種; ネグサレセンチュウ (*Lesion nematode*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・カービタツス (*Pratylenchus curvitatatus*)、プラチレンクス・ゴオデイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のプラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種; ネモグリセンチュウ (*Burrowing nematode*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のラドホルス属 (*Radopholus*) 種; ニセフクロセンチュウ (*Reniform nematode*)、ロチレンクス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・レニフォルミス (*Rotylenchus reniformis*) 及び他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種; スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種; ミハリセンチュウ (*Stubby root nematode*)、トリコドルス・プリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種; イシュクセンチュウ (*Stunt nematode*)、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種; ミカンセンチュウ (*Citrus nema* 20  
 30  
 40  
 50

tode)、チレンクルス属(*Tylenchulus*)種;オオハリセンチュウ(*Dagger nematode*)、キシフィネマ属(*Xiphinema*)種などの植物寄生性線虫;並びにスバングナ属(*Subanguina spp.*)、ヒブソペリン属(*Hypsoperine spp.*)、マクロポストニア属(*Macroposthonia spp.*)、メリニウス属(*Melinius spp.*)、プンクトデラ属(*Punctodera spp.*)及びキニスルシウス属(*Quinisulcius spp.*)などの他の植物寄生性線虫種による植物及び植物の部分への攻撃を防除する方法にも関する。特に、線虫種、ネコブセンチュウ属(*Meloidogyne*)の種(サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*))、シストセンチュウ属(*Heterodera*)の種(テンサイシストセンチュウ(*Heterodera schachtii*))、ロチレンクス属(*Rotylenchus*)の種及びネグサレセンチュウ属(*Pratylenchus*)の種を本発明の化合物によって防除することができる。

#### 【0869】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。軟体動物の例としては、例えば、スクミリンゴガイ科(*Ampullariidae*);アリオン属(*Arion*)(コウラクロナメクジ(*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス*(*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス*(*A. hortensis*)、*A. ルーフアス*(*A. rufus*));オナジマイマイ科(*Bradybaenidae*)(ブラジバエナ・フルチクム(*Bradybaena fruticum*));オウシュウマイマイ属(*Cepaea*) (ニワノオウシュウマイマイ(*C. hortensis*)、モリマイマイ(*C. nemoralis*));オクロジナ(*Ochlodina*);デロセラス属(*Deroceras*)(*D. アグレスチス*(*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム*(*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ*(*D. laeve*)、*D. レチクラツム*(*D. reticulatum*));ディスクス属(*Discus*)(*D. ロツンダツス*(*D. rotundatus*));ユーオムファリア属(*Euomphalia*);ガルバ属(*Galba*)(*G. トルンクラタ*(*G. trunculata*));ヘリセリア属(*Helicella*)(*H. イタラ*(*H. itala*)、*H. オブヴィア*(*H. obvia*));マイマイ科(*Helicidae*)ヘリシゴナ・アルブストルム(*Helicigona arbustorum*));ヘリコディスクス属(*Helicodiscus*);ヘリクス属(*Helix*)(*H. アペルタ*(*H. aperta*));リマックス属(*Limax*)(*L. シネレオニゲル*(*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ*(*L. flavus*)、*チャコウラナメクジ*(*L. marginatus*)、*マダラコウラナメクジ*(*L. maximus*)、*L. テネルス*(*L. tenellus*));モノアラガイ属(*Lymnaea*);ミラックス属(*Milax*)(*ニワコウラナメクジ*(*M. gagates*)、*M. マルギナツス*(*M. marginatus*)、*M. ソウエルビー*(*M. sowerbyi*));オペアス属(*Opeas*);リンゴガイ属(*Pomacea*)(*スクミリンゴガイ*(*P. canaticulata*));ミジンマイマイ属(*Valtonia*)及びザニトイデス属(*Zanitoidea*)が挙げられる。

#### 【0870】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特にバチルス属(*Bacillus*)の細菌に由来する公知のような1つ又は複数の選択的に作用する毒素を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

#### 【0871】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌(*Bacillus cereus*)又はバチルス・ポピリエ(*Bacillus popilliae*)に由来する殺虫タンパク質;又は - エンドトキシン、例えば *Cry1Ab*、*Cry1Ac*、*Cry1F*、*Cry1Fa2*、*Cry2Ab*、*Cry3A*、*Cry3Bb1*又は*Cry9C*など、バチルス・チューリンゲンシス(*Bacillus*

10

20

30

40

50

t h u r i n g i e n s i s ) に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質 ( V i p )、例えば V i p 1、V i p 2、V i p 3 又は V i p 3 A；又は細菌コロニー形成線虫、例えばフォトラブダス・ルミネセンス ( P h o t o r h a b d u s l u m i n e s c e n s )、キセノラブダス・ネマトフィルス ( X e n o r h a b d u s n e m a t o p h i l u s ) などのフォトラブダス属 ( P h o t o r h a b d u s s p p . 又はキセノラブダス属 ( X e n o r h a b d u s s p p . ) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素；ストレプトマイセス属 ( S t r e p t o m y c e t e s ) 毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ - R I P、アブリン、ルフィン、サポリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 ( R I P )；3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - U D P - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、H M G - C O A - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

10

#### 【 0 8 7 2 】

本発明に関して、 - エンドトキシンは、例えば、C r y 1 A b、C r y 1 A c、C r y 1 F、C r y 1 F a 2、C r y 2 A b、C r y 3 A、C r y 3 B b 1 若しくは C r y 9 C 又は植物性殺虫タンパク質 ( V i p )、例えば V i p 1、V i p 2、V i p 3 又は V i p 3 A、また明確にハイブリッド毒素、切断毒素及び改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより産生される (例えば、国際公開第 0 2 / 1 5 7 0 1 号を参照されたい)。切断毒素、例えば切断 C r y 1 A b が公知である。改変毒素の場合、天然毒素の 1 つ又は複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が毒素に挿入され、例えば C r y 3 A 0 5 5 の場合、カテプシン - G - 認識配列が C r y 3 A 毒素に挿入される (国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号を参照されたい)。

20

30

#### 【 0 8 7 3 】

このような毒素又はこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第 0 3 7 4 7 5 3 号明細書、国際公開第 9 3 / 0 7 2 7 8 号、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号、欧州特許出願公開第 0 4 2 7 5 2 9 号明細書、欧州特許出願公開第 4 5 1 8 7 8 号明細書及び国際公開第 0 3 / 0 5 2 0 7 3 号に開示されている。

#### 【 0 8 7 4 】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。C r y I 型のデオキシリボ核酸及びそれらの調製は、例えば、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号、欧州特許出願公開第 0 3 6 7 4 7 4 号明細書、欧州特許出願公開第 0 4 0 1 9 7 9 号明細書及び国際公開第 9 0 / 1 3 6 5 1 号から公知である。

40

#### 【 0 8 7 5 】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫 ( 鞘翅目 ( C o l e o p t e r a ) )、双翅昆虫 ( 双翅目 ( D i p t e r a ) ) 及び蛾 ( 鱗翅目 ( L e p i d o p t e r a ) ) において特に一般的に見られる。

#### 【 0 8 7 6 】

殺虫剤耐性 ( i n s e c t i c i d a l r e s i s t a n c e ) をコードし、1 つ又は複数の毒素を発現する 1 つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であ

50

り、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、Yield Gard (登録商標) (Cry 1 Ab 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Rootworm (登録商標) (Cry 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Plus (登録商標) (Cry 1 Ab 及び Cry 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Starlink (登録商標) (Cry 9 C 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (Cry 1 Fa 2 毒素及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシン N - アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現するトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (Cry 1 Ac 毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry 1 Ac 毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry 1 Ac 及び Cry 2 Ab 毒素を発現するワタ品種) ; VipCot (登録商標) (Vip 3 A 及び Cry 1 Ab 毒素を発現するワタ品種) ; NewLeaf (登録商標) (Cry 3 A 毒素を発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) 、 Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA 21 グリホサート耐性形質) 、 Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt 11 アワノメイガ (C B) 形質) 及び Protecta (登録商標) である。

#### 【0877】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は、以下のとおりである：

1 . Syngenta Seeds SAS (Chemin de l 'Hobit 27 , F - 31 790 St . Sauveur , France) 製の Bt 11 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。切断 Cry 1 Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 11 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

#### 【0878】

2 . Syngenta Seeds SAS (Chemin de l 'Hobit 27 , F - 31 790 St . Sauveur , France) 製の Bt 176 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。Cry 1 Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 176 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

#### 【0879】

3 . Syngenta Seeds SAS (Chemin de l 'Hobit 27 , F - 31 790 St . Sauveur , France) 製の MIR 604 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。改変 Cry 3 A 毒素のトランスジェニック発現によって耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン - G - プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾された Cry 3 A 055 である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製は、国際公開第 03 / 018810 号に記載されている。

#### 【0880】

4 . Monsanto Europe S . A . (270 - 272 Avenue de Tervuren , B - 1150 Brussels , Belgium) 製の MON 863 トウモロコシ、登録番号 C / DE / 02 / 9。MON 863 は、Cry 3 B b 1 毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

#### 【0881】

5 . Monsanto Europe S . A . (270 - 272 Avenue de Tervuren , B - 1150 Brussels , Belgium) 製の IPC 53

10

20

30

40

50



1ワタ、登録番号C/E S/96/02。

【0882】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry 1F及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

【0883】

7. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603 × MON 810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603及びMON 810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603 × MON 810トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属 (Agrobacterium sp.) 菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPS及びヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (Lepidoptera) に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリンゲンシス亜種クルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られるCry 1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

【0884】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>) にも記載されている。

【0885】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい) など、選択的作用を有する抗病原性物質を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95/33818号及び欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0886】

作物は、真菌 (例えば、フザリウム属 (Fusarium)、炭疽病又はフィトフトラ属 (Phytophthora))、細菌 (例えば、シュードモナス属 (Pseudomonas)) 又はウイルス性 (例えば、ジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス) 病原体に対する耐性を高めるためにも改良され得る。

【0887】

作物は、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものも含む。

【0888】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は、当技術分野において公知である他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

【0889】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4又はKP6毒素；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP；例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい)；微生物によって産生

10

20

30

40

50

される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質又は複素環式抗生物質（例えば、国際公開第95/33818号を参照されたい）又は植物病原体防御に關与するタンパク質又はポリペプチド因子（国際公開第03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

【0890】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料（木材及び織物など）、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

【0891】

本発明は、有害生物（蚊及び他の病原媒介動物など；[http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)も参照されたい）を防除する方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除する方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面のIRS（屋内残留噴霧）施用が本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

10

【0892】

一実施形態において、このような有害生物を防除する方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面又は基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井又は床面などの表面におけるIRS施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

20

【0893】

処理されるべき不織布、布帛又は網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布若しくは羊毛などの天然繊維又はポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号又は国際公開第2007/090739号から公知である。

30

【0894】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

40

【0895】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（*Lepidoptera*）及び鞘翅目（*Coleoptera*）の木材穿孔性（*wood-boring*）昆虫に対して、特に以下の表A及びBに列挙される木材穿孔性昆虫（*woodborer*）に対して特に好適である。

【0896】

## 【表 3】

表A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例。

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アオナガタマムシ( <i>Agrilus planipennis</i> )	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	アノプラ・グラブリペンニス( <i>Anoplua glabripennis</i> )	広葉樹
キクイムシ科 (Scolytidae)	サクキクイムシ( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> )	広葉樹
	クスノキオオキクイムシ( <i>X. mutilatus</i> )	広葉樹
	マツノキクイムシ( <i>Tomicus piniperda</i> )	針葉樹

10

【 0 8 9 7 】

20

30

40

50

【表 4 - 1】

表B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例。

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス( <i>Agrilus anxius</i> )	カバノキ
	アグリルス・ポリツス( <i>Agrilus politus</i> )	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ( <i>Agrilus sayi</i> )	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス( <i>Agrilus vittaticollis</i> )	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、サービスベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカエデ、サクラランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、サービスベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	テキサニア・カンペストリス( <i>Texania campestris</i> )	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
	ゴエス・プルベルレンツス( <i>Goes pulverulentus</i> )	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤナギ、クロガシワ、アメリカキレハガシワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス( <i>Goes tigrinus</i> )	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーム(Eastern hophornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハリグワ、サッサfras、ライラック、マウンテン・マホガニー、セイヨウナシ、サクラランボ、プラム、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ
	ネオプチコデス・トリリネツス( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)

10

20

30

40

50

【表 4 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
	オベレア・オセラータ( <i>Oberea ocellata</i> )	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ( <i>Oberea tripunctata</i> )	ハナミズキ、ガマズミ属( <i>Viburnum</i> )、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ( <i>Oncideres cingulata</i> )	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属( <i>Eucalyptus</i> )、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サペルダ・カルカラタ( <i>Saperda calcarata</i> )	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス( <i>Strophiona nitens</i> )	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアヌス( <i>Corthylus columbianus</i> )	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリプス・リミナリス( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プレイノス( <i>Pseudopityophthorus pruinosis</i> )	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム( <i>Chickasaw plum</i> )、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランズ( <i>Paranthrene simulans</i> )	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス( <i>Sannina urocæiformis</i> )	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ( <i>Synanthedon exitiosa</i> )	モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ

10

20

30

40

50

【表 4 - 3】

科	種	寄生される宿主又は作物
	シナンテドン・ピクチペス ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア ( <i>Synanthedon rubrofascia</i> )	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ( <i>Synanthedon scitula</i> )	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属( <i>Viburnum</i> )、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリスチフォルミス ( <i>Vitacea polistiformis</i> )	ブドウ

10

## 【0898】

本発明は、例えば、甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ(ground pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ(southern chinch bug)及び地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

20

## 【0899】

特に、本発明は、地虫(コガネカブト属(*Cyclocephala* spp.)(例えば、マスクドコガネムシ(masked chafer)、*C. lurida*))、リゾトログス属(*Rhizotrogus* spp.)(例えば、ヨーロピアンコガネムシ、*R. majalis*)、コチヌス属(*Cotinus* spp.)(例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属(*Popillia* spp.)(例えば、マメコガネ(Japanese beetle)、*P. japonica*)、フィロファガ属(*Phyllophaga* spp.)(例えば、コガネムシ(May/June beetle))、アテニウス属(*Ataenius* spp.)(例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス(*Black turfgrass ataenius*)、*A. spretulus*)、マラデラ属(*Maladera* spp.)(例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea*)及びトマルス属(*Tomarus* spp.)など)、ワタフキカイガラムシ(マルガロデス属(*Margarodes* spp.))、ケラ(タウニー(tawny)、サウザン(southern)及び短翅型;スカプテリスクス属(*Scapteriscus* spp.))、ケラ(*Gryllotalpa africana*)及びレザージャケット(leather jacket)(ヨーロピアンクレーンフライ(*European crane fly*)、ガガンボ属(*Tipula* spp.))を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

30

40

## 【0900】

本発明は、ヨトウムシ(ツマジロクサヨトウ(*Spodoptera frugiperda*)及び一般的なヨトウムシ(common armyworm)(プセウダレチア・ウニプンクタ(*Pseudaletia unipuncta*)など)、ネキリムシ、ゾウムシ(スフェノホルス属(*Sphenophorus* spp.))、シバオサゾウム

50

シ (*S. venatus verstitus*) 及び *S. parvulus* など) 及びソッドウェブワーム (*sod webworm*) (クラムプス属 (*Crambus spp.*) 及び熱帯ソッドウェブワーム (*tropical sod webworm*)、ケナシクロオビクロノメイガ (*Herpetogramma phaeopteralis*) など) を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

#### 【0901】

本発明は、ヒメコガネナガカメムシ (サウザンキンクバグ、ブリスス・インスラリス (*Blissus insularis*) など)、ギョウギシバ (*Bermudagrass*) のダニ (エリオフィエス・シノドニエンシス (*Eriophyes cynodoniensis*))、アフリカヒゲシバ (*rhodesgrass*) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (*Antonina graminis*))、2本線のあるアワフキムシ (*two-lined spittlebug*) (プロサピア・ビシンクタ (*Prospapia bicincta*))、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (*Noctuidae*)) 及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

#### 【0902】

本発明は、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (*Solenopsis invicta*) など、芝草の他の有害生物を防除するのにも使用され得る。

#### 【0903】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (*hard tick*)、ヒメダニ (*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (*licking*) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

#### 【0904】

このような寄生生物の例は、以下のとおりである：

シラミ目 (*Anoplurida*) のうち：ブタジラミ属 (*Haematopinus spp.*)、ホソジラミ属 (*Linognathus spp.*)、ペディクルス属 (*Pediculus spp.*) 及びケジラミ属 (*Phtirus spp.*)、ソレノポテス属 (*Solenopotes spp.*)。

#### 【0905】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) のうち：トリメノボン属 (*Trimenopon spp.*)、タンカクハジラミ属 (*Menopon spp.*)、トリノトン属 (*Trinoton spp.*)、ボビコラ属 (*Bovicola spp.*)、ウェルネッキエラ属 (*Werneckiella spp.*)、レピケントロン属 (*Lepikentron spp.*)、ダマリナ属 (*Damalina spp.*)、トリコデクテス属 (*Trichodectes spp.*) 及びフェリコラ属 (*Felicola spp.*)。

#### 【0906】

双翅目 (*Diptera*) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (*Nematocetrina*) 及び短角亜目 (*Brachycerina*) のうち、例えばヤブカ属 (*Aedes spp.*)、ハマダラカ属 (*Anopheles spp.*)、イエカ属 (*Culex spp.*)、ブヨ属 (*Simulium spp.*)、ツノマユブヨ属 (*Eusimulium spp.*)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus spp.*)、ルツオミヤ属 (*Lutzomyia spp.*)、キュリコイデス属 (*Culicoides spp.*)、メクラアブ属 (*Chrysops spp.*)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra spp.*)、キイロアブ属 (*Atylotus spp.*)、アブ属 (*Tabanus spp.*)、ゴマフアブ属 (*Haematopota spp.*)、フィリボミア属 (*Philipomyia spp.*)、ブラウラ属 (*Braula spp.*)、イエバエ属 (*Musca spp.*)、トゲアシメマトイ属 (*Hydrotaea spp.*)、サシバエ属 (*Stomoxys spp.*)、ヘマトビア属 (*Haematobia sp*

10

20

30

40

50

p. )、モレリア属 (*Morellia* spp. )、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp. )、ツェツェバエ属 (*Glossina* spp. )、オオクロバエ属 (*Calliphora* spp. )、キンバエ属 (*Lucilia* spp. )、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp. )、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp. )、ニクバエ属 (*Sarcophaga* spp. )、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp. )、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp. )、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp. )、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp. )、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp. ) 及びヒツジシラミバエ属 (*Meiophagus* spp. )。

#### 【0907】

10

ノミ目 (*Siphonapterida*) のうち、例えばヒトノミ属 (*Pulex* spp. )、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp. )、ネズミノミ属 (*Xenopsylla* spp. )、ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp. )。

#### 【0908】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えばトコジラミ属 (*Cimex* spp. )、サシガメ属 (*Triatoma* spp. )、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp. )、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp. )。

#### 【0909】

ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 及びスベラ属 (*Supella* spp. )。

20

#### 【0910】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) 並びにマダニ亜目 (*Metastigmata*) 及び中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えばナガヒメダニ属 (*Argas* spp. )、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp. )、オトビウス属 (*Otobius* spp. )、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp. )、キラマダニ属 (*Amblyomma* spp. )、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp. )、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp. )、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp. )、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp. )、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp. )、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp. )、ライリエチア属 (*Raillietia* spp. )、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp. )、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp. ) 及びバロア属 (*Varroa* spp. )。

30

#### 【0911】

ダニ目 (*Actiniedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) 及びカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えばアカラピス属 (*Acarapis* spp. )、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp. )、オルニソケイレチア属 (*Ornithocheyletia* spp. )、ミオピア属 (*Myobia* spp. )、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates* spp. )、ニキビダニ属 (*Demodex* spp. )、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp. )、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp. )、コナダニ属 (*Acarus* spp. )、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp. )、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp. )、ヒポデクテス属 (*Hypodectes* spp. )、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp. )、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp. )、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp. )、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp. )、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp. )、ショウセンコウヒゼンダニ属 (*Notoedres* spp. )、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp. )、シト

40

50



ジテス属 (*Cytodites* spp.) 及びラミノシオプテス属 (*Laminosiptes* spp.)。

【0912】

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適である。

【0913】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイ  
エカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・ブクタクム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Prionobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテスルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キシルボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sinoxylon spec.*) 及びチビタケナガシクイムシ (*Dinoderus minutus*) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) 及びウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (hymenopteran) 並びにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kaloterme flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptoterme brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heteroterme indicola*)、キアシシロアリ (*Reticuliterme flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticuliterme santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticuliterme lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastoterme darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) 及びイエシロアリ (*Coptoterme formosanus*) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。

【0914】

本発明に係る化合物は、非修飾形態で有害生物防除剤として使用され得るが、それらは、一般に、担体、溶媒及び表面活性物質などの製剤化補助剤を用いて、様々な方法で組成物に製剤化される。製剤は、様々な物理的形態、例えば粉剤、ゲル、水和剤、水和性粒剤、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油乳剤、油性フロアブル剤、水性分散液、油性分散液、サスボエマルジョン、カプセル懸濁剤、乳化性粒剤、可溶性液体、水溶性濃縮物 (担体として水又は水混和性有機溶媒を含む)、含浸ポリマーフィルムの形態又は例えば the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知の他の形態であり得る。このよ

うな製剤は、直接使用されるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量栄養素、生物有機体、油又は溶媒を用いて行われ得る。

#### 【0915】

製剤は、微粉化された固体、粒剤、液剤、分散液又は乳剤の形態の組成物を得るために、例えば有効成分を製剤化補助剤と混合することによって調製され得る。有効成分は、微粉化された固体、鉱油、植物若しくは動物由来の油、植物若しくは動物由来の変性油、有機溶媒、水、表面活性物質又はそれらの組合せなどの他の補助剤と共に製剤化され得る。

#### 【0916】

有効成分は、微細なマイクロカプセル中に含有され得る。マイクロカプセルは、多孔質担体中に有効成分も含有する。これにより、有効成分を制御された量で環境中に放出させることができる（例えば、持続放出）。マイクロカプセルは、通常、 $0.1 \sim 500 \mu\text{m}$ の直径を有する。マイクロカプセルは、カプセル重量の約25～95重量%の量で有効成分を含有する。有効成分は、モノリシック固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入用の膜は、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリ尿素、ポリウレタン又は化学修飾ポリマー及びデンプンキサンテート又は当業者に公知の他のポリマーを含み得る。代わりに、有効成分が基剤の固体マトリクス中に微粉化された粒子の形態で含まれた微細なマイクロカプセルが形成され得るが、このマイクロカプセル自体は封入されない。

#### 【0917】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤は、それ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る：水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、炭酸ブチレン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール(diproxitol)、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 $\alpha$ -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 $\gamma$ -ブチロラクトン、グリセロール、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、酸化メシチル、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、乳酸プロピル、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、ベルクロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノールなどのより高い分子量のアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチル-2-ピロリドンなど。

#### 【0918】

好適な固体担体は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石粘土、シリカ、アタパルジャイト粘土、珪藻土、石灰石、炭酸カルシウム、ペントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿実殻、小麦粉、大豆粉、軽石、木粉、粉碎されたクルミ殻、リグニン及び同様の物質である。

#### 【0919】

多くの表面活性物質は、固体及び液体製剤の両方中、特に使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性又はポリマーであり得、それらは、乳化剤、湿潤剤又は懸濁化剤として又は他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなど、硫酸アルキルの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなど、アルキルアリールスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなど、アルキルフェノール／アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなど、アルコール／アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなど、アルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ(2-エチルヘキシル)スルホスクシネートなど、スルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第4級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなど、脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノ-及びジ-アルキルリン酸エステルの塩；並びにさらに例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載されているさらなる物質が挙げられる。

#### 【0920】

殺有害生物製剤に使用され得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁化剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸収剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整物質及び緩衝液、腐食防止剤、香料、湿潤剤、吸収向上剤、微量栄養素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられる。

#### 【0921】

本発明に係る組成物は、植物若しくは動物由来の油、鉱油、このような油のアルキルエステル又はこのような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に、施用される混合物を基準にして、0.01～10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉱油又は植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体又は魚油若しくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、C<sub>8</sub>～C<sub>22</sub>脂肪酸のアルキルエステル、特にC<sub>12</sub>～C<sub>18</sub>脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル(それぞれラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル)を含む。多くの油誘導体は、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10<sup>th</sup> Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

#### 【0922】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の、本発明の化合物及び1～99.9重量%の製剤化補助剤(これは、好ましくは、0～25重量%の表面活性物質を含む)を含む。市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化され得るが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

#### 【0923】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壌の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件並びに施用方法、施用の時期及び標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1～2000l/ha、特に10～1

10

20

30

40

50

0 0 0 1 / h a の割合で施用され得る。

【 0 9 2 4 】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量％）。

乳化性濃縮物：

有効成分：1～95％、好ましくは60～90％

表面活性剤：1～30％、好ましくは5～20％

液体担体：1～80％、好ましくは1～35％

【 0 9 2 5 】

ダスト剤：

有効成分：0.1～10％、好ましくは0.1～5％

固体担体：99.9～90％、好ましくは99.9～99％

【 0 9 2 6 】

懸濁液濃縮物：

有効成分：5～75％、好ましくは10～50％

水：94～24％、好ましくは88～30％

表面活性剤：1～40％、好ましくは2～30％

【 0 9 2 7 】

水和剤：

有効成分：0.5～90％、好ましくは1～80％

表面活性剤：0.5～20％、好ましくは1～15％

固体担体：5～95％、好ましくは15～90％

【 0 9 2 8 】

粒剤：

有効成分：0.1～30％、好ましくは0.1～15％

固体担体：99.5～70％、好ましくは97～85％

【 0 9 2 9 】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【 0 9 3 0 】

【表 5】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
リゲノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8モルのエチレンオキシド)	—	2 %	—
高度に分散したケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

【 0 9 3 1 】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉碎され、これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、所望の濃度の懸濁液が得られる。

【 0 9 3 2 】

10

20

30

40

50

【表 6】

乾燥種子処理用の粉剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高度に分散したケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

## 【0933】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉砕され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

## 【0934】

【表 7】

乳化性濃縮物	
有効成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4~5モルのエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35モルのエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

## 【0935】

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が水による希釈によってこの濃縮物から得られる。

## 【0936】

【表 8】

ダスト剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填剤	—	—	96 %

## 【0937】

即時使用可能なダスト剤は、担体と組み合わせて混合し、混合物を好適なミルにおいて粉砕することによって得られる。このような粉末は、種子の乾式粉衣にも使用され得る。

## 【0938】

【表 9】

押出粒剤	
有効成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

## 【0939】

この組合せは、補助剤と混合され、粉砕され、混合物は、水で濡らされる。混合物は、

押し出され、次に空気流中で乾燥される。

【 0 9 4 0 】

【表 1 0】

被覆粒剤	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(分子量200)	3 %
カオリン	89 %

【 0 9 4 1 】

この微粉化された組合せは、ミキサー中において、ポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆された粒剤が得られる。

【 0 9 4 2 】

【表 1 1】

#### 懸濁液濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15モルのエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	1 %
水	32 %

【 0 9 4 3 】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁液濃縮物が得られ、この懸濁液濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬によって微生物による寄生から保護され得る。

【 0 9 4 4 】

【表 1 2】

#### 種子処理用のフロアブル剤

有効成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノールPO/EO	2 %
10～20モルのEOを含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾー顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

【 0 9 4 5 】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁液濃縮物が得られ、この懸濁液濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬によって微生物による寄生から保護され得る。

【 0 9 4 6 】

持続放出性カプセル懸濁剤

28部のこの組合せを2部の芳香族溶媒及び7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート-混合物(8:1)と混合する。この混合物を、所望の粒度が得られるまで、1.2部のポリビニルアルコールと、0.05部の消泡剤と、51.6部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を加える。混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、28%の有効成分を含有する。カプセルの中間直径は8~15  $\mu\text{m}$ である。得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

#### 【0947】

10

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁剤(CS)、水和性粒剤(WG)、乳化性粒剤(EG)、油中水乳剤(EO)、水中油乳剤(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油性分散液(OD)、油混和性フロアブル剤(OF)、油混和性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、微量散布用懸濁剤(SU)、微量散布用液剤(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、可溶性粒剤(SG)又は農学的に許容できる補助剤と組み合わせられた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。

#### 【実施例】

#### 【0948】

調製実施例：

20

「Mp」は、融点( )を意味する。遊離基は、メチル基を表す。 $^1\text{H}$  NMR測定をBruker 400 MHz分光計で記録し、化学シフトを、TMS標準を基準としてppmで示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定した。以下のLCMS法のいずれか一方を用いて化合物を特徴付けた。各化合物について得た特徴的なLCMS値は、保持時間(「Rt」、分で記録した)及び実測の分子イオン $(\text{M} + \text{H})^+$ 又は $(\text{M} - \text{H})^-$ であった。

#### 【0949】

LCMS方法：

方法1：

スペクトルを、以下を備えるWaters製質量分析計(SQDシングル四重極型質量分析計)で記録した：エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン又は陰イオン、フルスキャン、キャピラリ：3.00 kV、コーン範囲：41 V、ソース温度：150、脱溶媒和温度：500、コーンガス流：50 L/Hr、脱溶媒和ガス流：1000 L/Hr、質量範囲：110~800 Da)及びWaters製HクラスUPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3 C18、1.8  $\mu\text{m}$ 、3.0  $\times$  2.1 mm、温度：40、DAD波長帯(nm)：210~400、溶媒勾配：A = 水 + 5%アセトニトリル + 0.1% HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% HCOOH；勾配：0分間、10% B；0.~0.2分間、10%から50% B；0.2~0.7分間、50%から100% B；0.7~1.3分間、100% B；1.3~1.4分間、100%から10% B；1.4~1.6分間、10% B；流れ(mL/分)0.6。

30

#### 【0950】

方法2：

スペクトルを、以下を備えるAgilent Technologies製の質量分光計(6410 Triple Quadrupole質量分光計)で記録した：エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン又は陰イオン、MS2スキャン、キャピラリ：4.00 kV、フラグメンタ：100 V、脱溶剤温度：350、ガス流：11 L/min、ネブライザガス：45 psi、質量範囲：110~1000 Da)及びAgilent製1200 Series HPLC：クォータリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。カラム：KINETEX EVO C18、2.6  $\mu\text{m}$ 、5.0

40

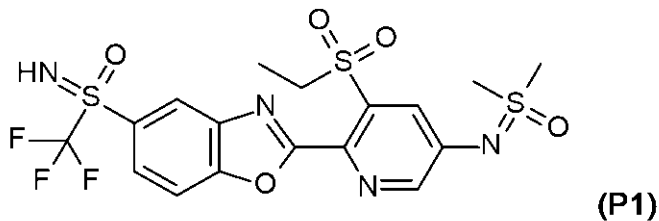
50

× 4 . 6 mm、温度：40℃、DAD波長範囲 (nm)：210～400、溶剤勾配：A = 水 + 5% アセトニトリル + 0.1% HCOOH、B = アセトニトリル + 0.1% HCOOH：勾配：0分間 0% B、100% A；0.9～1.8分間 100% B；1.8～2.2分間 100% から 10% B；2.2～2.5分間 10% B；流れ (mL/min) 1.8。

【0951】

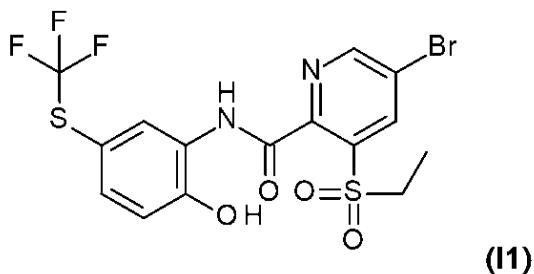
実施例 P1：[2-[5-[ジメチル(オキソ)-6-スルファニリデン]アミノ]-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オキソ-(トリフルオロメチル)-6-スルファン(化合物P1)の調製  
【化39】

10



工程1：5-ブロモ-3-エチルスルホニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ピリジン-2-カルボキサミド(中間体I1)の調製  
【化40】

20



30

0 の冷却した5-ブロモ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボン酸(CAS 2098699-89-7、国際公開第2018215304号に記載したように調製)(5.3g、18mmol)のジクロロメタン(53mL)及びDMF(1.8mL)懸濁液に、二塩化オキサリル(3.2mL、36mmol)を、シリンジを介して滴下で添加した。このように得られたオフホワイト色の懸濁液を室温で2時間攪拌した。反応塊を窒素雰囲気下で蒸発乾固し、粗5-ブロモ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボニルクロリドを得て、これを次の工程のためにそれ自体で使用した。

【0952】

0 の冷却した2-アミノ-4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェノール(CAS 228401-48-7、国際公開第2011040629号に記載したように調製)(4.5g、21mmol)のテトラヒドロフラン(20mL)溶液にN,N-ジイソプロピルエチルアミン(6.1mL、36mmol)を加え、それに続いて新たに調製した5-ブロモ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボニルクロリドのTHF(20mL)溶液を加えた。反応塊を室温で16時間攪拌し、次いで水(100mL)でクエンチし、酢酸エチル(3×80mL)で抽出した。合わせた有機層をブライン(100mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、combiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の10～15%酢酸エチル)を使用して精製し、5-ブロモ-3-エチルスルホニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチル-スルファニル)フェニル]ピリジン-2-カルボキサミドを得た。LCMS(方法1)：保持時間1.11分、485(M+H)<sup>+</sup>。

40

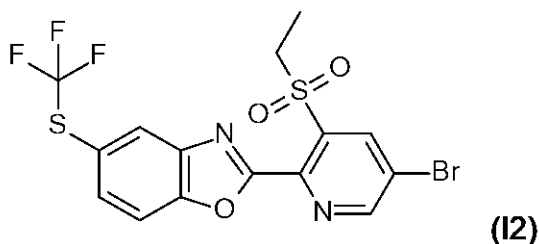
50



## 【 0 9 5 3 】

工程 2 : 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール ( 中間体 I 2 ) の調製

## 【 化 4 1 】



10

攪拌した 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - N - [ 2 - ヒドロキシ - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェニル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 上記のように調製した中間体 I 1 ) ( 4 . 5 g、9 . 3 m m o l ) の m - キシレン ( 4 5 m L ) 溶液に 4 - メチルベンゼンスルホン酸水和物 ( 1 . 6 g、9 . 3 m m o l ) を室温で加え、反応塊を 1 6 0 で 9 時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、水 ( 5 0 m L ) で希釈し、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をブライン ( 5 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 1 0 ~ 1 5 % 酢酸エチル ) を使用して精製し、2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾールを得た。

20

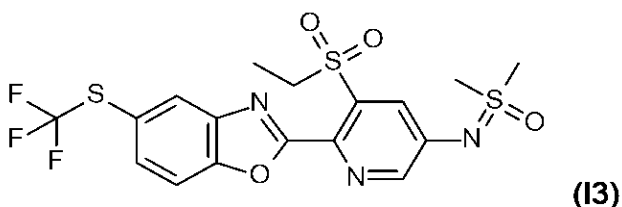
L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 2 3 分、4 7 6 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , D M S O - d <sub>6</sub> ) p p m 1 . 2 8 ( t , 3 H ) , 3 . 9 1 - 3 . 9 8 ( m , 2 H ) , 7 . 9 1 ( d d , 1 H ) , 8 . 1 0 ( d , 1 H ) , 8 . 3 8 ( d , 1 H ) , 8 . 7 4 ( d , 1 H ) , 9 . 3 0 ( d , 1 H ) .

## 【 0 9 5 4 】

工程 3 : [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] イミノ - ジメチル - オキソ - 6 - スルファン ( 中間体 I 3 ) の調製

30

## 【 化 4 2 】



2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール ( 上記のように調製した中間体 I 2 ) ( 0 . 5 9 g、1 . 2 6 m m o l ) の 1 , 4 - ジオキサン ( 5 . 0 m L ) 溶液に ( ジメタンスルフィニリデン ) アミン ( 0 . 1 3 6 g、1 . 3 8 m m o l )、炭酸セシウム ( 0 . 8 2 7 g、2 . 5 2 m m o l ) 及び ( 5 - ジフェニルホスファニル - 9 , 9 - ジメチル - キサンテン - 4 - イル ) - ジフェニル - ホスファン ( 0 . 1 5 g、0 . 2 5 m m o l ) を加えた。反応塊を窒素で 1 0 分間脱気し、これに次いで ( 1 E , 4 E ) - 1 , 5 - ジフェニルペンタ - 1 , 4 - ジエン - 3 - オン ; パラジウム ( 0 . 1 1 g、0 . 1 2 m m o l ) を加えた。反応塊を 1 1 0 で窒素雰囲気下において 3 時間還流させ、次いで水 ( 3 0 m L ) で希釈し、酢酸エチル ( 3 × 3 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル

40

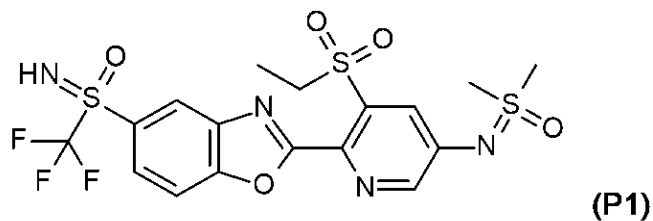
50

、ジクロロメタン中の10%メタノール)によって精製し、[[5-エチルスルホニル-6-[5-(トリフルオロメチルスルファニル)-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-<sup>6</sup>スルファンを得た。LCMS(方法1):保持時間1.05分、480(M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR(400MHz,クロロホルム-d) ppm 1.44(t,3H),3.32(s,6H),4.05(q,2H),7.68-7.75(m,2H),8.14-8.18(m,2H),8.70(d,1H)。

【0955】

工程4:[2-[5-[ジメチル(オキソ)-<sup>6</sup>-スルファニリデン]アミノ]-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オキソ-(トリフルオロメチル)-<sup>6</sup>-スルファン(化合物P1)の調製

【化43】



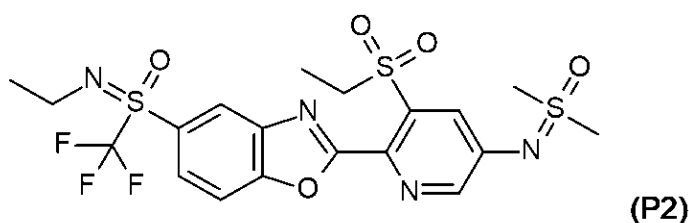
撹拌した[[5-エチルスルホニル-6-[5-(トリフルオロメチルスルファニル)-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-<sup>6</sup>-スルファン(上記のように調製した中間体I3)(0.4g、0.83mmol)の2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンタン-1-オール(7.0mL)溶液にカルバミン酸アンモニウム(0.19g、2.5mmol)、それに続いてPhI(OAc)<sub>2</sub>(1.15g、3.5mmol)を室温で加えた。反応混合物を室温で6時間撹拌した。反応塊を氷冷水(20mL)でクエンチし、酢酸エチル(3×20mL)で抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム溶液(20mL)及びブライン(20mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物をcombiflash(シリカゲル、ジクロロメタン中の10%MeOH)によって精製し、

[2-[5-[ジメチル(オキソ)-<sup>6</sup>-スルファニリデン]アミノ]-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オキソ-(トリフルオロメチル)-<sup>6</sup>-スルファンを得た。LCMS(方法1):保持時間0.91分、511(M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR(400MHz,アセトン-d<sub>6</sub>) ppm 1.32-1.41(m,3H),3.49(s,6H),3.94(q,2H),8.05(d,1H),8.16(d,1H),8.32(d,1H),8.32(d,1H),8.58-8.63(m,2H)。

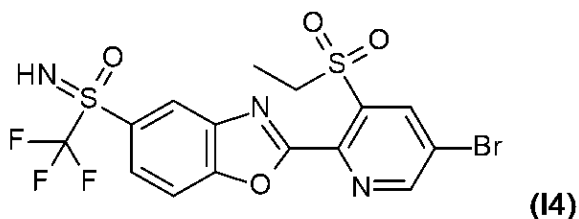
【0956】

実施例P2:[2-[5-[ジメチル(オキソ)-<sup>6</sup>-スルファニリデン]アミノ]-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-エチルイミノ-オキソ-(トリフルオロメチル)-<sup>6</sup>-スルファン(化合物P2)の調製

【化44】



工程 1 : [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾ  
オキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファン  
( 中間体 I 4 ) の調製  
【化 4 5】



10

撹拌した 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフル  
オロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール ( 上記のように調製した中間体  
I 2 ) ( 0 . 9 g 、 1 . 9 2 m m o l ) の 2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフル  
オロペンタン - 1 - オール ( 1 2 . 0 m L ) 溶液にカルバミン酸アンモニウム ( 0 . 4 6  
g 、 5 . 7 7 m m o l ) 、それに続いて P h I ( O A c ) <sub>2</sub> ( 2 . 6 5 g 、 8 . 0 9 m m o  
l ) を室温で加えた。反応混合物を室温で 1 6 時間撹拌した。反応塊を氷冷水 ( 5 0 m L  
) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナ  
トリウム溶液 ( 5 0 m L ) 及びブライン ( 5 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、  
濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロ  
ヘキサン中の 4 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、[ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスル  
ホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ -  
( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファンを得た。

20

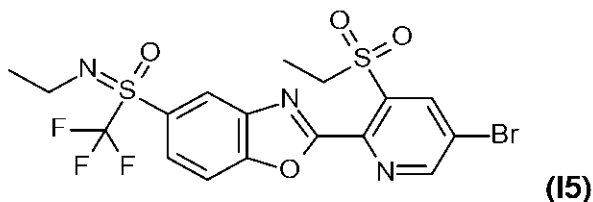
L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 0 5 分、4 9 8 ( M + H ) <sup>+</sup>。

【 0 9 5 7 】

工程 2 : [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾ  
オキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スル  
ファン ( 中間体 I 5 ) の調製

【化 4 6】

30



撹拌した [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベン  
ゾオキサゾール - 5 - イル ] - イミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファ  
ン ( 上記のように調製した中間体 I 4 ) ( 1 . 5 g 、 3 . 0 m m o l ) の N , N - ジメチ  
ルホルムアミド ( 1 5 . 0 m L ) 溶液に炭酸カリウム ( 1 . 2 g 、 9 . 0 m m o l ) 、そ  
れに続いてヨードエタン ( 7 0 0 m g 、 4 . 5 m m o l ) を加えた。反応塊を室温で 4 時  
間撹拌し、次いで氷冷水 ( 8 0 m L ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出  
した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成  
物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 4 0 % 酢酸エチル ) によっ  
て精製し、[ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベン  
ゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - ス  
ルファンを得た。

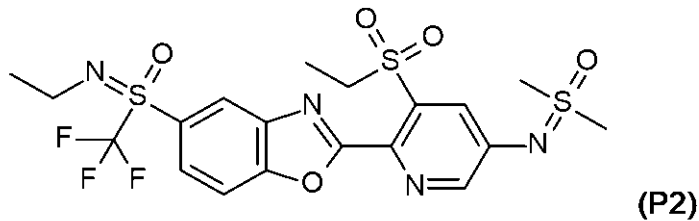
40

L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 2 1 分、5 2 6 ( M + H ) <sup>+</sup>。

50

## 【 0 9 5 8 】

工程 3 : [ 2 - [ 5 - [ [ ジメチル ( オキシ ) - 6 - スルファニリデン ] アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキシ - ( トリフルオロメチル ) - 6 - スルファン ( 化合物 P 2 ) の調製  
【 化 4 7 】



10

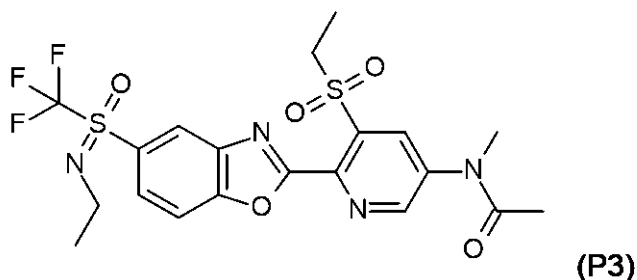
[ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキシ - ( トリフルオロメチル ) - 6 - スルファン ( 上記のように調製した中間体 I 5 ) ( 0 . 7 0 g 、 1 . 3 3 m m o l ) の 1 , 4 - ジオキサン ( 5 . 0 m L ) 溶液に ( ジメタンスルフィニリデン ) アミン ( 0 . 1 4 g 、 1 . 4 6 m m o l ) 、 炭酸セシウム ( 0 . 8 7 g 、 2 . 6 6 m m o l ) 及び ( 5 - ジフェニルホスファニル - 9 , 9 - ジメチル - キサンテン - 4 - イル ) - ジフェニル - ホスファン ( 0 . 1 5 g 、 0 . 2 6 m m o l ) を加えた。反応塊を窒素で 1 0 分間脱気し、これに次いで ( 1 E , 4 E ) - 1 , 5 - ジフェニルペンタ - 1 , 4 - ジエン - 3 - オン ; パラジウム ( 0 . 1 2 g 、 0 . 1 3 m m o l ) を加えた。反応塊を 1 1 0 で窒素雰囲気下において 3 時間還流させ、次いで水 ( 3 0 m L ) で希釈し、酢酸エチル ( 3 x 3 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、ジクロロメタン中の 1 0 % メタノール ) によって精製し、[ 2 - [ 5 - [ [ ジメチル ( オキシ ) - 6 - スルファニリデン ] アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - エチルイミノ - オキシ - ( トリフルオロメチル ) - 6 - スルファンを白色の固体として得た。L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 0 7 分、5 3 9 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d ) p p m 1 . 3 1 - 1 . 3 8 ( m , 3 H ) , 1 . 4 3 - 1 . 4 8 ( m , 3 H ) , 3 . 3 3 ( s , 6 H ) , 3 . 3 9 - 3 . 6 3 ( m , 1 H ) , 3 . 4 0 - 3 . 6 1 ( m , 1 H ) , 3 . 9 6 - 4 . 0 8 ( m , 2 H ) , 7 . 7 9 - 7 . 9 2 ( m , 1 H ) , 8 . 1 3 - 8 . 2 2 ( m , 2 H ) , 8 . 5 0 - 8 . 7 1 ( m , 2 H ) .

20

30

## 【 0 9 5 9 】

実施例 P 3 : N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - ( トリフルオロメチル ) スルホニイミドイル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド ( 化合物 P 3 ) の調製  
【 化 4 8 】

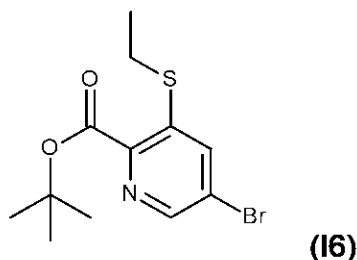


40

工程 1 : t e r t - ブチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 中間体 I 6 ) の調製

50

## 【化 4 9】

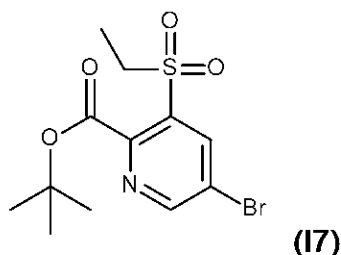


4 - ジメチルアミノピリジン ( 0 . 2 3 g、0 . 1 9 m m o l ) 及びジ - t e r t - ブチルジカーボネート ( 6 . 3 1 g、2 8 . 6 m m o l ) を、トリエチルアミン ( 4 . 0 3 m L、2 8 . 6 m m o l ) を有する 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸 ( C A S 1 8 5 7 3 6 6 - 1 3 - 2、国際公開第 2 0 1 7 0 8 4 8 7 9 号に記載したように調製) ( 5 . 0 0 g、1 9 . 1 m m o l ) のアセトニトリル ( 1 0 0 m L ) 溶液に加えた。反応混合物を 5 0 ℃で一晩加熱した。室温に冷却した後、反応混合物を水 ( 8 0 m L ) で希釈し、水相を酢酸エチル ( 3 × 1 0 0 m L ) で抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。得られた原油をシリカゲル ( シクロヘキサン中の 3 5 % 酢酸エチル ) 上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、所望の化合物を黄色の油として得た。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d )     p p m : 1 . 3 9 - 1 . 4 5 ( m , 3 H ) , 1 . 6 5 ( s , 9 H ) , 2 . 9 2 ( q , J = 7 . 3 4 H z , 2 H ) , 7 . 7 5 ( d , J = 1 . 9 6 H z , 1 H ) , 8 . 4 5 ( d , J = 1 . 9 6 H z , 1 H ) .

## 【 0 9 6 0】

工程 2 : t e r t - ブチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 中間体 I 7 ) の調製

## 【化 5 0】



3 - クロロ過安息香酸 ( 2 . 2 0 g、9 . 7 0 m m o l ) を、0 ℃の冷却した t e r t - ブチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 上記のように調製した中間体 I 6 ) ( 1 . 5 0 g、4 . 7 0 m m o l ) のジクロロメタン ( 2 7 m L ) 溶液に少しずつ加えた。反応混合物を 0 ℃で 4 0 分、次いで室温で 2 時間撹拌した。飽和チオ硫酸ナトリウム溶液 ( 1 0 m L ) 及び 1 N の水酸化ナトリウム ( 1 0 m L ) でクエンチした後、水相をジクロロメタン ( 3 × 3 0 m L ) で抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗材料をそれ以上精製することなく次の工程で使用した。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d )     p p m : 1 . 3 5 ( t , 3 H ) , 1 . 6 5 ( s , 9 H ) , 3 . 5 3 ( q , 2 H ) , 8 . 4 5 ( d , 1 H ) , 8 . 8 7 ( d , 1 H ) .

## 【 0 9 6 1】

工程 3 : t e r t - ブチル 3 - エチルスルホニル - 5 - ( メチルアミノ ) ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 中間体 I 8 ) の調製

10

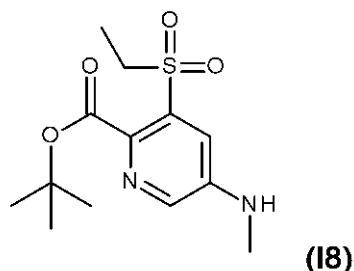
20

30

40

50

## 【化 5 1】



10

テトラヒドロフラン（４．０ｍＬ）中の *tert*-ブチル 5-ブロモ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボキシレート（上記のように調製した中間体 I 7）（１．３０ｇ、３．７０ｍｍｏｌ）、メチルアミン（水溶液中４０％）（１．０ｍＬ、１１．６ｍｍｏｌ）及び銅粉（４７ｍｇ、０．７４ｍｍｏｌ）の混合物を、密封したチューブ中において１００℃で８時間加熱した。室温に冷却した後、反応混合物を水（１０ｍＬ）でクエンチし、水相を酢酸エチル（３×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗材料を精製せずに直接使用した。ＬＣＭＳ（方法３）：保持時間１．０６分、２９９（*M*-*H*)<sup>-</sup>。

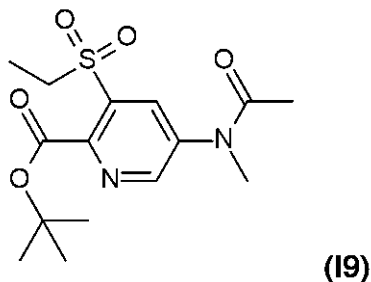
<sup>1</sup>H NMR（４００ＭＨｚ，クロロホルム-*d*）　　ppm　１．２６（*t*，*J*＝７．１５Ｈｚ，３Ｈ），１．６２（*s*，１Ｈ），２．９４（*s*，３Ｈ），３．５９（*q*，*J*＝７．４６Ｈｚ，２Ｈ），７．３９（*s*，１Ｈ），８．３（*br s*，１Ｈ）。

20

## 【 0 9 6 2】

工程４： *tert*-ブチル 5-[アセチル（メチル）アミノ]-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボキシレート（中間体 I 9）の調製

## 【化 5 2】



30

*tert*-ブチル 3-エチルスルホニル-5-(メチルアミノ)ピリジン-2-カルボキシレート（上記のように調製した中間体 I 8）（２．８８ｇ、９．５９ｍｍｏｌ）に無水酢酸（２５ｍＬ）を加え、反応塊を６０℃で２時間加熱した。反応混合物を氷水（８０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（３×６０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物をトルエン（３×２０ｍＬ）と共に同時蒸発させ、*tert*-ブチル 5-[アセチル（メチル）アミノ]-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボキシレートを固体として得た。ＬＣＭＳ（方法１）：保持時間０．９０分、２８７（*M*+*H*)<sup>+</sup>。

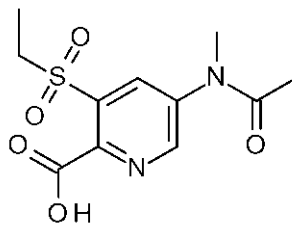
40

## 【 0 9 6 3】

工程５： 5-[アセチル（メチル）アミノ]-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-カルボン酸（中間体 I 10）の調製

50

## 【化 5 3】



(I10)

10

tert - ブチル 5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 上記のように調製した中間体 I 9 ) ( 3 . 2 g 、 9 . 3 mmol ) のジクロロメタン ( 20 mL ) 溶液、2 , 2 , 2 - トリフルオロ酢酸 ( 11 mL 、 140 mmol ) を室温において滴下で添加した。反応塊を室温で 16 時間攪拌し、次いで真空中で濃縮した。残渣をトルエンと共に 3 回同時蒸発させ、5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボン酸をオフホワイト色の固体として得て、これを次の工程のためにそれ自体で使用した。LCMS ( 方法 1 ) : 保持時間 0 . 14 分、287 ( M + H ) <sup>+</sup>。

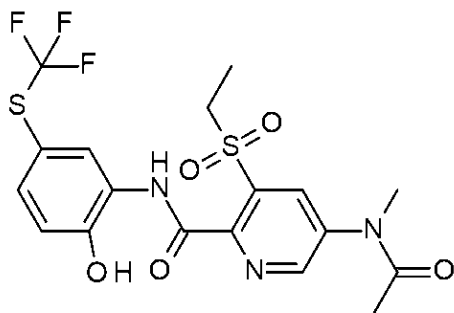
<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , DMSO - d<sub>6</sub> ) ppm 1 . 19 ( t , 3 H ) , 2 . 08 ( br s , 3 H ) , 3 . 34 ( br s , 3 H ) , 3 . 50 - 3 . 60 ( m , 2 H ) , 8 . 29 - 8 . 36 ( m , 1 H ) , 8 . 91 ( s , 1 H ) .

20

## 【 0 9 6 4 】

工程 6 : 5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - N - [ 2 - ヒドロキシ - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェニル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 中間体 I 11 ) の調製

## 【化 5 4】



(I11)

30

0 の冷却した 5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボン酸 ( 上記のように調製した中間体 I 10 ) ( 2 . 7 g 、 9 . 4 mmol ) のジクロロメタン ( 27 mL ) 及び DMF ( 0 . 94 mL ) 懸濁液に、二塩化オキサリル ( 1 . 7 mL 、 19 mmol ) を、シリンジを介して滴下で添加した。このように得られたオフホワイト色の懸濁液を室温で 2 時間攪拌した。反応塊を窒素雰囲気下で蒸発乾固し、粗 5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリドを得て、これを次の工程のためにそれ自体で使用した。

40

## 【 0 9 6 5 】

0 の冷却した 2 - アミノ - 4 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェノール ( CAS 228401 - 48 - 7 、国際公開第 2011040629 号に記載したように調製 ) ( 2 . 4 g 、 11 mmol ) のテトラヒドロフラン ( 20 mL ) 溶液に N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( 4 . 9 mL 、 28 mmol ) を加え、それに続いて新たに調製した 5 - [ アセチル ( メチル ) アミノ ] - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボ

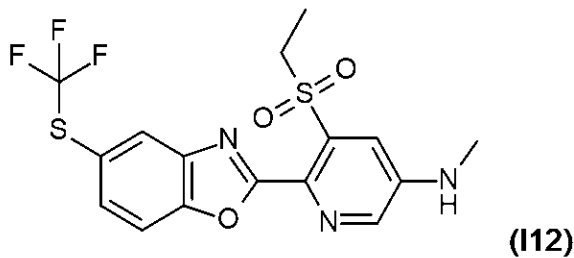
50

ニルクロリドのTHF（20 mL）溶液を加えた。反応塊を室温で16時間攪拌し、次いで水（100 mL）でクエンチし、酢酸エチル（3 × 80 mL）で抽出した。合わせた有機層をブライン（100 mL）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、combiflash（シリカゲル、ジクロロメタン中の10% MeOH）を使用して精製し、5 - [アセチル（メチル）アミノ] - 3 - エチルスルホニル - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - （トリフルオロメチルスルファニル）フェニル] ピリジン - 2 - カルボキサミドを得た。LCMS（方法1）：保持時間0.99分、478（M + H）<sup>+</sup>。

【0966】

工程7：5 - エチルスルホニル - N - メチル - 6 - [5 - （トリフルオロメチルスルファニル） - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] ピリジン - 3 - アミン（中間体I12）の調製

【化55】

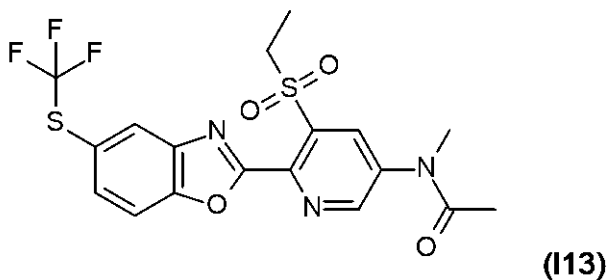


攪拌した5 - [アセチル（メチル）アミノ] - 3 - エチルスルホニル - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - （トリフルオロメチルスルファニル）フェニル] ピリジン - 2 - カルボキサミド（上記のように調製した中間体I11）（1.2 g、2.9 mmol）のm - キシレン（20 mL）溶液に4 - メチルベンゼンスルホン酸水和物（1.29 g、7.35 mmol）を室温に加え、反応塊を160 °Cで3時間、それに続いて120 °Cで16時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、水（50 mL）で希釈し、酢酸エチル（3 × 50 mL）で抽出した。合わせた有機層をブライン（50 mL）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、combiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の40%酢酸エチル）を使用して精製し、純粋な5 - エチルスルホニル - N - メチル - 6 - [5 - （トリフルオロメチルスルファニル） - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] ピリジン - 3 - アミンを得た。LCMS（方法1）：保持時間1.09分、418（M + H）<sup>+</sup>。1H NMR（400 MHz, クロロホルム - d） ppm 1.44（t, 3H）, 3.05（s, 3H）, 4.05 - 4.16（m, 2H）, 7.64 - 7.72（m, 3H）, 8.13（s, 1H）, 8.32（d, 1H）。

【0967】

工程8：N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [5 - （トリフルオロメチルスルファニル） - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル] - N - メチル - アセトアミド（中間体I13）の調製

【化56】



10

20

30

40

50

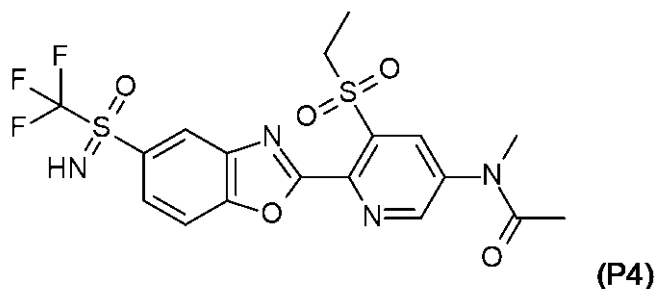


5 - エチルスルホニル - N - メチル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] ピリジン - 3 - アミン (上記のように調製した中間体 I 12) (1.5 g、3.6 mmol) に無水酢酸 (15 mL) を加え、反応塊を 60 で 2 時間加熱した。反応塊を氷水 (50 mL) で希釈し、酢酸エチル (3 × 60 mL) で抽出した。合わせた有機層をブライン (30 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物をトルエン (3 × 20 mL) と共に同時蒸発させ、N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミドをオフホワイト色の固体として得た。

LCMS (方法 1) : 保持時間 1.05 分、460 (M+H)<sup>+</sup>。1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.47 (t, 3H), 2.25 (br s, 3H), 3.51 (s, 3H), 4.09 (q, 2H), 7.73 - 7.80 (m, 2H), 8.18 - 8.21 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.98 (br s, 1H)。【0968】

工程 9 : N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 4) の調製

【化 57】



撈拌した N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド (上記のように調製した中間体 I 13) (1.2 g、2.6 mmol) の 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5 - オクタフルオロペンタン - 1 - オール (8.0 mL) 溶液にカルバミン酸アンモニウム (0.51 g、6.5 mmol)、それに続いて PhI(OAc)<sub>2</sub> (2.6 g、7.8 mmol) を室温で加えた。反応混合物を室温で 8 時間撈拌し、次いで氷冷水 (30 mL) でクエンチし、酢酸エチル (3 × 30 mL) で抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム溶液 (20 mL) 及びブライン (20 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 60% 酢酸エチル) によって精製し、N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - (トリフルオロメチルスルホンイミドイル) - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミドを得た。

LCMS (方法 1) : 保持時間 0.92 分、491 (M+H)<sup>+</sup>。1H NMR (400 MHz, DMSO - d<sub>6</sub>) ppm 1.26 - 1.32 (m, 3H), 2.19 (br s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.93 (q, 2H), 7.11 (s, 1H), 8.25 - 8.31 (m, 2H), 8.56 (d, 1H), 8.63 - 8.65 (m, 1H), 9.15 (d, 1H)。

【0969】

工程 10 : N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - (トリフルオロメチル) スルホンイミドイル ] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 3) の調製

10

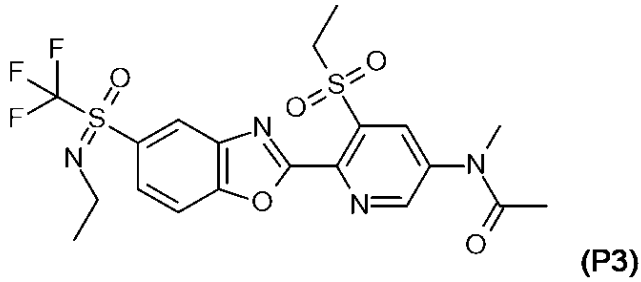
20

30

40

50

## 【化 5 8】



10

攪拌した N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミド ( 上記のように調製した化合物 P 4 ) ( 0 . 1 1 g 、 0 . 2 3 m m o l ) の N , N - ジメチルホルムアミド ( 3 . 0 m L ) 溶液に炭酸カリウム ( 0 . 0 9 g 、 0 . 7 0 m m o l ) 、それに続いてヨードエタン ( 0 . 0 5 g 、 0 . 3 5 m m o l ) を加えた。反応塊を室温で 3 時間攪拌し、次いで氷冷水 ( 2 0 m L ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 2 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 6 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、N - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - ( トリフルオロメチル ) スルホンイミドイル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - N - メチル - アセトアミドを得た。

20

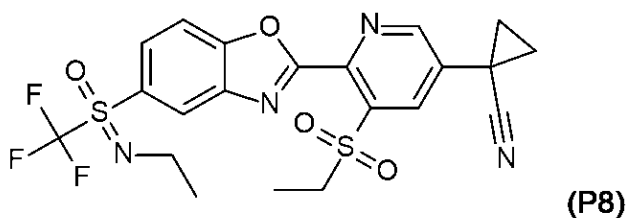
L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 0 6 分、5 1 9 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , D M S O - d 6 ) p p m 1 . 2 3 - 1 . 3 2 ( m , 6 H ) , 2 . 1 9 ( b r s , 3 H ) , 3 . 3 7 - 3 . 5 1 ( m , 5 H ) , 3 . 9 3 ( q , 2 H ) , 8 . 2 4 - 8 . 3 2 ( m , 2 H ) , 8 . 5 6 ( d , 1 H ) , 8 . 6 4 ( d , 1 H ) , 9 . 1 5 ( d , 1 H ) 。

## 【 0 9 7 0 】

実施例 P 8 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - ( トリフルオロメチル ) スルホンイミドイル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 化合物 P 8 ) の調製

30

## 【化 5 9】

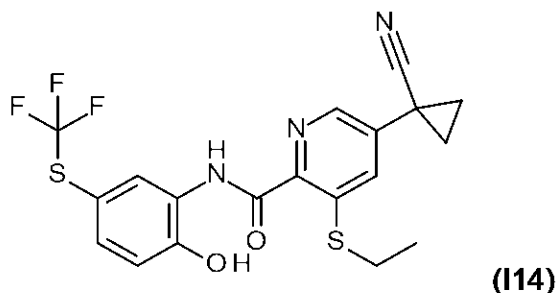


工程 1 : 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ヒドロキシ - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェニル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 中間体 I 1 4 ) の調製

40

50

## 【化 6 0】



10

0 の冷却した 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸 ( C A S 2 2 2 5 1 1 3 - 7 7 - 7、国際公開第 2 0 1 8 1 0 8 7 2 6 号に記載したように調製 ) ( 3 . 0 0 g、1 2 . 1 m m o l ) のジクロロメタン ( 3 0 m L ) 及び D M F ( 1 . 2 1 m L ) 懸濁液に、二塩化オキサリル ( 2 . 1 3 m L、2 4 . 2 m m o l ) を、シリンジを介して滴下で添加した。このように得られたオフホワイト色の懸濁液を室温で 2 時間撹拌した。反応塊を窒素雰囲気下で蒸発乾固し、粗 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリドを得て、これを次の工程のためにそれ自体で使用した。

## 【 0 9 7 1】

20

0 の冷却した 2 - アミノ - 4 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェノール ( C A S 2 2 8 4 0 1 - 4 8 - 7、国際公開第 2 0 1 1 0 4 0 6 2 9 号に記載したように調製 ) ( 2 . 8 g、1 3 m m o l ) のテトラヒドロフラン ( 3 0 m L ) 溶液に N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( 3 . 9 m L、2 2 m m o l ) を加え、それに続いて新たに調製した 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリド ( 3 . 0 g、1 1 m m o l ) の T H F ( 5 0 m L ) 溶液を加えた。反応塊を室温で 1 6 時間撹拌し、次いで水 ( 1 0 0 m L ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をブライン ( 1 0 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 1 0 ~ 1 5 % 酢酸エチル ) を使用して精製し、5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ヒドロキシ - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェニル ] ピリジン - 2 - カルボキサミドを得た。L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 0 6 分、4 4 0 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , D M S O - d 6 ) p p m 1 . 3 2 ( t , 3 H ) , 1 . 7 4 - 1 . 8 5 ( m , 2 H ) , 1 . 8 5 - 1 . 9 3 ( m , 2 H ) , 3 . 0 4 ( q , 2 H ) , 7 . 0 6 ( d , 1 H ) , 7 . 3 3 ( d d , 1 H ) , 7 . 6 9 ( d , 1 H ) , 8 . 3 9 ( d , 1 H ) , 8 . 6 9 ( d , 1 H ) , 1 0 . 4 8 ( s , 1 H ) , 1 1 . 2 6 ( s , 1 H ) .

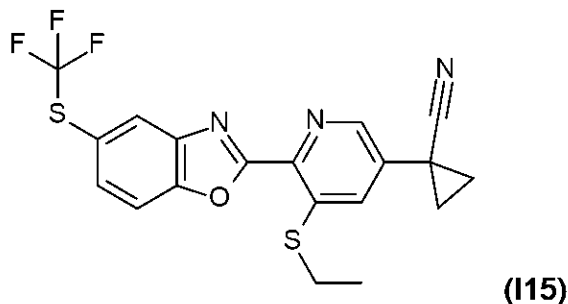
30

## 【 0 9 7 2】

工程 2 : 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 中間体 I 1 5 ) の調製

40

## 【化 6 1】



10

攪拌した 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ヒドロキシ - 5 - ( トリフルオロメチル - スルファニル ) フェニル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 上記のように調製した中間体 I 1 4 ) ( 3 . 1 0 g、7 . 0 5 m m o l ) の m - キシレン ( 3 0 m L ) 溶液に 4 - メチルベンゼンスルホン酸水和物 ( 1 . 2 4 g、7 . 0 5 m m o l ) を室温で加え、反応塊を 1 6 0 で 9 時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、水 ( 5 0 m L ) で希釈し、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をブライン ( 5 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 1 0 ~ 1 5 % 酢酸エチル ) を使用して精製し、純粋な 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを得た。L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 1 4 分、4 2 2 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d ) p p m 1 . 4 9 - 1 . 5 4 ( m , 3 H ) , 1 . 6 0 - 1 . 6 6 ( m , 2 H ) , 1 . 9 2 - 1 . 9 9 ( m , 2 H ) , 3 . 1 2 ( q , 2 H ) , 7 . 7 0 - 7 . 7 6 ( m , 2 H ) , 7 . 7 9 - 7 . 8 6 ( m , 1 H ) , 8 . 2 5 - 8 . 3 3 ( m , 2 H ) .

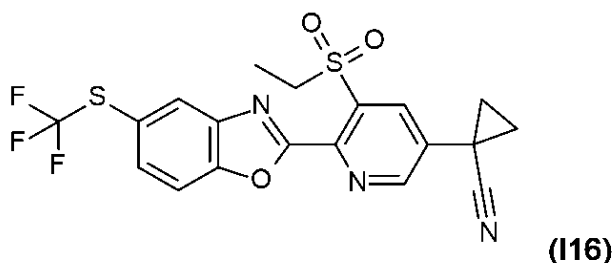
20

## 【 0 9 7 3 】

工程 3 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 中間体 I 1 6 ) の調製

30

## 【化 6 2】



40

0 の冷却した 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した中間体 I 1 5 ) ( 2 . 2 0 g、5 . 2 2 m m o l ) のジクロロメタン ( 4 4 . 0 m L ) 溶液に 3 - クロロベンゼンカルボペルオキシ酸 ( 2 . 5 7 g、1 0 . 4 m m o l ) を加えた。反応塊を室温にし、4 時間攪拌し、次いで 2 M の水酸化ナトリウム溶液 ( 7 0 m L ) でクエンチし、ジクロロメタン ( 3 × 1 0 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 4 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカ

50

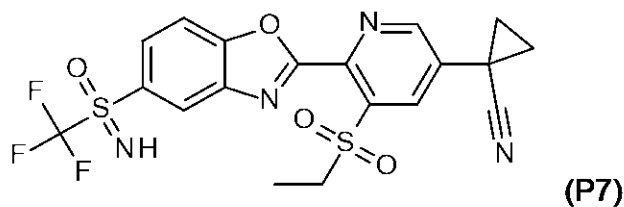
ルボニトリルを白色の固体として得た。

L C M S (方法 1) : 保持時間 1 . 1 1 分、4 5 4 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d ) p p m 1 . 4 5 ( t , 3 H ) , 1 . 6 2 - 1 . 7 3 ( m , 2 H ) , 1 . 9 9 - 2 . 0 8 ( m , 2 H ) , 4 . 0 7 ( q , 2 H ) , 7 . 2 7 ( s , 1 H ) , 7 . 7 3 - 7 . 8 1 ( m , 2 H ) , 8 . 1 9 ( s , 1 H ) , 8 . 3 2 ( d , 1 H ) , 9 . 0 6 ( d , 1 H ) .

【 0 9 7 4 】

工程 4 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 化合物 P 7 ) の調製

【 化 6 3 】

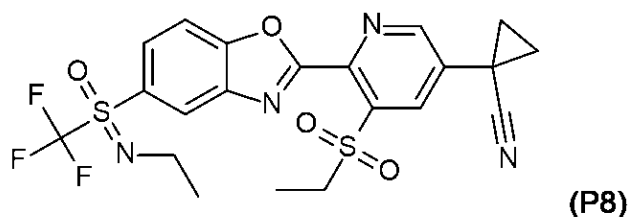


撹拌した 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した中間体 I 1 6 ) ( 1 . 0 g 、 2 . 2 m m o l ) の 2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフルオロペンタン - 1 - オール ( 7 . 0 m L ) 溶液にカルバミン酸アンモニウム ( 0 . 4 4 g 、 5 . 5 m m o l ) 、それに続いて P h I ( O A c ) <sub>2</sub> ( 2 . 2 g 、 6 . 6 m m o l ) を室温で加えた。反応混合物を室温で 1 6 時間撹拌し、次いで氷冷水 ( 5 0 m L ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 5 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム溶液 ( 5 0 m L ) 及びブライン ( 5 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 3 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを得た。L C M S ( 方法 1 ) : 保持時間 1 . 0 0 分、4 8 5 ( M + H ) <sup>+</sup>。1 H N M R ( 4 0 0 M H z , D M S O - d 6 ) p p m 1 . 2 3 - 1 . 3 3 ( m , 3 H ) , 1 . 9 1 - 2 . 0 8 ( m , 4 H ) , 3 . 9 5 ( q , 2 H ) , 7 . 1 2 ( s , 1 H ) , 8 . 2 5 - 8 . 3 3 ( m , 2 H ) , 8 . 4 3 ( d , 1 H ) , 8 . 6 6 ( s , 1 H ) , 9 . 0 4 ( d , 1 H ) .

【 0 9 7 5 】

工程 5 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - ( トリフルオロメチル ) スルホンイミドイル ] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 化合物 P 8 ) の調製

【 化 6 4 】

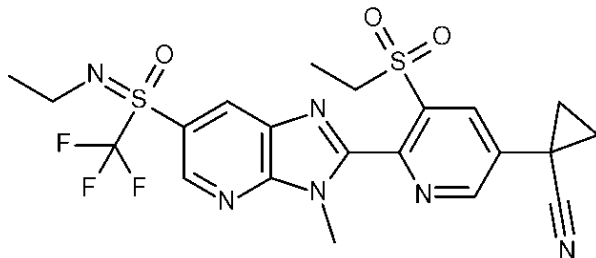


撹拌した 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカル

ルボニトリル（上記のように調製した化合物 P 7）（0.16 g、0.33 mmol）の N, N - ジメチルホルムアミド（2.0 mL）溶液に炭酸カリウム（0.13 g、0.99 mmol）、それに続いてヨードエタン（0.07 g、0.49 mmol）を加えた。反応塊を室温で 4 時間攪拌し、次いで氷冷水（2.0 mL）でクエンチし、酢酸エチル（3 × 20 mL）で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を combiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の 30% 酢酸エチル）によって精製し、1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [5 - [N - エチル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS（方法 1）：保持時間 1.19 分、513 (M + H)<sup>+</sup>。1H NMR (400 MHz, DMSO - d<sub>6</sub>) ppm 1.23 - 1.33 (m, 6H), 1.92 - 2.07 (m, 4H), 3.35 - 3.52 (m, 2H), 3.95 (q, 2H), 8.25 - 8.33 (m, 2H), 8.43 (d, 1H), 8.65 (s, 1H), 9.04 (d, 1H)。【0976】

10

実施例 P 20：1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [6 - [N - エチル - S - (トリフルオロメチル)スルホンイミドイル] - 3 - メチル - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル（化合物 P 20）の調製【化 6 5】

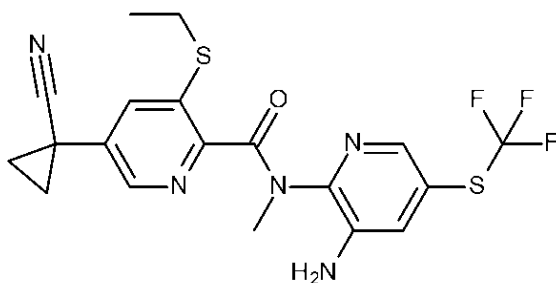


(P20)

20

工程 1：N - [3 - アミノ - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 2 - ピリジル] - 5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - N - メチル - ピリジン - 2 - カルボキサミド（中間体 I 17）の調製【化 6 6】

30



(I17)

40

5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸（CAS 2225113 - 77 - 7、国際公開第 2018 / 108726 号に記載したように調製）（3.17 g、12.8 mmol）のジクロロメタン（28.5 mL）及び触媒 DMF 懸濁液に、二塩化オキサリル（2.05 mL、23 mmol）を、シリンジを介して室温において滴下で添加した。このように得られた反応塊を室温で 1 時間攪拌した。反応塊を窒素雰囲気下で蒸発乾固し、粗 5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリドを得て、これを次の工程のためにそれ自体で使用した。

【0977】

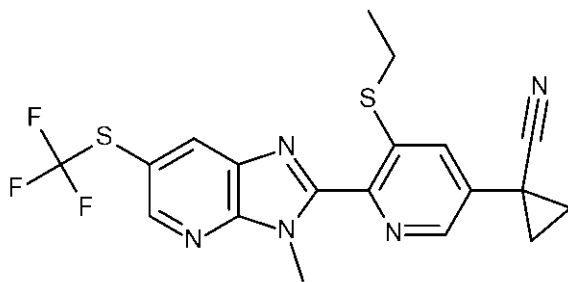
50

0 の冷却した N 2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル)ピリジン - 2 , 3 - ジアミン (CAS 1383840-73-0) (2.99 g、13.4 mmol) のテトラヒドロフラン (63.4 mL) 溶液にトリエチルアミン (4.13 mL、29.4 mmol) を加え、それに続いて新たに調製した 5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリドのテトラヒドロフラン (19 mL) 溶液を加えた。反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、次いで真空中で濃縮した。粗化合物を炭酸水素ナトリウム水溶液で塩基性化し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮し、N - [ 3 - アミノ - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 2 - ピリジル ] - 5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - N - メチル - ピリジン - 2 - カルボキサミドを得た。この粗材料を次の工程のためにそれ自体で使用した。LCMS (方法 2) : 保持時間 1.54 分、454 (M + H)<sup>+</sup>。

【0978】

工程 2 : 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ [ 4 , 5 - b ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ]シクロプロパンカルボニトリル (中間体 I 18) の調製

【化 67】



(I18)

酢酸 (62 mL) 中の N - [ 3 - アミノ - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 2 - ピリジル ] - 5 - (1 - シアノシクロプロピル) - 3 - エチルスルファニル - N - メチル - ピリジン - 2 - カルボキサミド (上記のように調製した中間体 I 17) (6.24 g、13.77 mmol) の混合物を 130 で 4 時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、真空中で濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で塩基性化し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗化合物を、combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 40 % 酢酸エチル) を使用して精製し、純粋な 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ [ 4 , 5 - b ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ]シクロプロパンカルボニトリルを得た。LCMS (方法 1) : 保持時間 1.19 分、436 (M + H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 1.40 (t, 3H), 1.59 - 1.62 (m, 2H), 1.92 - 1.95 (m, 2H), 3.01 (q, 2H), 4.05 (s, 3H), 7.75 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.68 (s, 1H)。

【0979】

工程 3 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ [ 4 , 5 - b ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ]シクロプロパンカルボニトリル (中間体 I 19) の調製

10

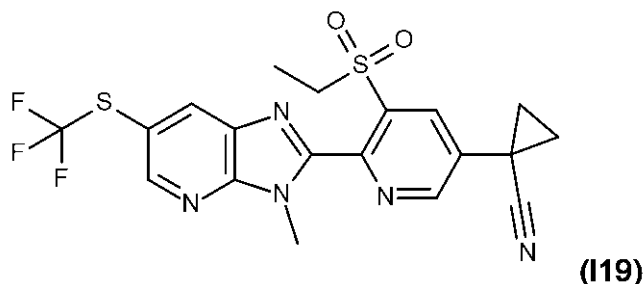
20

30

40

50

## 【化 6 8】



10

0 の冷却した 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した中間体 I 1 8 ) ( 3 . 5 4 g 、 8 . 1 3 m m o l ) のジクロロメタン ( 7 0 . 0 m L ) 溶液に 3 - クロロベンゼンカルボペルオキシ酸 ( 4 . 2 1 g 、 1 7 . 1 m m o l ) を加えた。反応混合物を室温に温め、2 時間攪拌し、次いで 2 M の水酸化ナトリウム溶液でクエンチし、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 4 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS ( 方法 2 ) : 保持時間 1 . 5 5 分、4 6 8 ( M + H ) <sup>+</sup>。 <sup>1</sup> H N M R ( 4 0 0 M H z , C D C l <sub>3</sub> ) p p m 1 . 3 8 ( t , 3 H ) , 1 . 6 7 - 1 . 6 9 ( m , 2 H ) , 2 . 0 1 - 2 . 0 7 ( m , 2 H ) , 3 . 8 6 - 3 . 9 3 ( m , 5 H ) , 8 . 2 6 ( d , 1 H ) , 8 . 3 8 ( d , 1 H ) , 8 . 7 2 ( d , 1 H ) , 9 . 0 5 ( d , 1 H ) .

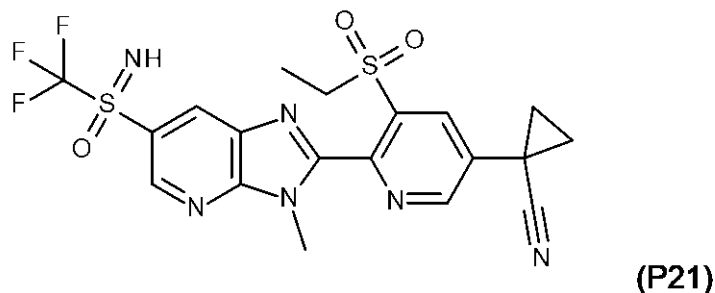
20

## 【 0 9 8 0】

工程 4 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルホニイミドイル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 化合物 P 2 1 ) の調製

## 【化 6 9】

30



攪拌した 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した中間体 I 1 9 ) ( 2 . 4 4 g 、 5 . 2 2 m m o l ) の 2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフルオロペンタン - 1 - オール ( 2 5 . 0 m L ) 溶液にカルバミン酸アンモニウム ( 1 . 2 5 g 、 5 . 5 m m o l ) 、それに続いて ( ジアセトキシヨード ) ベンゼン P h I ( O A c ) <sub>2</sub> ( 4 . 2 9 g 、 1 3 . 0 m m o l ) を室温に加えた。反応混合物を室温で 1 5 時間攪拌し、次いで氷冷水でクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液及びブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 3 0 % 酢酸エチル ) によって精製し、それに続いて分取 H P L C ( カラム A t l a n t i s T 3 P r e p O B D ( 商標 ) 、カラム長

40

50

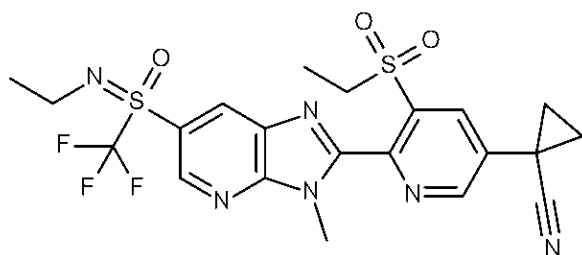


さ 150 mm、内径 19 mm、粒径 5  $\mu$ m、0.1%トリフルオロ酢酸を含有するアセトニトリル及び水の混合物を使用して精製し、1-[5-エチルスルホニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルホンイミドイル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを得た。LCMS (方法1): 保持時間 0.94 分、499 (M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm 1.23 (t, 3H), 1.90-2.06 (m, 4H), 3.77-3.87 (m, 5H), 7.20 (br s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.84 (d, 1H), 9.04 (d, 1H), 9.11 (d, 1H)。

【0981】

工程5: 1-[5-エチルスルホニル-6-[6-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物P20)の調製

【化70】



(P20)

撹拌した1-[5-エチルスルホニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルホンイミドイル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(上記のように調製した化合物P21)(0.30 g、0.60 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(3.0 mL)溶液に炭酸カリウム(0.24 g、1.85 mmol)、それに続いてヨードエタン(0.14 g、0.90 mmol)を加えた。反応混合物を室温で4時間撹拌し、次いで氷冷水でクエンチし、酢酸エチル(2×25 mL)で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物をcombiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の30%酢酸エチル)によって精製し、1-[5-エチルスルホニル-6-[6-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS (方法1): 保持時間 1.13 分、527 (M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 1.38 (dt, 6H), 1.68-1.71 (m, 2H), 2.04-2.08 (m, 2H), 3.44-3.61 (m, 2H), 3.84-3.92 (m, 5H), 8.26 (d, 1H), 8.74 (d, 1H), 9.06 (d, 1H), 9.14 (d, 1H)。

【0982】

実施例P32: 1-[5-エチルスルホニル-6-[5-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物P32)の調製

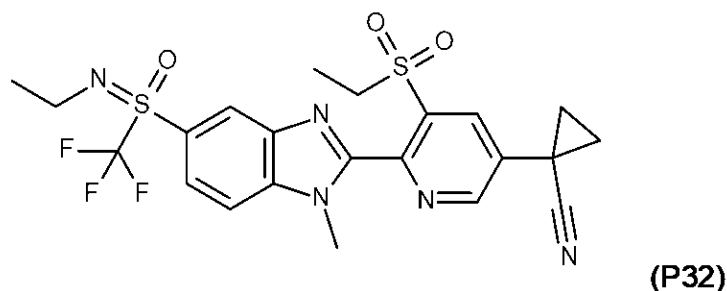
10

20

30

40

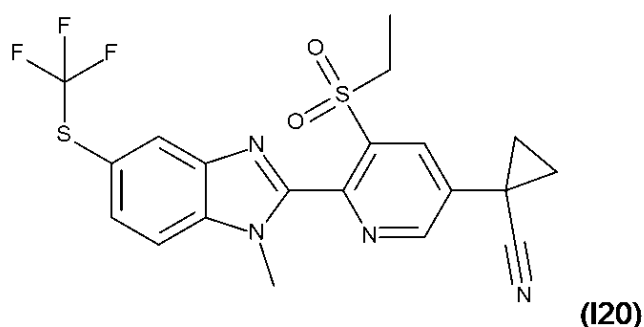
## 【化 7 1】



10

工程 1：1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (中間体 I 20) の調製

## 【化 7 2】



20

5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - カルボン酸 ( CAS 1879106 - 82 - 7、国際公開第 2016 / 071214 号に記載したように調製 ) ( 0.50 g、1.78 mmol ) のニトロベンゼン ( 4 mL ) 溶液に N 1 - メチル - 4 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンゼン - 1, 2 - ジアミン ( CAS 1383840 - 98 - 9 ) ( 0.476 g、2.14 mmol )、それに続いて塩化ホスホリル ( 0.420 mL、4.46 mmol ) を室温において滴下で添加した。反応混合物を 160 で 6 時間、それに続いて 120 で 16 時間撹拌した。完了後、反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 ( 50 mL ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 50 mL ) で抽出した。合わせた有機層をブライン ( 50 mL ) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空中で濃縮した。粗生成物を combiflash ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 35 % 酢酸エチル ) によって精製し、1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを茶色の固体として得た。LCMS ( 方法 1 ) : Rt = 1.10 分、m/z = 468 ( M + H )<sup>+</sup>。

30

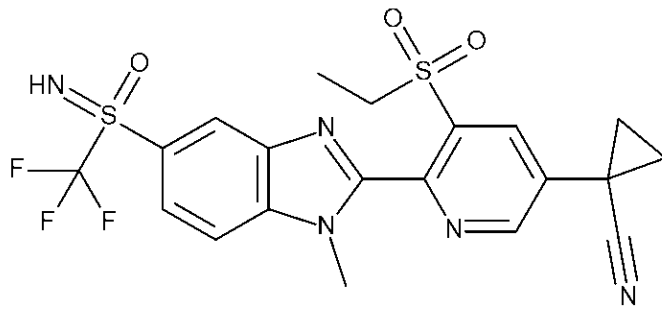
## 【0983】

40

工程 2：1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルホニイミドイル) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 33) の調製

50

## 【化 7 3】



(P33)

10

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した中間体 I 2 0 ) ( 1 . 0 0 g 、 2 . 1 4 m m o l ) の 2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 5 , 5 - オクタフルオロペンタン - 1 - オール ( 1 0 m L ) 溶液にカルバミン酸アンモニウム ( 0 . 4 2 7 g 、 5 . 3 6 m m o l ) 、それに続いて ( ジアセトキシヨード ) ベンゼン ( 2 . 1 1 g 、 6 . 4 3 m m o l ) を室温で加えた。反応混合物を室温で 1 6 時間攪拌し、次いで氷冷水 ( 5 0 m L ) でクエンチし、酢酸エチル ( 3 × 1 0 0 m L ) で抽出した。合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム溶液 ( 5 0 m L ) 、それに続いてブライン ( 5 0 m L ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の 3 5 % 酢酸エチル ) によって精製し、1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS ( 方法 1 ) : R t = 0 . 9 5 分、m / z = 4 9 8 ( M + H ) <sup>+</sup>。 <sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , C D C l <sub>3</sub> ) p p m 1 . 3 8 ( t , 3 H ) , 1 . 6 2 - 1 . 7 4 ( m , 2 H ) , 1 . 9 9 - 2 . 0 8 ( m , 2 H ) , 3 . 6 6 ( s , 1 H ) , 3 . 8 5 ( s , 3 H ) , 3 . 8 5 - 3 . 9 4 ( m , 2 H ) , 7 . 6 7 ( d , 1 H ) , 8 . 1 6 ( d , 1 H ) , 8 . 2 4 ( d , 1 H ) , 8 . 6 4 ( s , 1 H ) , 9 . 0 6 ( d , 1 H ) .

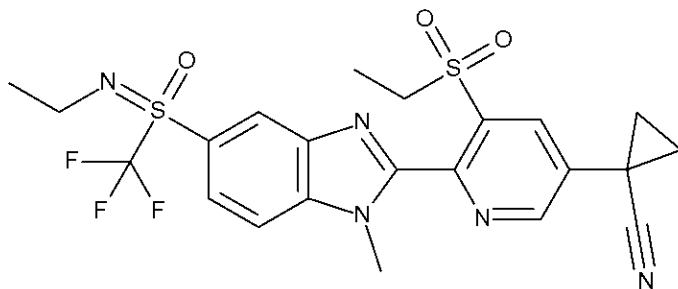
20

30

## 【 0 9 8 4 】

工程 3 : 1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 5 - [ N - エチル - S - ( トリフルオロメチル ) スルホンイミドイル ] - 1 - メチル - ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 化合物 P 3 2 ) の調製

## 【化 7 4】



(P32)

40

1 - [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 1 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチルスルホンイミドイル ) ベンゾイミダゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 上記のように調製した化合物 P 3 3 ) ( 0 . 2 2 g 、 0 . 4 4 2 m m o l ) の N , N - ジメチルホルムアミド ( 2 . 0 m L ) 溶液に炭酸カリウム ( 0 . 1 8 g 、 1 . 3 2 m m o l ) 、それに続いてヨードエタン ( 0 . 1 0 g 、 0 . 6 6 m m o l ) を加えた。反

50

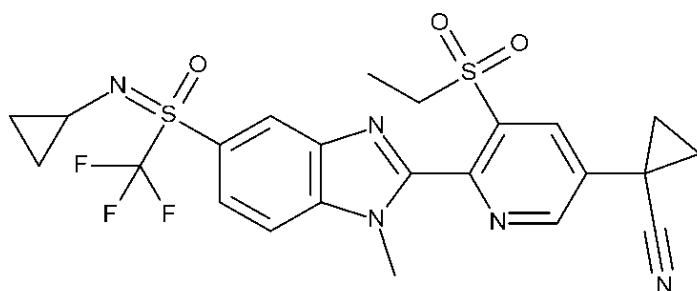
応塊を室温で16時間攪拌し、次いで氷冷水でクエンチし、酢酸エチル(2×20mL)で抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。粗生成物をcombiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の30%酢酸エチル)によって精製し、1-[5-エチルスルホニル-6-[5-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS(方法1): Rt=1.10分、m/z=526(M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 1.32-1.41(m, 6H), 1.63-1.72(m, 2H), 2.01-2.07(m, 2H), 3.41-3.64(m, 2H), 3.83(s, 3H), 3.83-3.94(m, 2H), 7.63(d, 1H), 8.11(d, 1H), 8.24(d, 1H), 8.57(s, 1H), 9.05(d, 1H)。

10

【0985】

実施例P31: 1-[6-[5-[N-シクロプロピル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-5-エチルスルホニル-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(化合物P31)の調製

【化75】



(P31)

20

1-[5-エチルスルホニル-6-[1-メチル-5-(トリフルオロメチルスルホンイミドイル)ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル(上記のように調製した化合物P33)(0.19g、0.38mmol)、ジアセトキシ銅(0.104g、0.57mmol)及びピリジン(0.072g、0.91mmol)の1,4-ジオキサン(3.8mL)溶液を開放空気条件下において室温で5分間攪拌し、それにシクロプロピルボロン酸(0.065g、0.76mmol)を加えた。反応混合物を事前加熱した油浴中、エアパルーン下において3時間100℃で還流させた。反応混合物を室温に冷却し、酢酸エチルで希釈し、蒸留水、それに続いてブライン溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空中で濃縮した。粗生成物をcombiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の酢酸エチル)によって精製し、1-[6-[5-[N-シクロプロピル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-5-エチルスルホニル-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。LCMS(方法1): Rt=1.11分、m/z=538(M+H)<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 0.63-0.91(m, 4H), 1.37(t, 3H), 1.64-1.71(m, 2H), 2.02-2.07(m, 2H), 3.00(br d, 1H), 3.80-3.94(m, 5H), 7.62(d, 1H), 8.07(d, 1H), 8.24(d, 1H), 8.54(s, 1H), 9.05(d, 1H)。

30

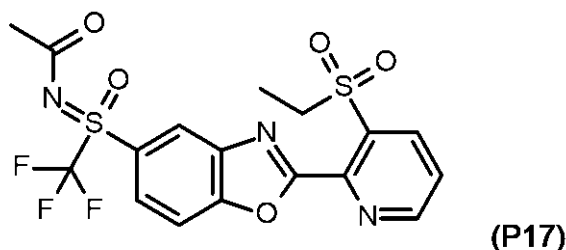
40

【0986】

実施例P17: N-[[2-(3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキソ-(トリフルオロメチル)-6-スルファニリデン]アセトアミド(化合物P17)の調製

50

## 【化 7 6】



10

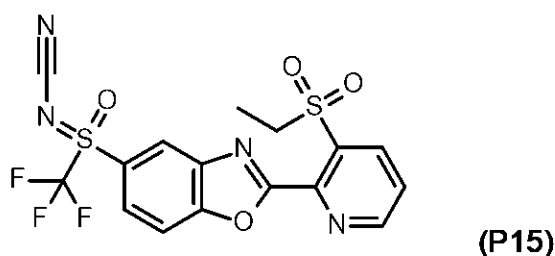
〔 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル 〕 - イミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファン ( 化合物 P 1 6 、上記で見出される記述に類似して調製 ; L C M S ( 方法 1 ) : R t = 0 . 9 7 分、m / z = 4 2 0 ( M + H ) <sup>+</sup> ) ( 5 0 m g 、 0 . 1 1 9 m m o l ) の N , N - ジメチルホルムアミド ( 1 . 1 9 m L ) 溶液に N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( 6 4 . 9 m g 、 0 . 4 7 7 m m o l ) を加え、混合物を室温で 1 0 分間撹拌した。無水酢酸 ( 5 0 . 2 m g 、 0 . 4 7 7 m m o l ) を加え、撹拌を 1 0 0 で 1 6 時間続けた。出発材料の不完全な変換を伴って L C M S 分析によって示されるように、N - [ [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファニリデン ] アセトアミド ( 化合物 P 1 7 ) が観察された。L C M S ( 方法 1 ) : R t = 1 . 0 0 分、m / z = 4 6 2 ( M + H ) <sup>+</sup>。

20

## 【 0 9 8 7】

実施例 P 1 5 : [ [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファニリデン ] シアナミド ( 化合物 P 1 5 ) の調製

## 【化 7 7】



30

〔 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル 〕 - イミノ - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファン ( 化合物 P 1 6 、上記で見出される記述に類似して調製 ; L C M S ( 方法 1 ) : R t = 0 . 9 7 分、m / z = 4 2 0 ( M + H ) <sup>+</sup> ) ( 3 0 0 m g 、 0 . 7 1 5 m m o l ) の N , N - ジメチルホルムアミド ( 5 m L ) 溶液に炭酸カリウム ( 2 9 7 m g 、 2 . 1 4 6 m m o l ) を 0 で加え、混合物を 1 0 分間撹拌した。臭化シアン ( 2 . 0 当量、1 . 4 3 1 m m o l ) を 0 で加え、次いで撹拌を室温で 6 時間続けた。完了後、反応混合物を氷冷水でクエンチし、生成物を酢酸エチル ( 2 x 2 0 m L ) で抽出し、合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空中で濃縮した。残渣を c o m b i f l a s h ( シリカゲル、シクロヘキサン中の酢酸エチル ) によって精製し、[ [ 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル ] - オキソ - ( トリフルオロメチル ) - <sup>6</sup> - スルファニリデン ] シアナミド ( 化合物 P 1 5 ) を白色の固体として得た。L C M S ( 方法 2 ) : R t = 1 . 3 9 分、m / z = 4 4 5 ( M + H ) <sup>+</sup>。

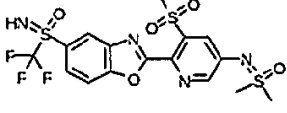
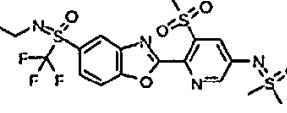
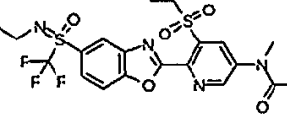
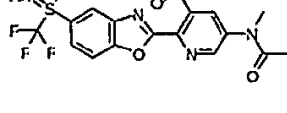
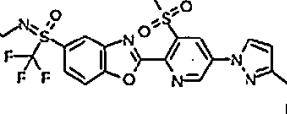
40

## 【 0 9 8 8】

50

【表 13 - 1】

表P: 式(I)の化合物の例

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P1	[2-[5-[[ジメチル(オキ ソ)-λ <sup>6</sup> -スルファニリ デン]アミノ]-3-エチル スルホニル-2-ピリジ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-5-イル]-イミ ノ-オキソ-(トリフルオ ロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルフ ファン		0.91	511	1	206 - 208
P2	[2-[5-[[ジメチル(オキ ソ)-λ <sup>6</sup> -スルファニリ デン]アミノ]-3-エチル スルホニル-2-ピリジ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-5-イル]-エチ ルイミノ-オキソ-(トリ フルオロメチル)-λ <sup>6</sup> - スルファン		1.07	539	1	157 - 159
P3	N-[5-エチルスルホニ ル-6-[5-[N-エチル- S-(トリフルオロメチ ル)スルホンイミドイ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-2-イル]-3-ピ リジル]-N-メチル-ア セトアミド		1.06	519	1	152 - 154
P4	N-[5-エチルスルホニ ル-6-[5-(トリフルオロ メチルスルホンイミド イル)-1,3-ベンゾオキサ ゾール-2-イル]-3-ピ リジル]-N-メチル-ア セトアミド		0.92	491	1	190 - 192
P5	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-5- [3-(トリフルオロメチ ル)ピラゾール-1-イ ル]-2-ピリジル]-1,3- ベンゾオキサゾール- 5-イル]-オキソ-(トリ フルオロメチル)-λ <sup>6</sup> - スルファン		1.25	582	1	190 - 192

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 2】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P6	[2-[3-エチルスルホ ニル-5-[3-(トリフル オロメチル)ピラゾー ル-1-イル]-2-ピリジ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-5-イル]-イミ ノ-オキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.12	554	1	188 - 190
P7	1-[5-エチルスルホ ニル-6-[5-(トリフル オロメチルスルホニミ ドイル)-1,3-ベンゾオ キサゾール-2-イル]-3- ピリジル]シクロプロ パンカルボニトリル		1.00	485	1	226 - 228
P8	1-[5-エチルスルホ ニル-6-[5-[N-エチル- S-(トリフルオロメチ ル)スルホニミドイ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-2-イル]-3-ピ リジル]シクロプロパ ンカルボニトリル		1.19	513	1	152 - 154
P9	[2-[3-エチルスルホ ニル-5-(2-ピリジル オキシ)-2-ピリジル]- 1,3-ベンゾオキサゾー ル-5-イル]-イミノ-オ キソ-(トリフルオロメ チル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.51	513	2	147 - 149
P10	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-5- (2-ピリジルオキシ)- 2-ピリジル]-1,3-ベン ゾオキサゾール-5-イ ル]-オキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.20	541	1	133 - 135
P11	[2-(5-シクロプロピ ル-3-エチルスルホニ ル-2-ピリジル)-1,3-ベ ンゾオキサゾール-5- イル]-エチルイミノ-オ キソ-(トリフルオロメ チル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.23	488	1	154 - 156

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 3】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P12	[2-(5-シクロプロピル -3-エチルスルホニル -2-ピリジル)-1,3-ベン ゾオキサゾール-5-イ ル]-イミノ-オキソ- (トリフルオロメチル)- λ <sup>6</sup> -スルファン		1.05	460	1	145 - 147
P13	シクロプロピルイミノ- [2-(3-エチルスルホ ニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-オキソ- (トリフルオロメチル)- λ <sup>6</sup> -スルファン		1.12	460	1	124 - 126
P14	[2-(3-エチルスルホ ニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-オキソ- (2,2,2-トリフルオロエ チルイミノ)-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.53	502	2	130 - 132
P15	[[2-(3-エチルスルホ ニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-オキソ- (トリフルオロメチル)- λ <sup>6</sup> -スルファニリデン] シアナミド		1.39	445	2	70 - 72
P16	[2-(3-エチルスルホ ニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-イミノ-オ キソ-(トリフルオロメ チル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.97	420	1	146 - 148
P17	N-[[2-(3-エチルスル ホニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-オキソ- (トリフルオロメチル)- λ <sup>6</sup> -スルファニリデン] アセトアミド		1.00	462	1	76 - 78
P18	[2-(3-エチルスルホ ニル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-メチルイ ミノ-オキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.06	434	1	118 - 120

10

20

30

40

50



【表 1 3 - 4】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P19	エチルイミノ-[2-(3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.11	448	1	106 - 108
P20	1-[5-エチルスルホニル-6-[6-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホニイミドイル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.13	527	1	86 - 88
P21	1-[5-エチルスルホニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)スルホニイミドイル]イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.94	499	1	110 - 112
P22	エチルイミノ-[2-(3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.20	546	1	142 - 144
P23	[2-(3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.51	518	2	178 - 180
P24	N-[[2-(3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファニリデン]アセトアミド		1.10	560	1	77 - 79

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 5】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P25	N-[[2-[3-エチルスルホニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファニリデン]アセトアミド		1.09	555	1	176 - 178
P26	[2-[5-(2,2-ジフルオロプロポキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.05	514	1	183 - 184
P27	[2-[5-(2,2-ジフルオロプロポキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-エチルイミノ-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.16	542	1	106 - 108
P28	1-[5-エチルスルホニル-6-[5-[N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.13	567	1	182 - 184
P29	1-[5-エチルスルホニル-6-[5-[N-メチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.08	499	1	160 - 162
P30	1-[6-[5-[N-シクロプロピル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル]-5-エチルスルホニル-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.12	525	1	162 - 164

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 6】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P31	1-[6-[5-[N-シクロプロピル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-5-エチルスルホニル-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.11	538	1	172 - 174
P32	1-[5-エチルスルホニル-6-[5-[N-エチル-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]-1-メチル-ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.10	526	1	132 - 134
P33	1-[5-エチルスルホニル-6-[1-メチル-5-(トリフルオロメチルスルホンイミドイル)ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.95	498	1	194 - 196
P34	1-[5-エチルスルホニル-6-[1-メチル-5-[N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-S-(トリフルオロメチル)スルホンイミドイル]ベンゾイミダゾール-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.11	580	1	144 - 146
P35	エチルイミノ-[2-(3-エチルスルホニル-5-ピリミジン-2-イル-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-オキシ-(トリフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.18	526	1	96 - 98
P36	[2-(3-エチルスルホニル-5-ピリミジン-2-イル-2-ピリジル)-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-イミノ-オ		1.47	498	2	208 - 210

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 7】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
	キソ-(トリフルオロメ チル)-λ <sup>6</sup> -スルファン					
P37	[2-[5-(3-クロロピラゾ ール-1-イル)-3-エチ ルスルホニル-2-ピリ ジル]-1,3-ベンゾオキ サゾール-5-イル]-イ ミノ-オキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.08	520/522	1	204 - 206
P38	[2-[5-(3-クロロピラゾ ール-1-イル)-3-エチ ルスルホニル-2-ピリ ジル]-1,3-ベンゾオキ サゾール-5-イル]-エ チルイミノ-オキソ-(ト リフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> - スルファン		1.23	548/550	1	191 - 192
P39	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-6-( 1,2,4-トリアゾール -1-イル)-2-ピリジル]- 1,3-ベンゾオキサゾー ル-5-イル]-オキソ- (トリフルオロメチル)- λ <sup>6</sup> -スルファン		1.10	515	1	174 - 176
P40	[2-[3-エチルスルホ ニル-5-[4-(トリフル オロメチル)ピリミジ ン-2-イル]-2-ピリジ ル]-1,3-ベンゾオキサ ゾール-5-イル]-イミ ノ-オキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.11	566	1	177 - 179
P41	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-5- [4-(トリフルオロメチ ル)ピリミジン-2-イ ル]-2-ピリジル]-1,3- ベンゾオキサゾール- 5-イル]-オキソ-(トリ フルオロメチル)-λ <sup>6</sup> - スルファン		1.26	594	1	199 - 201
P42	[2-[5-(5-クロロピリミ ジン-2-イル)-3-エチ ルスルホニル-2-ピリ ジル]-1,3-ベンゾオキ サゾール-5-イル]-イ		1.10	532/534	1	220 - 222

10

20

30

40

50

【表 13 - 8】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
	ミノオキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン					
P43	[2-[5-(5-クロロピリミ ジン-2-イル)-3-エチ ルスルホニル-2-ピリ ジル]-1,3-ベンゾオキ サゾール-5-イル]-エ チルイミノオキソ-(ト リフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.26	560/562	1	162 - 164
P44	[2-[3-エチルスルホ ニル-6-(1,2,4-トリア ゾール-1-イル)-2-ピ リジル]-1-メチル-ベン ゾイミダゾール-5-イ ル]-イミノオキソ-(ト リフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.91	500	1	166 - 168
P45	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-6- (1,2,4-トリアゾール- 1-イル)-2-ピリジル]- 1-メチル-ベンゾイミ ダゾール-5-イル]-オ キソ-(トリフルオロメ チル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.06	528	1	118 - 120
P46	[2-[6-(3-クロロ- 1,2,4-トリアゾール-1- イル)-3-エチルスル ホニル-2-ピリジル]- 1-メチル-ベンゾイミ ダゾール-5-イル]-イ ミノオキソ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.01	534/536	1	170 - 172
P47	[2-[6-(3-クロロ- 1,2,4-トリアゾール-1- イル)-3-エチルスル ホニル-2-ピリジル]- 1-メチル-ベンゾイミ ダゾール-5-イル]-エ チルイミノオキソ-(ト リフルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.16	562/564	1	130 - 132

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 9】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
P48	[2-[3-エチルスルホ ニル-6-[3-(トリフル オロメチル)-1,2,4-トリ アゾール-1-イル]-2- ピリジル]-1-メチル- ベンゾイミダゾール- 5-イル]-イミノ-オキシ -(トリフルオロメチ ル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.06	568	1	144 - 147
P49	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-6- [3-(トリフルオロメチ ル)-1,2,4-トリアゾ ール-1-イル]-2-ピリジ ル]-1-メチル-ベンゾ イミダゾール-5-イル ]-オキシ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.21	596	1	123 - 125
P50	[2-[3-エチルスルホ ニル-5-(2-ピリジル オキシ)-2-ピリジル]- 1-メチル-ベンゾイミ ダゾール-5-イル]-イ ミノ-オキシ-(トリフル オロメチル)-λ <sup>6</sup> -スル ファン		1.00	524 (M-H) <sup>-</sup>	1	192 - 194
P51	エチルイミノ-[2-[3-エ チルスルホニル-5- (2-ピリジルオキシ)- 2-ピリジル]-1-メチル -ベンゾイミダゾール- 5-イル]-オキシ-(トリ フルオロメチル)-λ <sup>6</sup> - スルファン		1.15	554	1	74 - 76
P52	2-[5-エチルスルホニ ル-6-[1-メチル-5-(トリ フルオロメチルスル ホニミドイル)ベンゾ イミダゾール-2-イル ]-3-ピリジル]ピリミ ジン-5-カルボニトリ ル		0.99	536	1	-
P53	2-[5-エチルスルホニ ル-6-[5-[N-エチル- S-(トリフルオロメチ ル)スルホニミドイ ル]-1-メチル-ベンゾ イミダゾール-2-イ		1.15	564	1	-

10

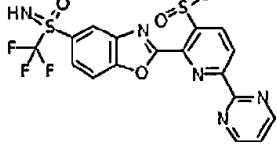
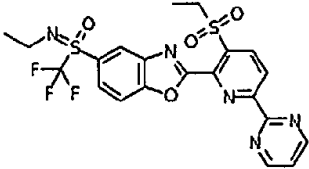
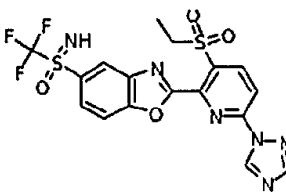
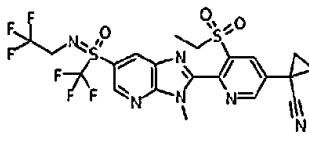
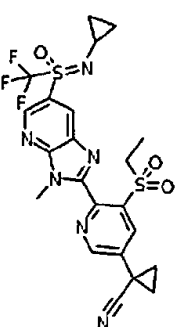
20

30

40

50

【表 1 3 - 1 0】

項目	IUPAC名	構造	RT (分)	[M+H] <sup>+</sup> 実 測値	方法	mp <sup>o</sup> C
	ル]-3-ピリジル]ピリミ ジン-5-カルボニトリ ル					
P54	[2-(3-エチルスルホ ニル-6-ピリジン-2- イル-2-ピリジル)- 1,3-ベンゾオキサゾ ール-5-イル]-イミノ- オキソ-(トリフルオロ メチル)-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.94	498	1	234 - 236
P55	エチルイミノ-[2-(3-エ チルスルホニル-6-ピ リジン-2-イル-2-ピ リジル)-1,3-ベンゾオ キサゾール-5-イル]- オキソ-(トリフルオロ メチル)-λ <sup>6</sup> -スルファ ン		1.08	526	1	201 - 203
P56	[2-[3-エチルスルホ ニル-6-(1,2,4-トリア ゾール-1-イル)-2-ピ リジル]-1,3-ベンゾオ キサゾール-5-イル]- イミノ-オキソ-(トリフ ルオロメチル)-λ <sup>6</sup> -ス ルファン		0.93	487	1	238 - 240
P57	1-[5-エチルスルホニ ル-6-[3-メチル-6- [N-(2,2,2-トリフルオ ロエチル)-S-(トリフル オロメチル)スルホン イミドイル]イミダゾ [4,5-b]ピリジン-2-イ ル]-3-ピリジル]シク ロプロパンカルボニト リル		1.12	581	1	90 - 101
P58	1-[6-[6-[N-シクロ プロピル-S-(トリフル オロメチル)スルホンイ ミドイル]-3-メチル-イ ミダゾ[4,5-b]ピリジン -2-イル]-5-エチルス ルホニル-3-ピリジ ル]シクロプロパンカ ルボニトリル		1.13	539	1	103 - 105

## 【 0 9 8 9】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に、且つ / 又は殺真菌的に活性な成分を加えることによってかなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式 I の化合物と、他の殺虫的に、殺ダニ的に、且つ / 又は殺真菌的に活性な成分との混合物は、より広い意味において、相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること又はそれらの製造中、例えば粉碎若しくは混合中、それらの貯蔵中若しくはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

## 【 0 9 9 0】

10

20

30

40

50

本明細書における有効成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の有効成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

【0991】

有効成分を有する式 I の化合物の下記の混合物が好ましい（略語「TX」は、「本発明の表 A - 1 ~ A - 96、C - 1 ~ C - 96、E - 1 ~ E - 96、F - 1 ~ F - 96、G - 1 ~ G - 96 及び H - 1 ~ H - 96 並びに表 P に記載されている化合物からなる群から選択される 1 つの化合物」を意味する）：

10

石油（代替名）（628）+ TX からなる物質の群から選択される補助剤；

以下から選択される昆虫防除活性物質：アバメクチン+TX、アセキノシル+TX、アセタミプリド+TX、アセトプロール+TX、アクリナトリン+TX、アシノナピル+TX、アフイドピロペン+TX、アホクソラナー+TX、アラニカルブ+TX、アレトリン+TX、アルファ-シペルメトリン+TX、アルファメトリン+TX、アミドフルメト+TX、アミノカルブ+TX、アゾシクロチン+TX、ベンスルタップ+TX、ベンゾキシメート+TX、ベンズピリモキササン+TX、ベータシフルトリン+TX、ベータ-シペルメトリン+TX、ピフェナゼート+TX、ピフェントリン+TX、ピナプアクリル+TX、バイオアレスリン+TX、バイオアレスリンS)-シクロペンチル異性体+TX、ピオレスメトリン+TX、ピストリフルロン+TX、プロフラニリド+TX、プロフルトリネート+TX、ブルモホス-エチル+TX、ブプロフェジン+TX、ブトカルボキシム+TX、カズサホス+TX、カルバリル+TX、カルボスルファン+TX、カルタップ+TX、CAS 番号：1472050-04-6+TX、CAS 番号：1632218-00-8+TX、CAS 番号：1808115-49-2+TX、CAS 番号：2032403-97-5+TX、CAS 番号：2044701-44-0+TX、CAS 番号：2128706-05-6+TX、CAS 番号：2249718-27-0+TX、クロラントラニリプロール+TX、クロルデン+TX、クロルフェナピル+TX、クロロブラレトリン+TX、クロマフェノジド+TX、クレンピリン+TX、クロエトカルブ+TX、クロチアニジン+TX、2-クロロフェニルN-メチルカルバメート(CPMC)+TX、シアノフェンホス+TX、シアントラニリプロール+TX、シクラニリプロール+TX、シクロブトリフルラム+TX、シクロプロトリン+TX、シクロキサプリド+TX、シクロキサプリド+TX、シエノピラフェン+TX、シエトピラフェン+TX、シフルメトフェン+TX、シフルトリン+TX、シハロジアミド+TX、シハロトリン+TX、シペルメトリン+TX、シフェノトリン+TX、シプロフルアニリド+TX、シロマジン+TX、デルタメトリン+TX、ジアフェンチウロン+TX、ジアリホス+TX、Dibrom+TX、ジクロロメゾチアズ+TX、ジフロビダジン+TX、ジフルベンズロン+TX、ジンプロピリダズ+TX、ジナクチン+TX、ジノカップ+TX、ジノテフラン+TX、ジオキサベンゾホス+TX、エマメクチン+TX、エンペントリン+TX、イブシロン-モンフルオロトリン+TX、イブシロン-メトフルトリン+TX、エスフェンバレレ-ト+TX、エチオン+TX、エチプロール+TX、エトフェンブロックス+TX、エトキサゾール+TX、ファンファー+TX、フェナザキン+TX、フェンフルスリン+TX、フェニトロチオン+TX、フェノブカルブ+TX、フェノチオカルブ+TX、フェノキシカルブ+TX、フェンプロパトリン+TX、フェンピロキシメート+TX、フェンスルホチオン+TX、フェンチオン+TX、フェンチンアセタート+TX、フェンバレレート+TX、フィプロニル+TX、フロメトキン+TX、フロニカミド+TX、フルアクリピリム+TX、フルアザインドリジン+TX、フルアズロン+TX、フルベンジアミド+TX、フルベンジミン+TX、フルシトリネート+TX、フルシクロクスロン+TX、フルシトリネート+TX、フルエンズルホン+TX、フルフェネリム+TX、フルフェンブロックス+TX、フルフィプロール+TX、フルヘキサホン+TX、フルメトリン+TX、フルオ

20

30

40

50



ピラム+TX、フルペンチオフェノックス+TX、フルピラジフロン+TX、フルピリミ  
 ン+TX、フルララネル+TX、フルバリネート+TX、フルキサメタミド+TX、ホス  
 チアゼート+TX、ガンマ-シハロトリン+TX、G o s s y p l u r e (商標)+TX  
 、グアジピル+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェンプロッ  
 クス+TX、ヘプタフルトリン+TX、ヘキシチアゾックス+TX、ハイドラメチルノン  
 +TX、イミシアホス+TX、イミダクロプリド+TX、イミプロトリン+TX、インド  
 キサカルブ+TX、ヨードメタン+TX、イプロジオン+TX、イソシクロセラム+TX  
 、イソチオエート+TX、イベルメクチン+TX、カップ-ビフェントリン+TX、カッ  
 パ-テフルトリン+TX、ラムダ-シハロトリン+TX、レピメクチン+TX、ルフエヌ  
 ロン+TX、メタフルミゾン+TX、メタアルデヒド+TX、メタム+TX、メソミル+  
 TX、メトキシフェノジド+TX、メトフルトリン+TX、メトルカルブ+TX、メキサ  
 カルベート+TX、ミルベメクチン+TX、モンフルオロトリン+TX、ニクロサミド+  
 TX、ニコフルプロール+TX；ニテンピラム+TX、ニチアジン+TX、オメトエート  
 +TX、オキサミル+TX、オキサゾスルフィル+TX、パラチオン-エチル+TX、ペ  
 ルメトリン+TX、フェノトリン+TX、ホスホカルブ+TX、ピペロニルブトキシド+  
 TX、ピリミカーブ+TX、ピリミホス-エチル+TX、多核体病ウイルス+TX、プラ  
 レトリン+TX、プロフェノホス+TX、プロフェノホス+TX、プロフルトリン+TX  
 、プロパルギット+TX、プルベタンホス+TX、プロボキスル+TX、プロチオホス+  
 TX、プロトリフェンブト+TX、ピフルブミド+TX、ピメトロジン+TX、ピラクロ  
 ホス+TX、ピラフルプロール+TX、ピリダベン+TX、ピリダリル+TX、ピリフル  
 キナゾン+TX、ピリミジフェン+TX、ピリモストロピン+TX、ピリプロール+TX  
 、ピリプロキシフェン+TX、レスメトリン+TX、サロラネル+TX、セラメクチン+  
 TX、シラフルオフェン+TX、スピネトラム+TX、スピノサド+TX、スピロジクロ  
 フェン+TX、スピロメシフェン+TX、スピロピジオン+TX、スピロテトラマト+TX  
 X、スルホキサフルル+TX、テブフェノジド+TX、テブフェンピラド+TX、テブピ  
 リミホス+TX、テフルトリン+TX、テメホス+TX、テトラクロラントラニリプロー  
 ル+TX、テトラジホン+TX、テトラメトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX  
 、テトラナクチン+TX、テトラニリプロール+TX、シータ-シベルメトリン+TX、  
 チアクロプリド+TX、チアメトキサム+TX、チオシクラム+TX、チオジカルブ+TX  
 X、チオフアノックス+TX、チオメトン+TX、チオスルタップ+TX、チオキサザフ  
 ェン+TX、トルフェンピラド+TX、トキサフェン+TX、トラロメトリン+TX、ト  
 ランスフルトリン+TX、トリアザメエート+TX、トリアゾホス+TX、トリクロルホ  
 ン+TX、トリクロロネート+TX、トリクロルホン+TX、トリフルメゾピリム+TX  
 、チクロピラゾフルル+TX、ゼータ-シベルメトリン+TX、海藻及びメラッセに由来  
 する発酵産物の抽出物+TX、尿素を含む海藻及びメラッセに由来する発酵産物の抽出物  
 +TX、アミノ酸+TX、カリウム及びモリブデン及びEDTAキレート化マンガン+TX  
 、海藻及び発酵植物産物の抽出物+TX、植物ホルモンを含む海藻及び発酵植物産物の  
 抽出物+TX、ビタミン+TX、EDTAキレート化銅+TX、亜鉛+TX及び鉄+TX  
 、アザジラクチン+TX、バチルス・アイザワイ(Bacillus aizawai)  
 +TX、バチルス・キチノスポルス(Bacillus chitinosporus)  
 AQ746(NRRL受託番号B-21618)+TX、バチルス・フィルムス(Ba  
 cillus firmus)+TX、バチルス・クルスターキ(Bacillus ku  
 rstaki)+TX、バチルス・ミコイデス(Bacillus mycoides)  
 AQ726(NRRL受託番号B-21664)+TX、バチルス・プミルス(Baci  
 llus pumilus)(NRRL受託番号B-30087)+TX、バチルス・プ  
 ミルス(Bacillus pumilus)AQ717(NRRL受託番号B-216  
 62)+TX、バチルス属(Bacillus)の種AQ178(ATCC受託番号53  
 522)+TX、バチルス属(Bacillus)の種AQ175(ATCC受託番号5  
 5608)+TX、バチルス属(Bacillus)の種AQ177(ATCC受託番号  
 55609)+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)不特定+TX、枯

10

20

30

40

50

草菌 (*Bacillus subtilis*) AQ153 (ATCC 受託番号 55614) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) AQ30002 (NRRL 受託番号 B-50421) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) AQ30004 (NRRL 受託番号 B-50455) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) AQ713 (NRRL 受託番号 B-21661) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) AQ743 (NRRL 受託番号 B-21665) + TX、パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) AQ52 (NRRL 受託番号 B-21619) + TX、パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BD#32 (NRRL 受託番号 B-21530) + TX、パチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subspec. kurstaki*) BMP 123 + TX、白きょう病菌 (*Beauveria bassiana*) + TX、D-リモネン + TX、グラニュロウイルス + TX、ハーピン + TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多角体病ウイルス + TX、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 核多角体病ウイルス + TX、ヘリオチス・プンクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多角体病ウイルス + TX、メタリジウム属 (*Metarhizium*) の種 + TX、ムスコドル・アルプス (*Muscodora albus*) 620 (NRRL 受託番号 30547) + TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscodora roseus*) A3-5 (NRRL 受託番号 30548) + TX、ニームノキをベースとする生成物 + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) + TX、パスツーリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、パスツーリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*) + TX、パスツーリア・ラモサ (*Pasteuria ramosa*) + TX、パスツーリア・ソルネイ (*Pasteuria thornei*) + TX、パスツーリア・ウスガエ (*Pasteuria usgae*) + TX、P-シメン + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 顆粒病ウイルス + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多角体病ウイルス + TX、多核体病ウイルス + TX、除虫菊 + TX、QRD 420 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD 452 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD 460 (テルペノイドブレンド) + TX、シャボンノキ (*Quillaja saponaria*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) AQ719 (NRRL 受託番号 B-21663) + TX、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多角体病ウイルス + TX、ストレプトマイセス・ガルバス (*Streptomyces galbus*) (NRRL 受託番号 30232) + TX、ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) の種 (NRRL 受託番号 B-30145) + TX、テルペノイドブレンド + TX 及びベルチシリウム属 (*Verticillium*) の種；

以下からなる物質の群から選択される殺藻剤：ベトキサジン [CCN] + TX、ジオクタン酸銅 (IUPAC 名) (170) + TX、硫酸銅 (172) + TX、シプトリン [CCN] + TX、ジクロン (1052) + TX、ジクロロフェン (232) + TX、エンドタール (295) + TX、フェンチン (347) + TX、消石灰 [CCN] + TX、ナーバム (566) + TX、キノクラミン (714) + TX、キノナミド (1379) + TX、シマジン (730) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC 名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC 名) (347) + TX；

以下からなる物質の群から選択される駆虫剤：アバメクチン (1) + TX、クルホマー (1011) + TX、シクロブトリフルラム + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] +

TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）[CCN]+TX、モキシデクチン（代替名）[CCN]+TX、ピペラジン[CCN]+TX、セラメクチン（代替名）[CCN]+TX、スピノサド（737）及びチオファネート（1435）+TX；

以下からなる物質の群から選択される殺鳥剤：クロラロース（127）+TX、エンドリン（1122）+TX、フェンチオン（346）+TX、ピリジン-4-アミン（IUPAC名）（23）及びストリキニーネ（745）+TX；

以下からなる物質の群から選択される殺菌剤：1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+TX、プロノポール（97）+TX、ジオクタン酸銅（IUPAC名）（170）+TX、水酸化銅（IUPAC名）（169）+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン（232）+TX、ジピリチオン（1105）+TX、ドジシン（1112）+TX、フェナミノスルフ（1144）+TX、ホルムアルデヒド（404）+TX、ヒドラルガフェン（代替名）[CCN]+TX、カスガマイシン（483）+TX、カスガマイシン塩酸塩一水和物（483）+TX、ニッケルビス（ジメチルジチオカルバメート）（IUPAC名）（1308）+TX、ニトラピリン（580）+TX、オクチリノン（590）+TX、オキソリン酸（606）+TX、オキシテトラサイクリン（611）+TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+TX、プロベナゾール（658）+TX、ストレプトマイシン（744）+TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン（744）+TX、テクロフタラム（766）+TX及びチオメルサル（代替名）[CCN]+TX；

以下からなる物質の群から選択される生物剤：リンゴコカクモンハマキ（*Adoxophyes orana*）GV（代替名）（12）+TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター（*Agrobacterium radiobacter*）（代替名）（13）+TX、ムチカブリダニ属（*Amblyseius*）の種（代替名）（19）+TX、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapta falcifera*）NPV（代替名）（28）+TX、アナグルス・アトムス（*Anagrus atomus*）（代替名）（29）+TX、アフエリヌス・アブドミナリス（*Aphelinus abdominalis*）（代替名）（33）+TX、アフイジウス・コレマニ（*Aphidius colemani*）（代替名）（34）+TX、アフイドレテス・アフイディマイザ（*Aphidoletes aphidimyza*）（代替名）（35）+TX、オートグラファ・カリフォルニカ（*Autographa californica*）NPV（代替名）（38）+TX、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）（代替名）（48）+TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ（*Bacillus sphaericus Neide*）（学名）（49）+TX、バチルス・チューリングゲンシス・ベルリナー（*Bacillus thuringiensis Berliner*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種アイザワイ（*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエシス（*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種ジャポネシス（*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種クルスターキ（*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス（*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*）（学名）（51）+TX、白きょう病菌（*Beauveria bassiana*）（代替名）（53）+TX、ビューベリア・ブロングニアルティ（*Beauveria brongniartii*）（代替名）（54）+TX、ヤマトクサカゲロウ（*Chrysoperla carnea*）（代替名）（151）+TX、ツマアカオオテントウムシ（*Cryptolaemus montrouzieri*）（代替名）（178

10

20

30

40

50

)+TX、コドリंगा(*Cydia pomonella*)GV(代替名)(191)+TX、ハモグリコマコバチ(*Dacnusa sibirica*)(代替名)(212)+TX、イサエアヒメコバチ(*Diglyphus isaea*)(代替名)(254)+TX、オンシツツヤコバチ(*Encarsia formosa*)(学名)(293)+TX、サバクツヤコバチ(*Eretmocerus eremicus*)(代替名)(300)+TX、アメリカタバコガ(*Helicoverpa zea*)NPV(代替名)(431)+TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)及びH.メギディス(*H. megidis*)(代替名)(433)+TX、サカハチテントウ(*Hippodamia convergens*)(代替名)(442)+TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ(*Leptomastix dactylopii*)(代替名)(488)+TX、マクロロフス・カリギノス(*Macrolophus caliginosus*)(代替名)(491)+TX、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)NPV(代替名)(494)+TX、メタフィカス・ヘルボルス(*Metaphycus helvolus*)(代替名)(522)+TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリズム(*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*)(学名)(523)+TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*)(学名)(523)+TX、マツノキハバチ(*Neodiprion sertifer*)NPV及びN.レコンティ(*N. lecontei*)NPV(代替名)(575)+TX、オリウス属(*Orius*)の種(代替名)(596)+TX、ペシロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)(代替名)(613)+TX、チリカブリダニ(*Phytoseiulus persimilis*)(代替名)(644)+TX、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)多カブシド核多角体病ウイルス(学名)(741)+TX、スタイナーネマ・ビビオニス(*Steinernema bibionis*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・カルポカプサエ(*Steinernema carpocapsae*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・フェルチアエ(*Steinernema feltiae*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・グラッセリ(*Steinernema glaseri*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・リオブラベ(*Steinernema riobrave*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・リオブラビス(*Steinernema riobravensis*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ・スカプテリシ(*Steinernema scapterisci*)(代替名)(742)+TX、スタイナーネマ属(*Steinernema*)の種(代替名)(742)+TX、トリコグラムマ属(*Trichogramma*)の種(代替名)(826)+TX、チフロドロムス・オシデンタリス(*Typhlodromus occidentalis*)(代替名)(844)及びパーティシリウム・レカニ(*Verticillium lecanii*)(代替名)(848)+TX;

以下からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤：ヨードメタン(IUPAC名)(542)及び臭化メチル(537)+TX;

以下からなる物質の群から選択される化学不妊化剤：アフォレート[CCN]+TX、ビスジル(代替名)[CCN]+TX、ブスルファン(代替名)[CCN]+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジマチフ(代替名)[CCN]+TX、ヘメル[CCN]+TX、ヘンパ[CCN]+TX、メテパ[CCN]+TX、メチオテパ[CCN]+TX、メチルアフォレート[CCN]+TX、モルジド[CCN]+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、テパ[CCN]+TX、チオヘンパ(代替名)[CCN]+TX、チオテパ(代替名)[CCN]+TX、トレタミン(代替名)[CCN]及びウレデパ(代替名)[CCN]+TX;

以下からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン：(E)-デカ-5-エン-1-イルアセテート及び(E)-デカ-5-エン-1-オール(IUPAC名)(222)+

10

20

30

40

50

TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) +  
 TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) +  
 TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名)  
 (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名)  
 (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) +  
 TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437)  
 + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名)  
 (438) + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名)  
 (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC 名) (782)  
 + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) +  
 TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784)  
 + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名)  
 (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセ  
 テート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 -  
 ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデ  
 カ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び4  
 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) + TX、アルファ - マルチストリ  
 アチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレ  
 ルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、キュールア  
 (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1  
 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセ  
 テート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イル  
 アセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + T  
 X、エチル4 - メチルオクタノエート (IUPAC 名) (317) + TX、ユージノール  
 (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア  
 (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名)  
 (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III  
 (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサ  
 ルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代  
 替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代  
 替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名)  
 [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX  
 、メチルユージノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オク  
 タデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オ  
 クタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、  
 オルフルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名) (317) + TX、  
 オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代  
 替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11  
 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + TX、トリメドルア (839)  
 + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B<sub>1</sub> (代替名) (8  
 39) + TX、トリメドルア B<sub>2</sub> (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名)  
 (839) 及びトランク - コール (代替名) [CCN] + TX ;

以下からなる物質の群から選択される昆虫忌避剤：2 - (オクチルチオ) エタノール (IUPAC 名) (591) + TX、ブトピロノキシル (933) + TX、ブトキシ (ポリ  
 プロピレングリコール) (936) + TX、アジピン酸ジブチル (IUPAC 名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、コハク酸ジブチル (IUPAC 名)  
 (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [C  
 CN] + TX、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、エチルヘキサンジオール (1137)  
 + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチ  
 ルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] 及びピカリジン [CCN

10

20

30

40

50

] + T X ;

以下からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤：ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913) + T X、ブromoアセトアミド[CCN] + T X、ヒ酸カルシウム[CCN] + T X、クロエトカルブ(999) + T X、アセト亜ヒ酸銅[CCN] + T X、硫酸銅(172) + T X、フェンチン(347) + T X、リン酸第2鉄(IUPAC名)(352) + T X、メタアルデヒド(518) + T X、メチオカルブ(530) + T X、ニクロサミド(576) + T X、ニクロサミド - オラミン(576) + T X、ペンタクロロフェノール(623) + T X、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623) + T X、タジムカルブ(1412) + T X、チオジカルブ(799) + T X、トリブチルスズオキシド(913) + T X、トリフェンモルフ(1454) + T X、トリメタカルブ(840) + T X、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347) + T X、ピリプロール[394730 - 71 - 3] + T X ;

10

以下からなる物質の群から選択される殺線虫剤：AKD - 3088(化合物コード) + T X、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1045) + T X、1, 2 - ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1062) + T X、1, 2 - ジクロロプロパン及び1, 3 - ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063) + T X、1, 3 - ジクロロプロペン(233) + T X、3, 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン1, 1 - ジオキシド(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1065) + T X、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン(IUPAC名)(980) + T X、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸(IUPAC名)(1286) + T X、6 - イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210) + T X、アバメクチン(1) + T X、アセトプロール[CCN] + T X、アラニカルブ(15) + T X、アルジカルブ(16) + T X、アルドキシカルブ(863) + T X、AZ 60541(化合物コード) + T X、ベンクロチアズ[CCN] + T X、ベノミル(62) + T X、ブチルピリダベン(代替名) + T X、カズサハス(109) + T X、カルボフラン(118) + T X、二硫化炭素(945) + T X、カルボスルファン(119) + T X、クロロピクリン(141) + T X、クロルピリホス(145) + T X、クロエトカルブ(999) + T X、シクロブトリフルラム + T X、サイトカイニン(代替名)(210) + T X、ダゾメット(216) + T X、DBCP(1045) + T X、DCIP(218) + T X、ジアミダホス(1044) + T X、ジクロロフェンチオン(1051) + T X、ジクリホス(代替名) + T X、ジメトエート(262) + T X、ドラメクチン(代替名)[CCN] + T X、エマメクチン(291) + T X、エマメクチン安息香酸塩(291) + T X、エブリノメクチン(代替名)[CCN] + T X、エトプロホス(312) + T X、二臭化エチレン(316) + T X、フェナミホス(326) + T X、フェンピラド(代替名) + T X、フェンスルホチオン(1158) + T X、ホスチアゼート(408) + T X、ホスチエタン(1196) + T X、フルフラール(代替名)[CCN] + T X、GY - 81(開発コード)(423) + T X、ヘテロホス[CCN] + T X、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + T X、イサミドホス(1230) + T X、イサザホス(1231) + T X、イベルメクチン(代替名)[CCN] + T X、キネチン(代替名)(210) + T X、メカルフォン(1258) + T X、メタム(519) + T X、メタム - カリウム(代替名)(519) + T X、メタム - ナトリウム(519) + T X、臭化メチル(537) + T X、メチルイソチオシアネート(543) + T X、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + T X、モキシデクチン(代替名)[CCN] + T X、クワ暗斑病菌(*Myrothecium verrucaria*)組成物(代替名)(565) + T X、NC - 184(化合物コード) + T X、オキサミル(602) + T X、ホレート(636) + T X、ホスファミドン(639) + T X、ホスホカルブ[CCN] + T X、セブホス(代替名) + T X、セラメクチン(代替名)[CCN] + T X、スピノサド(737) + T X、テルバム(代替名) + T X、テルブホス(773) + T X、テトラクロロチオフェン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1

20

30

40

50

4 2 2 ) + T X、チアフェノックス ( 代替名 ) + T X、チオナジン ( 1 4 3 4 ) + T X、  
 トリアゾホス ( 8 2 0 ) + T X、トリアズロン ( 代替名 ) + T X、キシレノール [ C C N  
 ] + T X、Y I - 5 3 0 2 ( 化合物コード ) 及びゼアチン ( 代替名 ) ( 2 1 0 ) + T X、  
 フルエンシルホン [ 3 1 8 2 9 0 - 9 8 - 1 ] + T X、フルオピラム + T X ;

以下からなる物質の群から選択される硝化阻害剤 : エチルキサントゲン酸カリウム [ C  
 C N ] 及びニトラピリン ( 5 8 0 ) + T X ;

以下からなる物質の群から選択される植物活性化剤 : アシベンゾラル ( 6 ) + T X、ア  
 シベンゾラル - S - メチル ( 6 ) + T X、プロベナゾール ( 6 5 8 ) 及びオオイタドリ (  
*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 ( 代替名 ) ( 7 2 0 ) + T  
 X ;

以下からなる物質の群から選択される殺げっ歯類剤 : 2 - イソバレリルインダン - 1 ,  
 3 - ジオン ( I U P A C 名 ) ( 1 2 4 6 ) + T X、4 - ( キノキサリン - 2 - イルアミノ )  
 ) ベンゼンスルホンアミド ( I U P A C 名 ) ( 7 4 8 ) + T X、アルファ - クロロヒドリ  
 ン [ C C N ] + T X、リン化アルミニウム ( 6 4 0 ) + T X、アンチュ ( 8 8 0 ) + T X  
 、三酸化ヒ素 ( 8 8 2 ) + T X、炭酸バリウム ( 8 9 1 ) + T X、ビスチオセミ ( 9 1 2  
 ) + T X、プロディファコウム ( 8 9 ) + T X、プロマジオロン ( アルファ - プロマジオ  
 ロンを含めた ) + T X、プロメタリン ( 9 2 ) + T X、シアン化カルシウム ( 4 4 4 ) +  
 T X、クロラロース ( 1 2 7 ) + T X、クロロファシノン ( 1 4 0 ) + T X、コレカルシ  
 フェロール ( 代替名 ) ( 8 5 0 ) + T X、クマクロル ( 1 0 0 4 ) + T X、クマフリル ( 1  
 0 0 5 ) + T X、クマテトラリル ( 1 7 5 ) + T X、クリミジン ( 1 0 0 9 ) + T X、  
 ジフェナコウム ( 2 4 6 ) + T X、ジフェチアロン ( 2 4 9 ) + T X、ジファシノン ( 2  
 7 3 ) + T X、エルゴカルシフェロール ( 3 0 1 ) + T X、フロクマフェン ( 3 5 7 ) +  
 T X、フルオロアセトアミド ( 3 7 9 ) + T X、フルプロパジン ( 1 1 8 3 ) + T X、フ  
 ルプロパジン塩酸塩 ( 1 1 8 3 ) + T X、ガンマ - H C H ( 4 3 0 ) + T X、H C H ( 4  
 3 0 ) + T X、シアン化水素 ( 4 4 4 ) + T X、ヨードメタン ( I U P A C 名 ) ( 5 4 2  
 ) + T X、リンデン ( 4 3 0 ) + T X、リン化マグネシウム ( I U P A C 名 ) ( 6 4 0 )  
 + T X、臭化メチル ( 5 3 7 ) + T X、ノルボルミド ( 1 3 1 8 ) + T X、ホサセチム ( 1  
 3 3 6 ) + T X、ホスフィン ( I U P A C 名 ) ( 6 4 0 ) + T X、リン [ C C N ] + T  
 X、ピンドン ( 1 3 4 1 ) + T X、亜ヒ酸カリウム [ C C N ] + T X、ピリヌロン ( 1 3  
 7 1 ) + T X、シリロシド ( 1 3 9 0 ) + T X、亜ヒ酸ナトリウム [ C C N ] + T X、シ  
 アン化ナトリウム ( 4 4 4 ) + T X、フルオロ酢酸ナトリウム ( 7 3 5 ) + T X、ストリ  
 キニーネ ( 7 4 5 ) + T X、硫酸タリウム [ C C N ] + T X、ワルファリン ( 8 5 1 ) 及  
 びリン化亜鉛 ( 6 4 0 ) + T X ;

以下からなる物質の群から選択される共力剤 : 2 - ( 2 - ブトキシエトキシ ) エチルピ  
 ペロニレート ( I U P A C 名 ) ( 9 3 4 ) + T X、5 - ( 1 , 3 - ベンゾジオキソール -  
 5 - イル ) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン ( I U P A C 名 ) ( 9 0 3 ) + T X  
 、ファルネソール及びネロリドール ( 代替名 ) ( 3 2 4 ) + T X、M B - 5 9 9 ( 開発コ  
 ード ) ( 4 9 8 ) + T X、M G K 2 6 4 ( 開発コード ) ( 2 9 6 ) + T X、ピペロニル  
 ブトキシド ( 6 4 9 ) + T X、ピプロタル ( 1 3 4 3 ) + T X、プロピル異性体 ( 1 3  
 5 8 ) + T X、S 4 2 1 ( 開発コード ) ( 7 2 4 ) + T X、セサメックス ( 1 3 9 3 ) +  
 T X、セサモリン ( 1 3 9 4 ) 及びスルホキシド ( 1 4 0 6 ) + T X ;

以下からなる物質の群から選択される動物忌避剤 : アントラキノン ( 3 2 ) + T X、ク  
 ロラロース ( 1 2 7 ) + T X、ナフテン酸銅 [ C C N ] + T X、オキシ塩化銅 ( 1 7 1 )  
 + T X、ダイアジノン ( 2 2 7 ) + T X、ジシクロペンタジエン ( 化学名 ) ( 1 0 6 9 )  
 + T X、グアザチン ( 4 2 2 ) + T X、酢酸グアザチン ( 4 2 2 ) + T X、メチオカルブ  
 ( 5 3 0 ) + T X、ピリジン - 4 - アミン ( I U P A C 名 ) ( 2 3 ) + T X、チラム ( 8  
 0 4 ) + T X、トリメタカルブ ( 8 4 0 ) + T X、ナフテン酸亜鉛 [ C C N ] 及びジラム  
 ( 8 5 6 ) + T X ;

以下からなる物質の群から選択される抗ウイルス剤 : イマニン ( 代替名 ) [ C C N ] 及  
 びリバビリン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X ;

10

20

30

40

50

以下からなる物質の群から選択される傷保護剤：酸化第二水銀（５１２）＋ＴＸ、オクチリノン（５９０）及びチオファネート－メチル（８０２）＋ＴＸ；

以下から選択される生物学的活性物質：１，１－ビス（４－クロロ－フェニル）－２－エトキシエタノール＋ＴＸ、２，４－ジクロロフェニルベンゼンスルホネート＋ＴＸ、２－フルオロ－Ｎ－メチル－Ｎ－１－ナフチルアセトアミド＋ＴＸ、４－クロロフェニルフェニルスルホン＋ＴＸ、アセトプロール＋ＴＸ、アルドキシカルブ＋ＴＸ、アミジチオン＋ＴＸ、アミドチオエート＋ＴＸ、アミトン＋ＴＸ、アミトンシュウ酸水素塩＋ＴＸ、アミトラズ＋ＴＸ、アラマイト＋ＴＸ、三酸化ヒ素＋ＴＸ、アゾベンゼン＋ＴＸ、アゾトエート＋ＴＸ、ペノミル＋ＴＸ、ペノキサ－ホス＋ＴＸ、安息香酸ベンジル＋ＴＸ、ピキサフェン＋ＴＸ、プロフェンバレレート＋ＴＸ、プロモ－シクレン＋ＴＸ、プロモホス＋Ｔ  
 １０  
 Ｘ、プロモプロピレート＋ＴＸ、ブプロフェジン＋ＴＸ、ブトカルボキシム＋ＴＸ、ブトキシカルボキシム＋ＴＸ、ブチルピリダベン＋ＴＸ、多硫化カルシウム＋ＴＸ、カンフェクロル＋ＴＸ、カーバノレート＋ＴＸ、カルボフェノチオン＋ＴＸ、シミアゾール＋ＴＸ、キノ－メチオナト＋ＴＸ、クロルベンシド＋ＴＸ、クロルジメホルム＋ＴＸ、クロルジメホルム塩酸塩＋ＴＸ、クロルフェネトール＋ＴＸ、クロルフェンソン＋ＴＸ、クロルフェンスルフィド＋ＴＸ、クロロベンジレート＋ＴＸ、クロロメブホルム＋ＴＸ、クロロメチウロン＋ＴＸ、クロロプロピレート＋ＴＸ、クロルチオホス＋ＴＸ、シネリンⅠ＋Ｔ  
 ２０  
 Ｘ、シネリンⅡ＋ＴＸ、シネリン＋ＴＸ、クロサンテル＋ＴＸ、クマホス＋ＴＸ、クロタミトン＋ＴＸ、クロトキシホス＋ＴＸ、クフラネブ＋ＴＸ、シアントエート＋ＴＸ、ＤＣＰＭ＋ＴＸ、ＤＤＴ＋ＴＸ、デメフィオン＋ＴＸ、デメフィオン－Ｏ＋ＴＸ、デメフィオン－Ｓ＋Ｔ  
 ３０  
 Ｘ、デメトン－メチル＋ＴＸ、デメトン－Ｏ＋ＴＸ、デメトン－Ｏ－メチル＋ＴＸ、デメトン－Ｓ＋Ｔ  
 ４０  
 Ｘ、デメトン－Ｓ－メチル＋Ｔ  
 ５０  
 Ｘ、デメトン－Ｓ－メチルスルホン＋Ｔ  
 ６０  
 Ｘ、ジクロフルアニド＋Ｔ  
 ７０  
 Ｘ、ジクロルボス＋Ｔ  
 ８０  
 Ｘ、ジクリホス＋Ｔ  
 ９０  
 Ｘ、ジエノクロール＋Ｔ  
 １００  
 Ｘ、ジメフォックス＋Ｔ  
 １１０  
 Ｘ、ジネクス＋Ｔ  
 １２０  
 Ｘ、ジネクス－ジクレキシ  
 １３０  
 ン＋Ｔ  
 １４０  
 Ｘ、ジノカップ－４＋Ｔ  
 １５０  
 Ｘ、ジノカップ－６＋Ｔ  
 １６０  
 Ｘ、ジノクトン＋Ｔ  
 １７０  
 Ｘ、ジノ－ペン  
 １８０  
 トン＋Ｔ  
 １９０  
 Ｘ、ジノスルホン＋Ｔ  
 ２００  
 Ｘ、ジノテルボン＋Ｔ  
 ２１０  
 Ｘ、ジオキサチオン＋Ｔ  
 ２２０  
 Ｘ、ジフェニルスルホン＋Ｔ  
 ２３０  
 Ｘ、ジスルフィラム＋Ｔ  
 ２４０  
 Ｘ、ＤＮＯＣ＋Ｔ  
 ２５０  
 Ｘ、ドフェナピン＋Ｔ  
 ２６０  
 Ｘ、ドラメク  
 ２７０  
 チン＋Ｔ  
 ２８０  
 Ｘ、エンドチオン＋Ｔ  
 ２９０  
 Ｘ、エプリノメク  
 ３００  
 チン＋Ｔ  
 ３１０  
 Ｘ、エトエート－メチル＋Ｔ  
 ３２０  
 Ｘ、エトリムホス＋Ｔ  
 ３３０  
 Ｘ、フェナザフロール＋Ｔ  
 ３４０  
 Ｘ、フェンブタチン  
 ３５０  
 オキシド＋Ｔ  
 ３６０  
 Ｘ、フェノチオカル  
 ３７０  
 ブ＋Ｔ  
 ３８０  
 Ｘ、フェンピラド＋Ｔ  
 ３９０  
 Ｘ、フェン－ピロ  
 ４００  
 キシメート＋Ｔ  
 ４１０  
 Ｘ、フェンピラ  
 ４２０  
 ザミン＋Ｔ  
 ４３０  
 Ｘ、フェンソン＋Ｔ  
 ４４０  
 Ｘ、フェントリ  
 ４５０  
 ファニル＋Ｔ  
 ４６０  
 Ｘ、フルベンジ  
 ４７０  
 ミン＋Ｔ  
 ４８０  
 Ｘ、フルシクロ  
 ４９０  
 クスロン＋Ｔ  
 ５０  
 ５１  
 ５２  
 ５３  
 ５４  
 ５５  
 ５６  
 ５７  
 ５８  
 ５９  
 ６０  
 ６１  
 ６２  
 ６３  
 ６４  
 ６５  
 ６６  
 ６７  
 ６８  
 ６９  
 ７０  
 ７１  
 ７２  
 ７３  
 ７４  
 ７５  
 ７６  
 ７７  
 ７８  
 ７９  
 ８０  
 ８１  
 ８２  
 ８３  
 ８４  
 ８５  
 ８６  
 ８７  
 ８８  
 ８９  
 ９０  
 ９１  
 ９２  
 ９３  
 ９４  
 ９５  
 ９６  
 ９７  
 ９８  
 ９９  
 １００



ファミド+TX、SSI-121+TX、スルフィラム+TX、スルフラミド+TX、ス  
 ルホテップ+TX、硫黄+TX、ジフロピダジン+TX、タウ-フルバリネート+TX、  
 TEPP+TX、テルバム+TX、テトラジホン+TX、テトラサル+TX、チアフェノ  
 ックス+TX、チオカルボキシム+TX、チオフアノックス+TX、チオメトン+TX、  
 チオキノックス+TX、ツリンギエンシン+TX、トリアミホス+TX、トリアラテン+  
 TX、トリアゾホス+TX、トリアズロン+TX、トリフェノホス+TX、トリナクチン  
 +TX、バミドチオン+TX、バニリプロール+TX、ベトキサジン+TX、ジオクタン  
 酸銅+TX、硫酸銅+TX、シブトリン+TX、ジクロン+TX、ジクロロフェン+TX  
 、エンドタール+TX、フェンチン+TX、消石灰+TX、ナーバム+TX、キノクラミ  
 ン+TX、キノナミド+TX、シマジン+TX、酢酸トリフェニルスズ+TX、水酸化トリ  
 フェニルスズ+TX、クルホマート+TX、ピペラジン+TX、チオフアネート+TX  
 、クロラロース+TX、フェンチオン+TX、ピリジン-4-アミン+TX、ストリキニ  
 ーネ+TX、1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン+TX、4-(キノキサリン  
 -2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド+TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩+TX  
 、プロノボール+TX、水酸化銅+TX、クレゾール+TX、ジピリチオン+TX、ド  
 ジシン+TX、フェナミノスルフ+TX、ホルムアルデヒド+TX、ヒドラルガフェン+  
 TX、カスガマイシン+TX、カスガマイシン塩酸塩一水和物+TX、ニッケルビス(ジ  
 メチルジチオカルバメート)+TX、ニトラピリン+TX、オクチリノン+TX、オキシ  
 リン酸+TX、オキシテトラサイクリン+TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩+TX  
 、プロベナゾール+TX、ストレプトマイシン+TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン  
 +TX、テクロフタラム+TX、チオメルサール+TX、リンゴコカクモンハマキ(*Ad*  
*oxophyes orana*)GV+TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター(*A*  
*grobacterium radiobacter*)+TX、ムチカブリダニ属(*Am*  
*blyseius*)の種+TX、アナグラファ・ファルシフェラ(*Anagrapha*  
*falcifera*)NPV+TX、アナグルス・アトムス(*Anagrus atom*  
*us*)+TX、アフエリヌス・アブドミナリス(*Aphelinus abdomina*  
*lis*)+TX、アフイジウス・コレマニ(*Aphidius colemani*)+TX  
 、アフイドレテス・アフイディマイザ(*Aphidoletes aphidimyza*)  
 +TX、オートグラファ・カリフォルニカ(*Autographa californ*  
*ica*)NPV+TX、パチルス・スフェリクス・ネイデ(*Bacillus sph*  
*aericus Neide*)+TX、ビューベリア・ブロングニアルティ(*Beauv*  
*eria brongniartii*)+TX、ヤマトクサカゲロウ(*Chrysope*  
*rla carnea*)+TX、ツマアカオオテントウムシ(*Cryptolaemus*  
*montrouzieri*)+TX、コドリング(*Cydia pomonella*)GV+TX、ハモグリコマユバチ(*Dacnusa sibirica*)  
 +TX、イサエアヒメコバチ(*Diglyphus isaea*)+TX、オンシツツヤコバチ(*Encarsia formosa*)  
 +TX、サバクツヤコバチ(*Eretmocerus eremicus*)  
 +TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)及びH.メギディス(*H. megidis*)  
 +TX、サカハチテントウ(*Hippodamia convergens*)  
 +TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ(*Leptomastix dactylopii*)  
 +TX、マクロロフス・カリギノス(*Macrolophus caliginosus*)  
 +TX、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)NPV+TX、メタフィ  
 カス・ヘルボルス(*Metaphycus helvolus*)  
 +TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリヅム(*Metarhizium anisopliae* var.  
*acridum*)  
 +TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae* var.  
*anisopliae*)  
 +TX、マツノキハバチ(*Neodiprion sertifer*)NPV及びN.レコンティ(*N. lecontei*)NPV+TX、オリウス属(*Orius*)の種+TX、ペシロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)  
 +TX、チリ

10

20

30

40

50

カブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) + TX、スタイナーネ  
 マ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) + TX、スタイナーネマ  
 ・カルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) + TX、スタイ  
 ナーネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) + TX、スタイ  
 ナーネマ・グラッセリ (*Steinernema glaseri*) + TX、スタイナーネ  
 マ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) + TX、スタイナーネマ  
 ・リオブラビス (*Steinernema riobravisi*) + TX、スタイナーネ  
 マ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) + TX、スタイ  
 ナーネマ属 (*Steinernema*) の種 + TX、トリコグラムマ属 (*Trichog*  
*ramma*) の種 + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (*Typhlodromus*  
*occidentalis*) + TX、パーティシリウム・レカニ (*Verticillium*  
*lecanii*) + TX、アフォレート + TX、ピサジル + TX、ブスルファン +  
 TX、ジマチフ + TX、ヘメル + TX、ヘンパ + TX、メテパ + TX、メチオテパ + TX  
 、メチルアフォレート + TX、モルジド + TX、ペンフルロン + TX、テパ + TX、チオ  
 ヘンパ + TX、チオテパ + TX、トレタミン + TX、ウレデパ + TX、(E) - デカ - 5  
 - エン - 1 - イルアセテート及び (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール + TX、(E) -  
 トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン  
 - 4 - オール + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート  
 + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデカ -  
 11 - エナール + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、  
 (Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - イ  
 コサ - 13 - エン - 10 - オン + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール + T  
 X、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン  
 - 1 - イルアセテート + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセ  
 テート + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート  
 + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX  
 、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び 4 - メ  
 チルノナン - 5 - オン + TX、アルファ - マルチストリアチン + TX、ブレビコミン + T  
 X、コドレルア + TX、コドレモン + TX、キュールア + TX、ディスパールア + TX、  
 ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イル  
 アセテート + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、ドミ  
 ニカルア + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート + TX、ユージノール + TX、フロ  
 ンタリン + TX、グランドルア + TX、グランドルア I + TX、グランドルア II + TX、  
 グランドルア III + TX、グランドルア IV + TX、ヘキサルア + TX、イブスジエノ  
 ール + TX、イブセノール + TX、ジャポニルア + TX、リネアチン + TX、リトルア +  
 TX、ルーブルア + TX、メドルア + TX、メガトモ酸 + TX、メチルユージノール + T  
 X、ムスカルア + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オ  
 クタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オルフルアルア + TX、オリク  
 タルア + TX、オストラモン + TX、シグルア + TX、ソルジジン + TX、スルカトール  
 + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、トリメドルア + TX、トリ  
 メドルア A + TX、トリメドルア B<sub>1</sub> + TX、トリメドルア B<sub>2</sub> + TX、トリメドルア C  
 + TX、トランク - コール + TX、2 - (オクチルチオ) - エタノール + TX、プトピロ  
 ノキシル + TX、プトキシ (ポリプロピレングリコール) + TX、アジピン酸ジブチル +  
 TX、フタル酸ジブチル + TX、コハク酸ジブチル + TX、ジエチルトルアミド + TX、  
 ジメチルカルベート + TX、フタル酸ジメチル + TX、エチルヘキサンジオール + TX、  
 ヘキサアミド + TX、メトキン - ブチル + TX、メチルネオデカンアミド + TX、オキサ  
 メート + TX、ピカリジン + TX、1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン + TX、1, 1 - ジ  
 クロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン + TX、1, 2 - ジクロロプロパン  
 及び 1, 3 - ジクロロプロペン + TX、1 - ブロモ - 2 - クロロエタン + TX、2, 2,  
 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) エチルアセテート + TX、2, 2 -

10

20

30

40

50

ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート + TX、2 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル ) フェニルジメチルカルバメート + TX、2 - ( 2 - ブトキシエトキシ ) エチルチオシアネート + TX、2 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル ) フェニルメチルカルバメート + TX、2 - ( 4 - クロロ - 3 , 5 - キシリルオキシ ) エタノール + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート + TX、2 - イミダゾリドン + TX、2 - イソバレリルインダン - 1 , 3 - ジオン + TX、2 - メチル ( プロパ - 2 - イニル ) アミノフェニルメチルカルバメート + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート + TX、3 - ブロモ - 1 - クロロプロパ - 1 - エン + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート + TX、4 - メチル ( プロパ - 2 - イニル ) アミノ - 3 , 5 - キシリルメチルカルバメート + TX、5 , 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート + TX、アセチオン + TX、アクリロニトリル + TX、アルドリン + TX、アロサミジン + TX、アリキシカルブ + TX、アルファ - エクジソン + TX、リン化アルミニウム + TX、アミノカルブ + TX、アナバシン + TX、アチダチオン + TX、アザメチホス + TX、バチルス・チューリングシス ( *Bacillus thuringiensis* ) デルタ内毒素 + TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム + TX、バ多硫化バリウム + TX、バルトリン + TX、Bayer 22 / 190 + TX、Bayer 22408 + TX、ベータ - シフルトリン + TX、ベータ - シペルメトリン + TX、ピオエタノメトリン + TX、ピオペルメトリン + TX、ビス ( 2 - クロロエチル ) エーテル + TX、ホウ砂 + TX、プロムフェンピンホス + TX、プロモ - DDT + TX、ブフェンカルブ + TX、ブタカルブ + TX、ブタチオホス + TX、ブトナート + TX、ヒ酸カルシウム + TX、シアン化カルシウム + TX、二硫化炭素 + TX、四塩化炭素 + TX、カルタップ塩酸塩 + TX、セバジン + TX、クロルピシクレン + TX、クロルデン + TX、クロルデコン + TX、クロロホルム + TX、クロロピクリン + TX、クロルホキシム + TX、クロルプラゾホス + TX、シス - レスメトリン + TX、シスメトリン + TX、クロシトリン + TX、アセト亜ヒ酸銅 + TX、ヒ酸銅 + TX、オレイン酸銅 + TX、クミトエート + TX、氷晶石 + TX、CS 708 + TX、シアノフェンホス + TX、シアノホス + TX、シクレトリン + TX、サイチオアート + TX、d - テトラメトリン + TX、DAEP + TX、ダゾメット + TX、デカルボフラン + TX、ジアミダホス + TX、ジカプトン + TX、ジクロフェンチオン + TX、ジクレシル + TX、ジシクラニル + TX、ジエルドリン + TX、ジエチル 5 - メチルピラゾール - 3 - イルホスフェート + TX、ジロール + TX、ジメフルトリン + TX、ジメタン + TX、ジメトリン + TX、ジメチルピンホス + TX、ジメチラン + TX、ジノプロブ + TX、ジノサム + TX、ジノセブ + TX、ジオフェノラン + TX、ジオキサベンゾホス + TX、ジチクロホス + TX、DSP + TX、エクジステロン + TX、EI 1642 + TX、EMPIC + TX、EPBP + TX、エタホス + TX、エチオフエンカルブ + TX、ギ酸エチル + TX、二臭化エチレン + TX、二塩化エチレン + TX、エチレンオキシド + TX、EXD + TX、フェンクロルホス + TX、フェネタカルブ + TX、フェニトロチオン + TX、フェノキサクリム + TX、フェンピリトリン + TX、フェンスルホチオン + TX、フェンチオン - エチル + TX、フルコフロン + TX、ホスメチラン + TX、ホスピラート + TX、ホスチエタン + TX、フラチオカルブ + TX、フレトリン + TX、グアザチン + TX、酢酸グアザチン + TX、テトラチオ炭酸ナトリウム + TX、ハルフェンブロックス + TX、HCH + TX、HEOD + TX、ヘプタクロール + TX、ヘテロホス + TX、HHDN + TX、シアン化水素 + TX、ヒキンカルブ + TX、IPSP + TX、イサザホス + TX、イソベンザン + TX、イソドリン + TX、イソフェンホス + TX、イソラン + TX、イソプロチオラン + TX、イソオキサチオン + TX、幼若ホルモン I + TX、幼若ホルモン II + TX、幼若ホルモン III + TX、ケレバン + TX、キノブレン + TX、ヒ酸鉛 + TX、レプトホス + TX、リリムホス + TX、リチダチオン + TX、m - クメニルメチルカルバメート + TX、リン化マグネシウム + TX、マジドックス + TX、メカルフォン + TX、メナゾン + TX、塩化第一水銀 + TX、メスルフェンホス + TX、メタム + TX、メタム - カリウム + TX、メタム - ナトリウム + TX、フッ化メタンスルホニル + TX、メトクロトホス

10

20

30

40

50

+ T X、メトブレン+ T X、メトトリン+ T X、メトキシクロール+ T X、メチルイソチ  
 オシアネート+ T X、メチルククロホルム+ T X、塩化メチレン+ T X、メトキアジアゾ  
 ン+ T X、ミレックス+ T X、ナフタロホス+ T X、ナフタレン+ T X、N C - 1 7 0 +  
 T X、ニコチン+ T X、硫酸ニコチン+ T X、ニチアジン+ T X、ノルニコチン+ T X、  
 O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニル O - エチルエチルホスホノチオエート+ T X、O  
 , O - ジエチル O - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 7 - イルホスホロチオエ  
 ート+ T X、O , O - ジエチル O - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 - イルホス  
 ホロチオエート+ T X、O , O , O ' , O ' - テトラプロピルジチオピロホスフェート+ T  
 X、オレイン酸+ T X、パラ - ジクロロベンゼン+ T X、パラチオン - メチル+ T X、ペ  
 ンタクロロフェノール+ T X、ラウリン酸ペンタクロロフェニル+ T X、P H 6 0 - 3  
 8 + T X、フェンカプトン+ T X、ホスニコロール+ T X、ホスフィン+ T X、ホキシム  
 - メチル+ T X、ピリメタホス+ T X、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体+ T X、  
 亜ヒ酸カリウム+ T X、チオシアン酸カリウム+ T X、プレコセン I + T X、プレコセン  
 I I + T X、プレコセン I I I + T X、プリミドホス+ T X、プロフルトリン+ T X、プ  
 ロメカルブ+ T X、プロチオホス+ T X、ピラゾホス+ T X、ピレスメトリン+ T X、ク  
 アッシア+ T X、キナルホス - メチル+ T X、キノチオン+ T X、ラホキサニド+ T X、  
 レスメトリン+ T X、ロテノン+ T X、カデトリン+ T X、リアニア+ T X、リアノジン  
 + T X、サバジラ ) + T X、シュラーダン+ T X、セブホス+ T X、S I - 0 0 0 9 + T  
 X、チアプロニル+ T X、亜ヒ酸ナトリウム+ T X、シアン化ナトリウム+ T X、フッ化  
 ナトリウム+ T X、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム+ T X、ナトリウムペンタクロロフ  
 ェノキシド+ T X、セレン酸ナトリウム+ T X、チオシアン酸ナトリウム+ T X、スルコ  
 フロン+ T X、スルコフロン - ナトリウム+ T X、フッ化スルフリル+ T X、スルプロホ  
 ス+ T X、タール油+ T X、タジムカルブ+ T X、T D E + T X、テブピリミホス+ T X  
 、テメホス+ T X、テラレトリン+ T X、テトラクロロエタン+ T X、チクロホス+ T X  
 、チオシクラム+ T X、チオシクラムシュウ酸塩+ T X、チオナジン+ T X、チオスルタ  
 ップ+ T X、チオスルタップ - ナトリウム+ T X、トラロメトリン+ T X、トランスペル  
 メトリン+ T X、トリアザメエート+ T X、トリクロルメタホス - 3 + T X、トリクロロ  
 ナート+ T X、トリメタカルブ+ T X、トルプロカルブ+ T X、トリクロピリカルブ+ T  
 X、トリブレン+ T X、ベラトリジン+ T X、ベラトリン+ T X、X M C + T X、ゼタメ  
 トリン+ T X、リン化亜鉛+ T X、ゾラプロホス+ T X 及びメペルフルトリン+ T X、テ  
 トラメチルフルトリン+ T X、ビス (トリブチルスズ) オキシド+ T X、プロモアセトア  
 ミド+ T X、リン酸第 2 鉄+ T X、ニクロサミド - オラミン+ T X、トリブチルスズオキ  
 シド+ T X、ピリモルフ+ T X、トリフェンモルフ+ T X、1 , 2 - ジブromo - 3 - クロ  
 ロプロパン+ T X、1 , 3 - ジクロロプロベン+ T X、3 , 4 - ジクロロテトラヒドロチ  
 オフェン 1 , 1 - ジオキシド+ T X、3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メチルローダニ  
 ン+ T X、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1 , 3 , 5 - チアアジナ - 3 - イル酢酸+ T  
 X、6 - イソペンテニルアミノプリン+ T X、2 - フルオロ - N - ( 3 - メトキシフェニ  
 ル ) - 9 H - プリン - 6 - アミン+ T X、ベンクロチアズ+ T X、サイトカイニン+ T X  
 、D C I P + T X、フルフラール+ T X、イサミドホス+ T X、キネチン+ T X、クワ暗  
 斑病菌 ( *Myrothecium verrucaria* ) 組成物+ T X、テトラクロロ  
 チオフェン+ T X、キシレノール+ T X、ゼアチン+ T X、エチルキサントゲン酸カリウ  
 ム+ T X、アシベンゾラル+ T X、アシベンゾラル - S - メチル+ T X、オオイタドリ ( *Reynoutria sachalinensis* ) 抽出物+ T X、アルファ - クロロ  
 ヒドリン+ T X、アンチュ+ T X、炭酸バリウム+ T X、ビスチオセミ+ T X、プロディ  
 ファコウム+ T X、プロマジオロン ( アルファ - プロマジオロンを含めた ) + T X、プロ  
 メタリン+ T X、クロロファシノン+ T X、コレカルシフェロール+ T X、クマクロル+  
 T X、クマフリル+ T X、クマテトラリル+ T X、クリミジン+ T X、ジフェナコウム+  
 T X、ジフェチアロン+ T X、ジファシノン+ T X、エルゴカルシフェロール+ T X、フ  
 ロクマフェン+ T X、フルオロアセトアミド+ T X、フルプロバジン+ T X、フルプロバ  
 ジン塩酸塩+ T X、ノルボルミド+ T X、ホサセチム+ T X、リン+ T X、ピンドン+ T

10

20

30

40

50

X、ピリヌロン+TX、シリロシド+TX、フルオロ酢酸ナトリウム+TX、硫酸タリウム+TX、ワルファリン+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン+TX、ファルネソール及びネロリドール+TX、ベルブチン+TX、MGK 264+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピプロタル+TX、プロピル異性体+TX、S421+TX、セサメックス+TX、セサモリン+TX、スルホキシド+TX、アントラキノン+TX、ナフテン酸銅+TX、オキシ塩化銅+TX、ジシクロペンタジエン+TX、チラム+TX、ナフテン酸亜鉛+TX、ザイラム+TX

、イマニン+TX、リバピリン+TX、酸化第二水銀+TX、チオファネート-メチル+TX、アザコナゾール+TX、ピテルタノール+TX、ブロムコナゾール+TX、シブコナゾール+TX、ジフェノコナゾール+TX、ジニコナゾール+TX、エポキシコナゾール+TX、フェンブコナゾール+TX、フルキンコナゾール+TX、フルシラゾール+TX、フルトリアホル+TX、フラメトピル+TX、ヘキサコナゾール+TX、イマザリル+TX、イミベン-コナゾール+TX、イブコナゾール+TX、メトコナゾール+TX、ミクロブタニル+TX、バクロブトラゾール+TX、ベフラゾエート+TX、ペンコナゾール+TX、プロチオコナゾール+TX、ピリフェノックス+TX、プロクロラズ+TX、プロピコナゾール+TX、ピリソオキサゾール+TX、シメコナゾール+TX、テブコナゾール+TX、テトラコナゾール+TX、トリアジメホン+TX、トリアジメノール+TX、トリフルミゾール+TX、トリチコナゾール+TX、アンシミドール+TX、フェナリモル+TX、ヌアリモール+TX、ブピリメート+TX、ジメチリモール+TX、エチリモール+TX、ドデモルフ+TX、フェンプロピディン+TX、フェンプロピモルフ+TX、スピロキサミン+TX、トリデモルフ+TX、シブロジニル+TX、メパニピリム+TX、ピリメタニル+TX、フェンピクロニル+TX、フルジオキソニル+TX、ベナラキシル+TX、フララキシル+TX、メタラキシル+TX、R-メタラキシル+TX、オフレース+TX、オキサジキシル+TX、カルベンダジム+TX、デバカルブ+TX、フベリダゾール+TX、チアベンダゾール+TX、クロゾリネート+TX、ジクロゾリン+TX、ミクロゾリン+TX、プロシミドン+TX、ピンクロゾリン+TX、ボスカリド+TX、カルボキシシン+TX、フェンフラム+TX、フルトラニル+TX、メプロニル+TX、オキシカルボキシシン+TX、ベンチオピラド+TX、チフルザミド+TX、ドジン+TX、イミノクタジン+TX、アゾキシストロピン+TX、ジモキシストロピン+TX、エネストロプリン+TX、フェナミンストロピン+TX、フルフェノキシストロピン+TX、フルオキサストロピン+TX、クレソキシム-メチル+TX、メトミノストロピン+TX、トリフロキシストロピン+TX、オリサストロピン+TX、ピコキシストロピン+TX、ピラクロストロピン+TX、ピラメトストロピン+TX、ピラオキシストロピン+TX、ファーバム+TX、マンコゼブ+TX、マネブ+TX、メチラム+TX、プロピネブ+TX、ジネブ+TX、カプタホル+TX、キャプタン+TX、フルオロイミド+TX、ホルペット+TX、トリルフルアニド+TX、ボルドー液+TX、酸化銅+TX、マンコッパー+TX、オキシシン銅+TX、ニトロタル-イソプロピル+TX、エディフェンホス+TX、イブロベンホス+TX、ホスジフェン+TX、トルクロホス-メチル+TX、アリラジン+TX、ベンチアバリカルブ+TX、プラストサイジン-S+TX、クロロネブ+TX、クロロ-タ-ロニル+TX、シフルフェナミド+TX、シモキサニル+TX、シクロブトリフルラム+TX、ジクロシメット+TX、ジクロメジン+TX、ジクロラン+TX、ジエトフェンカルブ+TX、ジメトモルフ+TX、フルモルフ+TX、ジチアノン+TX、エタボキサム+TX、エトリジアゾール+TX、ファモキサドン+TX、フェナミドン+TX、フェノキサニル+TX、フェリムゾン+TX、フルアジナム+TX、フルオピコリド+TX、フルスルファミド+TX、フルキサピロキサド+TX、フェンヘキサミド+TX、ホセチル-アルミニウム+TX、ヒメキサゾール+TX、イブロバリカルブ+TX、シアゾファミド+TX、メタスルホカルブ+TX、メトラフェノン+TX、ペンシクロン+TX、フタリド+TX、ポリオキシシン+TX、プロバモカルブ+TX、ピリベンカルブ+TX、プロキナジド+TX、ピロキロン+TX、ピリオフェノ

10

20

30

40

50

ン+TX、キノキシフェン+TX、キントゼン+TX、チアジニル+TX、トリアゾキシ  
 ド+TX、トリシクラゾール+TX、トリフォリン+TX、バリダマイシン+TX、バリ  
 フェナレート+TX、ゾキサミド+TX、マンジプロパミド+TX、フルベネテラム+T  
 X、イソピラザム+TX、セダキサン+TX、ベンゾビンジフルピル+TX、ビジフルメ  
 トフェン+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン  
 酸(3',4',5'-トリフルオロ-ピフェニル-2-イル)-アミド+TX、イソフルシ  
 プラム+TX、イソチアニル+TX、ジピメチトロン+TX、6-エチル-5,7-ジオ  
 キソ-ピロロ[4,5][1,4]ジチイノ[1,2-c]イソチアゾール-3-カルボ  
 ニトリル+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[3-エチル-1,1-ジメチル-イン  
 ダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、4-(2,6-ジフルオロフ  
 ェニル)-6-メチル-5-フェニル-ピリダジン-3-カルボニトリル+TX、(R)  
 -3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[1,1,3-トリメチルインダン-4  
 -イル]ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、4-(2-プロモ-4-フルオロ-フ  
 ェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾ  
 ール-3-アミン+TX、4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ  
 -6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン+TX、  
 フルインダビル+TX、クメトキシストロピン(ジアキシアングジュンジー)+TX、ル  
 ベンミキシアナン+TX、ジクロベンチアゾクス+TX、マンデストロピン+TX、3-  
 (4,4-ジフルオロ-3,4-ジヒドロ-3,3-ジメチルイソキノリン-1-イル)  
 キノロン+TX、2-[2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチル-3-キノリ  
 ル)オキシ]フェニル]プロパン-2-オール+TX、オキサチアピプロリン+TX、t  
 e r t -ブチルN-[6-[[[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メ  
 チレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート+TX、ピラジフルミド  
 +TX、インビルフルキサム+TX、トルプロカルブ+TX、メフェントリフルコナゾ  
 ール+TX、イブフェントリフルコナゾール+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(  
 3R)-3-エチル-1,1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキ  
 サミド+TX、N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシ-フェニル)-N-エチル-N  
 -メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[4-(4,5-ジクロロチアゾール-2-イル  
 )オキシ-2,5-ジメチル-フェニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+  
 TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール  
 -1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ  
 イソオキサゾール-5-イル]-3-クロロ-フェニル]メタンスルホネート+TX、ブ  
 タ-3-イニルN-[6-[[[(Z)-[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェ  
 ニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート+TX、メチル  
 N-[[5-[4-(2,4-ジメチルフェニル)トリアゾール-2-イル]-2-メチ  
 ル-フェニル]メチル]カルバメート+TX、3-クロロ-6-メチル-5-フェニル-  
 4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン+TX、ピリダクロメチル+TX  
 、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[1,1,3-トリメチルインダン-4  
 -イル]ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、1-[2-[1-(4-クロロフェ  
 ニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-  
 テトラゾール-5-オン+TX、1-メチル-4-[3-メチル-2-[[2-メチル-  
 4-(3,4,5-トリメチルピラゾール-1-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]  
 テトラゾール-5-オン+TX、アミノピリフェン+TX、アメトクトラジン+TX、ア  
 ミスルプロム+TX、ペンフルフェン+TX、(Z,2E)-5-[1-(4-クロロフ  
 ェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペン  
 タ-3-エナミド+TX、フロリルピコキサミド+TX、フェンピコキサミド+TX、テ  
 ブフロキン+TX、イブフルフェノキン+TX、キノフメリン+TX、イソフェタミド+  
 TX、N-[2-[2,4-ジクロロ-フェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチ  
 ル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、N-[2-[2-クロロ-  
 4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-

10

20

30

40

50

メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド + T X、ベンゾチオストロピン + T X、フェナ  
 マクリル + T X、5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール亜鉛塩 (2 :  
 1) + T X、フルオピラム + T X、フルチアニル + T X、フルオピモミド + T X、ピラブ  
 ロポイン + T X、ピカルブトラゾクス + T X、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エ  
 チル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、  
 2 - (ジフルオロメチル) - N - ((3 R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イ  
 ル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフ  
 ェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1  
 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + T X、メチルテトラプロ  
 ール + T X、2 - (ジフルオロメチル) - N - ((3 R) - 1, 1, 3 - トリメチルイン  
 ダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、 - (1, 1 - ジメチルエチル)  
 ) - - [4' - (トリフルオロメトキシ) [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル] - 5 -  
 ピリミジンメタノール + T X、フルオキサピプロリン + T X、エノキサストロピン + T X  
 、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒド  
 ロキシ - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキ  
 シ] ベンゾニトリル + T X、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1,  
 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - スルファニル - 1, 2, 4 - トリアゾール  
 - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + T X、4 - [[6 -  
 [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5  
 - チオキソ - 4 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル]  
 ] オキシ] ベンゾニトリル + T X、トリネキサバック + T X、クモキシストロピン + T X  
 、ズホングシェングマイシン + T X、チオジアゾール銅 + T X、亜鉛チアゾール + T X、  
 アメクトラクチン + T X、イプロジオン + T X、N - オクチル - N' - [2 - (オクチル  
 アミノ) エチル] エタン - 1, 2 - ジアミン + T X; N' - [5 - プロモ - 2 - メチル - 6  
 - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル  
 - N - メチル - ホルムアミジン + T X、N' - [5 - プロモ - 2 - メチル - 6 - [(1 R)  
 - 1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル  
 - ホルムアミジン + T X、N' - [5 - プロモ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロ  
 ボキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X  
 、N' - [5 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ) - 3  
 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、N' - [5 - プロモ - 2  
 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - イソ  
 プロピル - N - メチル - ホルムアミジン + T X (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 5  
 / 1 5 5 0 7 5 号に記載されている方法から調製され得る); N' - [5 - プロモ - 2 - メ  
 チル - 6 - (2 - プロボキシプロボキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル -  
 ホルムアミジン + T X (この化合物は、I P C O M 0 0 0 2 4 9  
 8 7 6 D に記載されている方法から調製され得る); N - イソプロピル - N' - [5 - メト  
 キシ - 2 - メチル - 4 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - フェニル -  
 エチル) フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + T X、N' - [4 - (1 - シクロプロ  
 ピル - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - エチル) - 5 - メトキシ - 2 - メチ  
 ル - フェニル] - N - イソプロピル - N - メチル - ホルムアミジン + T X (これらの化合  
 物は、国際公開第 2 0 1 8 / 2 2 8 8 9 6 号に記載されている方法から調製され得る);  
 N - エチル - N' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [(2 - トリフルオロメチル) オキ  
 セタン - 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + T X、N - エチル - N' -  
 [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [(2 - トリフルオロメチル) テトラヒドロフラン -  
 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + T X (これらの化合物は、国際公  
 開第 2 0 1 9 / 1 1 0 4 2 7 号に記載されている方法から調製され得る); N - [(1 R)  
 ) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル] - 8 - フルオロ - キノ  
 リン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [(1 S) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メ  
 チル - ブタ - 3 - エニル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N -

10

20

30

40

50

[ ( 1 R ) - 1 - ベンジル - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 1 - メチル - プロピル ] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [ ( 1 S ) - 1 - ベンジル - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 1 - メチル - プロピル ] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [ ( 1 R ) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] - 7 , 8 - ジフルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [ ( 1 S ) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] - 7 , 8 - ジフルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、8 - フルオロ - N - [ ( 1 R ) - 1 - [ ( 3 - フルオロフェニル ) メチル ] - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、8 - フルオロ - N - [ ( 1 S ) - 1 - [ ( 3 - フルオロフェニル ) メチル ] - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [ ( 1 R ) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - [ ( 1 S ) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル ] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - ( ( 1 R ) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル ) - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X、N - ( ( 1 S ) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル ) - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + T X ( これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 1 5 3 3 8 0 号に記載されている方法から調製され得る ) ;

10

1 - ( 6 , 7 - ジメチルピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) - 4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X、1 - ( 6 , 7 - ジメチルピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) - 4 , 4 , 6 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X、4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - ( 6 - メチルピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) イソキノリン + T X、4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - ( 7 - メチルピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) イソキノリン + T X、1 - ( 6 - クロロ - 7 - メチル - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 3 - イル ) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X ( これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 5 5 1 0 号に記載されている方法から調製され得る ) ; 1 - ( 4 , 5 - ジメチルベンゾイミダゾール - 1 - イル ) - 4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X、1 - ( 4 , 5 - ジメチルベンゾイミダゾール - 1 - イル ) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X、6 - クロロ - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - ( 4 - メチルベンゾイミダゾール - 1 - イル ) イソキノリン + T X、4 , 4 - ジフルオロ - 1 - ( 5 - フルオロ - 4 - メチル - ベンゾイミダゾール - 1 - イル ) - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X、3 - ( 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリン ) - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [ e ] ベンゾイミダゾール + T X ( これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 0 8 5 号に記載されている方法から調製され得る ) ; N - メトキシ - N - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] シクロプロパンカルボキサミド + T X、N , 2 - ジメトキシ - N - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] プロパンアミド + T X、N - エチル - 2 - メチル - N - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] プロパンアミド + T X、1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] 尿素 + T X、1 , 3 - ジメトキシ - 1 - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] 尿素 + T X、3 - エチル - 1 - メトキシ - 1 - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] 尿素 + T X、N - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] プロパンアミド + T X、4 , 4 - ジメチル - 2 - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ] メチル ] イソオキサゾリジン - 3 - オン + T X、5 , 5 - ジメチル - 2 - [ [ 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] フェニル ]

20

30

40

50



メチル] イソオキサゾリジン - 3 - オン + TX、エチル 1 - [ [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + TX、N, N - ジメチル - 1 - [ [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - アミン + TX。このパラグラフにおける化合物は、国際公開第 2017/055473 号、国際公開第 2017/055469 号、国際公開第 2017/093348 号及び国際公開第 2017/118689 号に記載されている方法から調製され得る； 2 - [ 6 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載されている方法から調製され得る)； 2 - [ 6 - (4 - ブロモフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載されている方法から調製され得る)； 3 - [ 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + TX (この化合物は、国際公開第 2016/156290 号に記載されている方法から調製され得る)； 3 - [ 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + TX (この化合物は、国際公開第 2016/156290 号に記載されている方法から調製され得る)； (4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + TX (この化合物は、国際公開第 2014/006945 号に記載されている方法から調製され得る)； 2, 6 - ジメチル - 1H, 5H - [ 1, 4 ] ジチイノ [ 2, 3 - c : 5, 6 - c' ] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テトラオン + TX (この化合物は、国際公開第 2011/138281 号に記載されている方法から調製され得る)； N - メチル - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゼンカルボチオアミド + TX； N - メチル - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX； (Z, 2E) - 5 - [ 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシ - 2 - メトキシイミノ - N, 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エナミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/153707 号に記載されている方法から調製され得る)； N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX； N' - [ 2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロフェノキシ) - 5 - メチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (この化合物は、国際公開第 2016/202742 号に記載されている方法から調製され得る)； 2 - (ジフルオロメチル) - N - [ (3S) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (この化合物は、国際公開第 2014/095675 号に記載されている方法から調製され得る)； (5 - メチル - 2 - ピリジル) - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX、(3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イル) - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2017/220485 号に記載されている方法から調製され得る)； 2 - オキソ - N - プロピル - 2 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/065414 号に記載されている方法から調製され得る)； エチル 1 - [ [ 5 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + TX (この化合物は、国際公開第 2018/158365 号に記載されている方法から調製され得る)； 2, 2 - ジフルオロ - N - メチル - 2 - [ 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX、N - [ (E) - メトキシイミノメチル] - 4 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + T

10

20

30

40

50

X、N - [ ( Z ) - メトキシイミノメチル ] - 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] ベンズアミド + TX、N - [ N - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル ] - 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ] ベンズアミド + TX ( これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 2 0 2 4 2 8 号に記載されている方法から調製され得る ) ;

以下のものを含む微生物：アシネトバクター・ルオフイイ ( *Acinetobacter lwoffii* ) + TX、アクレモニウム・アルタナツム ( *Acremonium alternatum* ) + TX + TX、アクレモニウム・セファロスポリウム ( *Acremonium cephalosporium* ) + TX + TX、アクレモニウム・ディオスピリ ( *Acremonium diospyri* ) + TX、アクレモニウム・オブクラバツム ( *Acremonium obclavatum* ) + TX、リンゴコカクモンハマキ・グラニュロウイルス ( *Adoxophyes orana granulovirus* ) ( *AdoxGV* ) ( *Capex* ( 登録商標 ) ) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター ( *Agrobacterium radiobacter* ) 菌株 K 8 4 ( *Galltrol - A* ( 登録商標 ) ) + TX、アルテルナリア・アルテルナータ ( *Alternaria alternate* ) + TX、アルテルナリア・カシアエ ( *Alternaria cassia* ) + TX、アルテルナリア・デストルエンス ( *Alternaria destruens* ) ( *Smolder* ( 登録商標 ) ) + TX、アンペロマイセス・キスカリス ( *Ampelomyces quisqualis* ) ( *AQ 10* ( 登録商標 ) ) + TX、アスペルギルス・フラバス ( *Aspergillus flavus* ) AF 3 6 ( *AF 3 6* ( 登録商標 ) ) + TX、アスペルギルス・フラバス ( *Aspergillus flavus* ) NRRL 2 1 8 8 2 ( *Aflaguard* ( 登録商標 ) ) + TX、アスペルギルス属 ( *Aspergillus* ) の種 + TX、アウレオバシジウム・プルランス ( *Aureobasidium pullulans* ) + TX、アゾスピリillum属 ( *Azospirillum* ) + TX、( *MicroAZ* ( 登録商標 ) ) + TX、TAZO B ( 登録商標 ) ) + TX、アゾトバクター属 ( *Azotobacter* ) + TX、アゾトバクター・クロオコッカム ( *Azotobacter chroococcum* ) ( *Azotomeal* ( 登録商標 ) ) + TX、アゾトバクター ( *Azotobacter* ) シスト ( *Bionatural Blooming Blossoms* ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・アミロリケファシエンス ( *Bacillus amyloliquefaciens* ) + TX、バチルス・セレウス ( *Bacillus cereus* ) + TX、バチルス・キチノスポルス ( *Bacillus chitinosporus* ) 菌株 CM - 1 + TX、バチルス・キチノスポルス ( *Bacillus chitinosporus* ) 菌株 AQ 7 4 6 + TX、バチルス・リケニフォルミス ( *Bacillus licheniformis* ) 菌株 HB - 2 ( *Biostart* ( 商標 ) *Rhizoboost* ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・リケニフォルミス ( *Bacillus licheniformis* ) 菌株 3 0 8 6 ( *EcoGuard* ( 登録商標 ) ) + TX、Green Releaf ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・サーキュランス ( *Bacillus circulans* ) + TX、バチルス・フィルムス ( *Bacillus firmus* ) ( *BioSafe* ( 登録商標 ) ) + TX、BioNem - WP ( 登録商標 ) + TX、VOTiVO ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・フィルムス ( *Bacillus firmus* ) 菌株 I - 1 5 8 2 + TX、バチルス・マセランス ( *Bacillus macerans* ) + TX、バチルス・マリスモルトウイ ( *Bacillus marismortui* ) + TX、バチルス・メガテリウム ( *Bacillus megaterium* ) + TX、バチルス・ミコイデス ( *Bacillus mycoides* ) 菌株 AQ 7 2 6 + TX、バチルス・ポピリエ ( *Bacillus papillae* ) ( *Milky Spore Powder* ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・プミルス ( *Bacillus pumilus* ) の種 + TX、バチルス・プミルス ( *Bacillus pumilus* ) 菌株 GB 3 4 ( *Yield Shield* ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・プミルス ( *Bacillus pumilus* ) 菌株 AQ 7 1 7 + TX、バチルス・プミルス ( *Bacillus pumi*

lus) 菌株 QST 2808 (Sonata (登録商標) + TX、Ballad Plus (登録商標) + TX、バチルス・スフェリカス (Bacillus spahericus) (VectoLex (登録商標) + TX、バチルス属 (Bacillus) の種 + TX、バチルス属 (Bacillus) の種の菌株 AQ175 + TX、バチルス属 (Bacillus) の種の菌株 AQ177 + TX、バチルス属 (Bacillus) の種の菌株 AQ178 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST 713 (CEASE (登録商標) + TX、Serenade (登録商標) + TX、Rhapsody (登録商標) + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST 714 (JAZZ (登録商標) + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 AQ153 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 AQ743 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST3002 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST3004 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 変種アミロリケファシエンス (amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標) + TX、Rhizopro (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) Cry 2Ae + TX、バチルス・チューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) Cry1Ab + TX、バチルス・チューリングゲンシス・アイザワイ (Bacillus thuringiensis aizawai) GC 91 (Agree (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス・イスラエシス (Bacillus thuringiensis israelensis) (BMP123 (登録商標) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、Vecto Bac (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス・クルスターキ (Bacillus thuringiensis kurstaki) (Javelin (登録商標) + TX、Deliver (登録商標) + TX、CryMax (登録商標) + TX、Bonide (登録商標) + TX、Scutella WP (登録商標) + TX、Turilav WP (登録商標) + TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel WP (登録商標) + TX、Biobit (登録商標) + TX、Foray (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス・クルスターキ (Bacillus thuringiensis kurstaki) BMP 123 (Baritone (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス・クルスターキ (Bacillus thuringiensis kurstaki) HD-1 (Bioprotec-CAF/3P (登録商標) + TX、バチルス・チューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) 菌株 BD#32 + TX、バチルス・チューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) 菌株 AQ52 + TX、バチルス・チューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) 変種アイザワイ (aizawai) (XenTari (登録商標) + TX、Dipel (登録商標) + TX、細菌種 (GROWM END (登録商標) + TX、GROWSWEET (登録商標) + TX、Shootup (登録商標) + TX、クラビバクター・ミシガネシス (Clavipacter michiganensis) のバクテリオファージ (AgriPhage (登録商標) + TX、Bakflor (登録商標) + TX、白きょう病菌 (Beauveria bassiana) (Beaugenic (登録商標) + TX、Brocaril WP (登録商標) + TX、白きょう病菌 (Beauveria bassiana) GHA (Mycotrol ES (登録商標) + TX、Mycotrol O (登録商標) + TX、BotaniGuard (登録商標) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (Beauveria brongniartii) (Engerlingspilz (登録商標) + TX、Schweizer Beauveria (登録商標) + TX、Melocont (登録商標) + TX、ビューベリア属 (Beauveria) の種 + TX、灰色かび病菌 (Botrytis cineria) + TX、ブラディリゾビウム・ジャポニクム (Bradyrhizobium japonicum) (TerraMax (登録商標) + TX、ブレビバチルス・ブレビス (Brevibacillus brevis

)+TX、バチルス・チューリングエンシス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (Novodor (登録商標))+TX、  
 BtBooster+TX、バークホルデルリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録商標))+TX、Intercept (登録商標)  
 +TX、Blue Circle (登録商標))+TX、バークホルデルリア・グラディ (*Burkholderia gladii*) +TX、バークホルデルリア・グラディオリ (*Burkholderia gladioli*) +TX、バークホルデルリア属 (*Burkholderia*) の種+TX、セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標))+TX、カンジダ・ブチリ (*Candida butyri*) +TX、カンジダ・  
 ファマータ (*Candida famata*) +TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructus*) +TX、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) +TX、カンジダ・ギリエルモンディ (*Candida guilliermondii*) +TX、カンジダ・メリビオシカ (*Candida melibiosica*) +TX、カンジダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株O+TX、  
 カンジダ・パラプシロシス (*Candida parapsilosis*) +TX、カンジダ・ペリキュローザ (*Candida pelliculosa*) +TX、カンジダ・プルケリマ (*Candida pulcherrima*) +TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candida reukaufii*) +TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標))+TX、Biocure (登録商標))+TX、カンジダ・サケ (*Candida sake*) +TX、カンジダ属 (*Candida*) の種+TX、カンジダ・テヌイス (*Candida tenuis*) +TX、セデセア・ダビセ (*Cedecia dravisae*) +TX、セルロモナス・フラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) +TX、カエトミウム・コクリオイデス (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide (登録商標))+TX、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標))+TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (Grandevo (登録商標))+TX、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) +TX、クラドスポリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) +TX、クラドスポリウム・クロロセファルム (*Cladosporium chlorocephalum*) +TX、クラドスポリウム属 (*Cladosporium*) の種+TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) +TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*) (EndoFine (登録商標))+TX、コレトトリクム・アクタータム (*Colletotrichum acutatum*) +TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標))+TX、コニオチリウム属 (*Coniothyrium*) の種+TX、クリプトコッカス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標))+TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus humicola*) +TX、クリプトコッカス・インフィルモ・ミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatum*) +TX、クリプトコッカス・ローレンティ (*Cryptococcus laurentii*) +TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標))+TX、カプリアビダス・カンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) +TX、コドリリング顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標))+TX、コドリリング顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標))+TX、Madex Plus (登録

10

20

30

40

50

商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標) + TX  
 、エピコウヤクタケ (Cylindrobasidium laeve) (Stumpo  
 ut (登録商標) + TX、シリンドロクラジウム属 (Cylindrocladium  
 ) + TX、デバリオマイセス・ハンセニイ (Debaryomyces hansenii  
 ) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (Drechslera hawaiiensis  
 ) + TX、エンテロバクター・クロアカ (Enterobacter cloacae)  
 ) + TX、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae) + TX、エント  
 モフトラ・ビルレンタ (Entomophthora virulenta) (Vektor  
 (登録商標) + TX、エピコッカム・ニグラム (Epicoccum nigrum  
 ) + TX、エピコッカム・パーパラセンス (Epicoccum purpurascens  
 ) + TX、エピコッカム属 (Epicoccum) の種 + TX、フィロバシディウム  
 ・フロリフォルメ (Filobasidium floriforme) + TX、フザリ  
 ウム・アクミナツム (Fusarium acuminatum) + TX、フザリウム・  
 クラミドスポルム (Fusarium chlamydosporum) + TX、フザリ  
 ウム・オキシスポラム (Fusarium oxysporum) (Fusaclean  
 (登録商標) / Biofox C (登録商標) + TX、フザリウム・プロリフェラツム  
 (Fusarium proliferatum) + TX、フザリウム属 (Fusarium)  
 の種 + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (Galactomyces geotrichum)  
 + TX、グリオクラジウム・カテヌラツム (Gliocladium catenulatum)  
 (Primastop (登録商標) + TX、Prestop (登録商標) + TX、  
 グリオクラジウム・ロセウム (Gliocladium roseum) + TX、  
 グリオクラジウム属 (Gliocladium) の種 (Soil Gard  
 (登録商標) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens)  
 (Soilgard (登録商標) + TX、グラニューロウイルス (Granulovirus)  
 (Granupom (登録商標) + TX、ハロバチルス・ハロフィラス  
 (Halobacillus halophilus) + TX、ハロバチルス・リトラリス  
 (Halobacillus litoralis) + TX、ハロバチルス・トルウエ  
 ペリ (Halobacillus trueperi) + TX、ハロモナス属 (Halomonas)  
 の種 + TX、ハロモナス・スブグラシエスコラ (Halomonas subglaciescola)  
 + TX、ハロビブリオ・バリアビリス (Halovibrio variabilis)  
 + TX、ハンセニアスポラ・ウバルム (Hanseniaspora uvarum)  
 + TX、オオタバコガ (Helicoverpa armigera) 核多角体病ウイルス  
 (Helicovex (登録商標) + TX、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea)  
 核多角体病ウイルス (Gemstar (登録商標) + TX、イソフラボン・  
 ホルモノネチン (Myconate (登録商標) + TX、クロエケラ・  
 アピキュラータ (Kloeckera apiculata) + TX、クロエケラ属  
 (Kloeckera) の種 + TX、ラゲニジウム・ギガンテウム (Lagenidium  
 giganteum) (Laginex (登録商標) + TX、レカニシリウム・  
 ロンギスポルム (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast  
 (登録商標) + TX、レカニシリウム・ムスカリウム (Lecanicillium  
 muscarium) (Vertikil (登録商標) + TX、マイマイガ核多角体病  
 ウイルス (Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus) (Disparvirus  
 (登録商標) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (Marinococcus  
 halophilus) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (Meira geulakonigii)  
 + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae)  
 (Met52 (登録商標) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium  
 anisopliae) (Destruxin WP (登録商標) + TX、メチニコピア・フル  
 クチコラ (Metschnikowia fruticola) (Shemer (登録商標) + TX、  
 メチニコピア・プルケリマ (Metschnikowia pulche

10

20

30

40

50

r r i m a ) + T X、ミクロドチウム・ジメルム ( M i c r o d o c h i u m d i m e  
 r u m ) ( A n t i b o t ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ミクロモノスポラ・ケルレア ( M i c  
 r o m o n o s p o r a c o e r u l e a ) + T X、ミクロスファエロプシス・オクラ  
 セ ( M i c r o s p h a e r o p s i s o c h r a c e a ) + T X、ムスコドル・アル  
 ブス ( M u s c o d o r a l b u s ) 6 2 0 ( M u s c u d o r ( 登 録 商 標 ) ) + T X  
 、ムスコドル・ロセウス ( M u s c o d o r r o s e u s ) 菌株 A 3 - 5 + T X、ミコ  
 リザエ属 ( M y c o r r h i z a e ) の種 ( A M y k o r ( 登 録 商 標 ) ) + T X、R o o t  
 M a x i m i z e r ( 登 録 商 標 ) ) + T X、クワ暗斑病菌 ( M y r o t h e c i u m v  
 e r r u c a r i a ) 菌株 A A R C - 0 2 5 5 ( D i T e r a ( 登 録 商 標 ) ) + T X、B  
 R O S P L U S ( 登 録 商 標 ) + T X、オフィオストマ・ピリフェルム ( O p h i o s t  
 o m a p i l i f e r u m ) 菌株 D 9 7 ( S y l v a n e x ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ペ  
 シロマイセス・ファリノス ( P a e c i l o m y c e s f a r i n o s u s ) + T X  
 、ペシロマイセス・フモソロセウス ( P a e c i l o m y c e s f u m o s o r o s e  
 u s ) ( P F R - 9 7 ( 登 録 商 標 ) ) + T X、P r e F e R a l ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ペ  
 シロマイセス・リラシヌス ( P a e c i l o m y c e s l i n a c i n u s ) ( B i o  
 s t a t W P ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ペシロマイセス・リラシヌス ( P a e c i l o m  
 y c e s l i l a c i n u s ) 菌株 2 5 1 ( M e l o C o n W G ( 登 録 商 標 ) ) + T X  
 、パエニバチルス・ポリミキサ ( P a e n i b a c i l l u s p o l y m y x a ) + T  
 X、パントエア・アグロメラン ( P a n t o e a a g g l o m e r a n s ) ( B l i  
 g h t B a n C 9 - 1 ( 登 録 商 標 ) ) + T X、パンテア属 ( P a n t o e a ) の種 + T  
 X、パスツーリア属 ( P a s t e u r i a ) の種 ( E c o n e m ( 登 録 商 標 ) ) + T X、  
 パスツーリア・ニシザワエ ( P a s t e u r i a n i s h i z a w a e ) + T X、ペニ  
 シリウム・オーランティオグリセウム ( P e n i c i l l i u m a u r a n t i o g r  
 i s e u m ) + T X、ペニシリウム・ピライ ( P e n i c i l l i u m b i l l a i )  
 ( J u m p s t a r t ( 登 録 商 標 ) ) + T X、T a g T e a m ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ペニ  
 シリウム・ブレビコンパクトム ( P e n i c i l l i u m b r e v i c o m p a c t u  
 m ) + T X、ペニシリウム・フレクエンタス ( P e n i c i l l i u m f r e q u e n  
 t a n s ) + T X、ペニシリウム・グリセオフルバム ( P e n i c i l l i u m g r i  
 s e o f u l v u m ) + T X、ペニシリウム・ブルプロゲナム ( P e n i c i l l i u m  
 p u r p u r o g e n u m ) + T X、ペニシリウム属 ( P e n i c i l l i u m ) の種 +  
 T X、ペニシリウム・ピリディカタム ( P e n i c i l l i u m v i r i d i c a t u  
 m ) + T X、フレビオブシス・ギガンテア ( P h l e b i o p s i s g i g a n t e a  
 n ) ( R o t s t o p ( 登 録 商 標 ) ) + T X、リン酸塩溶解細菌 ( P h o s p h o m e a  
 l ( 登 録 商 標 ) ) + T X、フィトファトラ・クリプトゲア ( P h y t o p h t h o r a  
 c r y p t o g e a ) + T X、フィトファトラ・パルミボラ ( P h y t o p h t h o r a  
 p a l m i v o r a ) ( D e v i n e ( 登 録 商 標 ) ) + T X、ピヒア・アノマラ ( P i c  
 h i a a n o m a l a ) + T X、ピヒア・ギリエルモンディ ( P i c h i a g u i l e  
 r m o n d i i ) + T X、ピヒア・メンブラネファシエンス ( P i c h i a m e m b r  
 a n a e f a c i e n s ) + T X、ピヒア・オニキス ( P i c h i a o n y c h i s )  
 + T X、ピヒア・スチピチス ( P i c h i a s t i p i t e s ) + T X、緑膿菌 ( P s  
 e u d o m o n a s a e r u g i n o s a ) + T X、シュードモナス・オーレオファシ  
 エンス ( P s e u d o m o n a s a u r e o f a s c i e n s ) ( S p o t - L e s s  
 B i o f u n g i c i d e ( 登 録 商 標 ) ) + T X、シュードモナス・セパシア ( P s e u  
 d o m o n a s c e p a c i a ) + T X、シュードモナス・クロロラフィス ( P s e u  
 d o m o n a s c h l o r o r a p h i s ) ( A t E z e ( 登 録 商 標 ) ) + T X、シュ  
 ードモナス・コルガータ ( P s e u d o m o n a s c o r r u g a t e ) + T X、シュ  
 ードモナス・フルオレッセンス ( P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s ) 菌  
 株 A 5 0 6 ( B l i g h t B a n A 5 0 6 ( 登 録 商 標 ) ) + T X、シュードモナス・ブ  
 チダ ( P s e u d o m o n a s p u t i d a ) + T X、シュードモナス・リアクタン  
 ス ( P s e u d o m o n a s r e a c t a n s ) + T X、シュードモナス属 ( P s e u d

10

20

30

40

50

omonas)の種+TX、シュードモナス・シリंगाエ(Pseudomonas syringae)(Bio-Save(登録商標))+TX、シュードモナス・ビリジフラバ(Pseudomonas viridiflava)+TX、蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)(Zequanox(登録商標))+TX、シュードジマ・フロクロサ(Pseudozyma flocculosa)菌株PF-A22UL(Sporodex L(登録商標))+TX、プッシニア・カナリクラタ(Puccinia canaliculata)+TX、プッシニア・テラスペオス(Puccinia thlaspeos)(Wood Warrior(登録商標))+TX、ピシウム・パレカンドルム(Pythium paroecandrum)+TX、ピシウム・オリガンドルム(Pythium oligandrum)(Polygandron(登録商標))+TX、Polyversum(登録商標))+TX、ピシウム病菌(Pythium periplocum)+TX、ラーネラ・アクアティリス(Rhanelia aquatilis)+TX、ラーネラ属(Rhanelia)の種+TX、リゾビウム属(Rhizobia)(Dormal(登録商標))+TX、Vault(登録商標))+TX、リゾクトニア属(Rhizoctonia)+TX、ロドコッカス・グロベルルス(Rhodococcus globerulus)菌株AQ719+TX、ロドスポリジウム・ディオボバタム(Rhodospiridium diobovatum)+TX、ロドスポリジウム・トルロイデス(Rhodospiridium toruloides)+TX、ロドトルラ属(Rhodotorula)の種+TX、ロドトルラ・グルチニス(Rhodotorula glutinis)+TX、ロドトルラ・グラミニス(Rhodotorula graminis)+TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ(Rhodotorula mucilaginosa)+TX、ロドトルラ・ルブラ(Rhodotorula rubra)+TX、サッカロマイセス・セレピシエ(Saccharomyces cerevisiae)+TX、サリニコッカス・ロセウス(Salinococcus roseus)+TX、スクレロチニア・ミノル(Sclerotinia minor)+TX、スクレロチニア・ミノル(Sclerotinia minor)(SARRITOR(登録商標))+TX、スキタリジウム属(Scytalidium)の種+TX、スキタリジウム・ウレジニコラ(Scytalidium uredinicola)+TX、シロイチモジヨトウ(Spodoptera exigua)核多角体病ウイルス(Spod-X(登録商標))+TX、Spexit(登録商標))+TX、セラチア・マルセッセンス(Serratia marcescens)+TX、セラチア・プリムシカ(Serratia plymuthica)+TX、セラチア属(Serratia)の種+TX、ソルダリア・フィミコーラ(Sordaria fimicola)+TX、エジプトヨトウ(Spodoptera littoralis)核多角体病ウイルス(Littovir(登録商標))+TX、スポロボロマイセス・ロセウス(Sporobolomyces roseus)+TX、ステノトロホモナス・マルトフィリア(Stenotrophomonas maltophilia)+TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス(Streptomyces ahyscopicus)+TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス(Streptomyces albaduncus)+TX、ストレプトマイセス・エクスフォリエータス(Streptomyces exfoliates)+TX、ストレプトマイセス・ガルバス(Streptomyces galbus)+TX、ストレプトマイセス・グリセオプラヌス(Streptomyces griseoplanus)+TX、ストレプトマイセス・グリセオビリディス(Streptomyces griseoviridis)(Mycostop(登録商標))+TX、ストレプトマイセス・リディカス(Streptomyces lydicus)(Actinovate(登録商標))+TX、ストレプトマイセス・リディカス(Streptomyces lydicus)WYEC-108(ActinoGrow(登録商標))+TX、ストレプトマイセス・ビオラセウス(Streptomyces violaceus)+TX、チレチオプシス・ミノル(Tilletiopsis

10

20

30

40

50

minor) + TX、チレチオブシス属 (Tilletiopsis) の種 + TX、トリコデルマ・アスペレルム (Trichoderma asperellum) (T34 Biocontrol (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gamsii) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトリビリデ (Trichoderma atroviride) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハマツム (Trichoderma hamatum) TH382 + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (Trichoderma harzianum rifai) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-22 (Trianium - P (登録商標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield (登録商標) + TX、Trianium - G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-39 (Trichodex (登録商標)) + TX、トリコデルマ・インハマタム (Trichoderma inhamatum) + TX、トリコデルマ・コニングイ (Trichoderma koningii) + TX、トリコデルマ属 (Trichoderma) の種 LC52 (Sentinel (登録商標)) + TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロングブラキアタム (Trichoderma longibrachiatum) + TX、トリコデルマ・ポリスボラム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標)) + TX、トリコデルマ・タキシ (Trichoderma taxi) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL-21) (SoilGuard (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ピリデ (Trichoderma viride) + TX、トリコデルマ・ピリデ (Trichoderma viride) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) + TX、トリコスボロン・プルランス (Trichosporon pullulans) + TX、トリコスボロン属 (Trichosporon) の種 + TX、トリコセシウム属 (Trichothecium) の種 + TX、トリコセシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (Ulocladium atrum) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) (Botry - Zen (登録商標)) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (Ustilago maydis) + TX、様々な細菌及び補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) + TX、パーチシリウム・クラミドスポリウム (Verticillium chlamydosporium) + TX、パーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標)) + TX、Vertalec (登録商標) + TX、Vip3Aa20 (VIPTera (登録商標)) + TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標)) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (Xenorhabdus nematophilus) ;

以下のものを含む植物抽出物：マツ油 (Retenol (登録商標)) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzal (登録商標) + TX、Molt - X (登録商標) + TX、Botanical IGR (Neemazad (登録商標)) + TX、Neemix (登録商標) + TX、キャノーラ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標))

10

20

30

40

50



)+TX、アメリカアリタソウ(*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*)(*Requiem*(登録商標))+TX、キク属(*Chrysanthemum*)抽出物(*Crisant*(登録商標))+TX、ニーム油の抽出物(*Trilogy*(登録商標))+TX、シソ科植物(*Labiatae*)の精油(*Botania*(登録商標))+TX、クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物(*Garden insect killer*(登録商標))+TX、グリーンベタイン(*Greenstim*(登録商標))+TX、ニンニク+TX、レモングラス油(*GreenMatch*(登録商標))+TX、ニーム油+TX、イヌハッカ(*Nepeta cataria*)(*キャットニップ油*)+TX、イヌハッカ(*Nepeta catarina*)+TX、ニコチン+TX、オレガノ油(*MossBuster*(登録商標))+TX、ゴマ科植物(*Pedaliaceae*)油(*Nematon*(登録商標))+TX、除虫菊+TX、シャボンノキ(*Quillaja saponaria*)(*NemaQ*(登録商標))+TX、オオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)(*Regalia*(登録商標))+TX、*Sakalia*(登録商標))+TX、ロテノン(*Eco Roten*(登録商標))+TX、ミカン科(*Rutaceae*)植物抽出物(*Soleo*(登録商標))+TX、ダイズ油(*Ortho ecosense*(登録商標))+TX、ティーツリー油(*Timorex Gold*(登録商標))+TX、胸腺油+TX、AGNIQUE(登録商標)MMF+TX、BugOil(登録商標)+TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物(*EF 300*(登録商標))+TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物(*EF 400*(登録商標))+TX、クローブペパーミントニンニク油及びミントの混合物(*Soil Shot*(登録商標))+TX、カオリン(*Screen*(登録商標))+TX、褐藻類の貯蔵グルカン(*Laminarin*(登録商標));

10

20

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロハマキフェロモン(*3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone*(登録商標))+TX、コドリंगाフェロモン(*Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus*(登録商標))+TX、グレープベリーモス(*Grape Berry Moth*)フェロモン(*3M MEC-GBM Sprayable Pheromone*(登録商標))+TX、ハマキムシフェロモン(*3M MEC-LR Sprayable Pheromone*(登録商標))+TX、*Muscamone*(*Snip7 Fly Bait*(登録商標))+TX、*Starbar Premium Fly Bait*(登録商標))+TX、ナシノヒメシンクイフェロモン(*3M oriental fruit moth sprayable pheromone*(登録商標))+TX、ピーチツリーボーラーフェロモン(*Isomate - P*(登録商標))+TX、トマトピンwormフェロモン(*3M Sprayable pheromone*(登録商標))+TX、*Entostat*粉末(ヤシからの抽出物)(*Exosex CM*(登録商標))+TX、(E+TX, Z+TX, Z)-3+TX, 8+TX, 11テトラデカトリエニルアセテート+TX、(Z+TX, Z+TX, E)-7+TX, 11+TX, 13-ヘキサデカトリエナール+TX、(E+TX, Z)-7+TX, 9-ドデカジエン-1-イルアセテート+TX、2-メチル-1-ブタノール+TX、酢酸カルシウム+TX、*Scenturion*(登録商標)+TX、*Biolure*(登録商標)+TX、*Check-Mate*(登録商標)+TX、ラバンズリルセネシオアート(*Lavandulyl seneciolate*);

30

40

以下のものを含む生物：アフェリヌス・アブドミナリス(*Aphelinus abdominalis*)+TX、アフィジウス・エルビ(*Aphidius ervi*)(*Aphelinus - System*(登録商標))+TX、アセロファガス・パパイヤ(*Acerophagus papaya*)+TX、フタモンテントウ(*Adalia bipunctata*)(*Adalia - System*(登録商標))+TX、フタモンテントウ(*Adalia bipunctata*)(*Adaline*(登録商標))+TX、フタモンテントウ(*Adalia bipunctata*)(*Aphidalia*(登録商

50

標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (*Ageniaspis citricola*) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (*Ageniaspis fuscicollis*) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (*Amblyseius andersoni*) (*Anderline* (登録商標)) + TX、*Andersoni-System* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (*Amblyseius californicus*) (*Amblyline* (登録商標)) + TX、*Spical* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (*Amblyseius cucumeris*) (*Thripex* (登録商標)) + TX、*Bugline cucumeris* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (*Amblyseius fallacis*) (*Fallacis* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・スウィルスキイ (*Amblyseius swirskii*) (*Bugline swirskii* (登録商標)) + TX、*Swirskii-Mite* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ウオマースレイ (*Amblyseius womersleyi*) (*Womer Mite* (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (*Amitus hesperidum*) + TX、アナグルス・アトムス (*Anagrus atomus*) + TX、アナギルス・フスシベントリス (*Anagrus fusciventris*) + TX、アナギルス・カマリ (*Anagrus kamali*) + TX、アナギルス・ロエッキ (*Anagrus loeckii*) + TX、アナギルス・シュードコッカス (*Anagrus pseudococci*) (*Citripar* (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (*Anicetus benefices*) + TX、ゾウムシコガネコバチ (*Anisopteromalus calandrae*) + TX、アントコリス・ネモラリス (*Anthocoris nemoralis*) (*Anthocoris-System* (登録商標)) + TX、アフエリヌス・アブドミナリス (*Aphelinus abdominalis*) (*Apheline* (登録商標)) + TX、*Aphiline* (登録商標)) + TX、アフエリヌス・アシキス (*Aphelinus asychis*) + TX、アフイジウス・コレマニ (*Aphidius colemani*) (*Ahipar* (登録商標)) + TX、アフイジウス・エルビ (*Aphidius ervi*) (*Ervipar* (登録商標)) + TX、アフイジウス・ギフエンシス (*Aphidius gifuensis*) + TX、アフイジウス・マトリカリアエ (*Aphidius matricariae*) (*Ahipar-M* (登録商標)) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Aphidend* (登録商標)) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Aphidoline* (登録商標)) + TX、アフイチス・リングナネンシス (*Aphytis lingnanensis*) + TX、アフイチス・メリヌス (*Aphytis melinus*) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイイ (*Aprostocetus hagenowii*) + TX、アセタ・コリアリア (*Athetacoriaria*) (*Staphyline* (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (*Bombus*) の種 + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Natupol Beehive* (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Beeline* (登録商標)) + TX、*Tripol* (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (*Cephalonomia stephanoderis*) + TX、チノコルス・ニグリツス (*Chilocorus nigritus*) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysoline* (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysopa* (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフィラブリス (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (*Cirrospilus ingenuus*) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (*Citrostichus phyllocnistoides*) + TX、クロステロセルス・カマエレ

10

20

30

40

50

オン(Closterocerus chamaeleon)+TX、クロステロセルス  
 属(Closterocerus)の種+TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス(C  
 occidoxenoides perminutus)(Planopar(登録商標  
 ))+TX、コッコファグス・コウペリ(Coccophagus cowperi)+  
 TX、コッコファグス・リシムニア(Coccophagus lycimnia)+T  
 X、キアシサムライコマユバチ(Cotesia flavipes)+TX、コナガサ  
 ムライコマユバチ(Cotesia plutellae)+TX、ツマアカオオテント  
 ウムシ(Cryptolaemus montrouzieri)(Cryptobug  
 (登録商標))+TX、Cryptoline(登録商標))+TX、キムネタマキスイ(  
 Cybocephalus nipponicus)+TX、ハモグリコマユバチ(Da  
 cnusa sibirica)+TX、ハモグリコマユバチ(Dacnusa sibi  
 rica)(Minusa(登録商標))+TX、イサエアヒメコバチ(Diglyph  
 us isaea)(Diminex(登録商標))+TX、デルファスツス・カタリナ  
 エ(Delphastus catalinae)(Delphastus(登録商標)  
 ))+TX、デルファスツス・プシルス(Delphastus pusillus)+T  
 X、ジアカスミモルファ・クラウシイ(Diachasmimorpha krausi  
 i)+TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ(Diachasmimorpha  
 longicaudata)+TX、ジアパルス・ジユクンダ(Diaparsis  
 jucunda)+TX、ジアホレンシルツス・アリガレンシス(Diaphorenc  
 yrtus aligarhensis)+TX、イサエアヒメコバチ(Diglyph  
 us isaea)+TX、イサエアヒメコバチ(Diglyphus isaea)(M  
 igitlyphus(登録商標))+TX、Digline(登録商標))+TX、ハモグリ  
 コマユバチ(Dacnusa sibirica)(DacDigline(登録商標)  
 )+TX、Minex(登録商標))+TX、ディベルシネルプス属(Diversine  
 rvus)の種+TX、エンカルシア・シトリナ(Encarsia citrina)  
 +TX、オンシツツヤコバチ(Encarsia formosa)(Encarsia  
 max(登録商標))+TX、Encarline(登録商標))+TX、En-Strip  
 (登録商標))+TX、サバクツヤコバチ(Eretmocerus eremicus  
 )(Enermix(登録商標))+TX、エンカルシア・グアデロウパエ(Encar  
 sia guadeloupae)+TX、エンカルシア・ハンティエンシス(Enca  
 rsia haitiensis)+TX、ホソヒラタアブ(Episyrrhus ba  
 lteatus)(Syrphidend(登録商標))+TX、エルトモセルス・シフ  
 オニニ(Eretmoceris siphonini)+TX、エルトモセルス・カリ  
 フォルニクス(Eretmocerus californicus)+TX、サバクツ  
 ヤコバチ(Eretmocerus eremicus)(Ercal(登録商標))+T  
 X、Eretline e(登録商標))+TX、サバクツヤコバチ(Eretmoce  
 rus eremicus)(Bemimix(登録商標))+TX、エルトモセルス・  
 ハヤチ(Eretmocerus hayati)+TX、エルトモセルス・ムンヅス(  
 Eretmocerus mundus)(Bemipar(登録商標))+TX、Ere  
 tline m(登録商標))+TX、エルトモセルス・シフォニニ(Eretmoce  
 rus siphonini)+TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス(Exoc  
 homus quadripustulatus)+TX、フェルチエラ・アカリスガ(  
 Feltiella acarisuga)(Spidend(登録商標))+TX、フェ  
 ルチエラ・アカリスガ(Feltiella acarisuga)(Feltili  
 ne(登録商標))+TX、フォピウス・アリサヌス(Fopius arisanus  
 )+TX、フォピウス・セラチチボルス(Fopius ceratitivorus)  
 +TX、ホルモノネチン(Wirless Beehome(登録商標))+TX、アリ  
 ガタシマアザミウマ(Franklinothrips vespiformis)(V  
 espop(登録商標))+TX、ガレンドロムス・オシデンタリス(Galendro  
 mus occidentalis)+TX、ゴニオズス・レグネリ(Goniozus

10

20

30

40

50

legneri) + TX、シマメイガコマユバチ (*Habrobracon hebetor*) + TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*Harmo Beetle* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (*Heterorhabditis*) の種 (*Lawn Patrol* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標)) + TX、*Nemaseek* (登録商標) + TX、*Terranem - Nam* (登録商標) + TX、*Terranem* (登録商標) + TX、*Larvanem* (登録商標) + TX、*B - Green* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nematop* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス (*Heterorhabditis megidis*) (*Nemasys H* (登録商標)) + TX、*BioNem H* (登録商標) + TX、*Exhibitline hm* (登録商標) + TX、*Larvanem - M* (登録商標)) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (*Hypoaspis aculeifer*) (*Aculeifer - System* (登録商標)) + TX、*Entomite - A* (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (*Hypoaspis miles*) (*Hypoline m* (登録商標)) + TX、*Entomite - M* (登録商標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (*Lbalia leucospoides*) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (*Lecanoid eus floccissimus*) + TX、レモファグス・エラブンツス (*Lemop hagus errabundus*) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (*Lep tomastidea abnormis*) + TX、レプトマス  
 テイクス・ダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (*Lept opar* (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エポナ (*Leptomastix epona*) + TX、リンドルス・ロファンタエ (*Lindorus lophanth ae*) + TX、リボレクシス・オレグマエ (*Lipolexis oregmae*) + TX、ルシリア・カエサル (*Lucilia caesar*) (*Natufly* (登録商標)) + TX、リシフレブス・テストケイペス (*Lysiphlebus testace ipes*) + TX、マクロロフス・カリギノス (*Macrolophus calig inosus*) (*Mirical - N* (登録商標)) + TX、*Macroline c* (登録商標) + TX、*Mirical* (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (*Mesoseiulus longipes*) + TX、メタフィクス・フラプス (*Met aphycus flavus*) + TX、メタフィクス・ロウンズブリー (*Metaph ycus lounsburyi*) + TX、ミクロムス・アングラツス (*Micromus angulatus*) (*Milacewing* (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラプス (*Microterys flavus*) + TX、ムスシディフラクス・ラボトレ ルス (*Muscidi furax raptorellus*) 及びスパランギア・カメロ ニ (*Spalangia cameroni*) (*Biopar* (登録商標)) + TX、ネ オドリイヌス・チフロシバエ (*Neodryinus typhlocybae*) + TX、ミヤコカブリダニ (*Neoseiulus californicus*) + TX、ネオ セイウルス・ククメリス (*Neoseiulus cucumeris*) (*THRYPE X* (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (*Neoseiulus fal lacis*) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (*Nesideocoris ten uis*) (*Nesidio Bug* (登録商標)) + TX、*Nesibug* (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (*Ophyra aenescens*) (*Biofly* (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (*Orius insidiosus*) (*Th ripor - I* (登録商標)) + TX、*Oriline i* (登録商標)) + TX、エルヒ メハナカメムシ (*Orius laevigatus*) (*Thrip or - L* (登録商標)) + TX、*Oriline l* (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (*Ori us majusculus*) (*Oriline m* (登録商標)) + TX、タイリクヒ メハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (*Thrip or - S* (登録

商標)) + TX、パウエシア・ジュニペロルム ( *Pauesia juniperorum* ) + TX、ペディオピウス・ホベオレツス ( *Pediobius foveolatus* ) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ ( *Phasmarhabditis hermaphrodita* ) ( *Nemaslug* (登録商標)) + TX、フィマスティクス・コフエア ( *Phymastichus coffea* ) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス ( *Phytoseiulus macropilus* ) + TX、チリカブリダニ ( *Phytoseiulus persimilis* ) ( *Spidex* (登録商標)) + TX、Phytoline p (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリペントリス ( *Podisus maculiventris* ) ( *Podisus* (登録商標)) + TX、シューダクテオン・クルバツス ( *Pseudacteon curvatus* ) + TX、シューダクテオン・オブツス ( *Pseudacteon obtusus* ) + TX、シューダクテオン・トリクスピス ( *Pseudacteon tricuspis* ) + TX、シューダフィクス・マクリペンニス ( *Pseudaphycus maculipennis* ) + TX、シュードレプトマスティクス・メキシカーナ ( *Pseudoleptomastix mexicana* ) + TX、サイラエファグス・ピロス ( *Psyllaephagus pilosus* ) + TX、サイタリア・コンコロール ( *Psytalia concolor* ) (複合体) + TX、クアドラスティクス属 ( *Quadrastichus* ) の種 + TX、リゾビウス・ロファンタエ ( *Rhyzobius lophanthae* ) + TX、ベダリアテントウ ( *Rodolia cardinalis* ) + TX、オオクビキレガイ ( *Rumina decollate* ) + TX、セミエラケア・ペティオラツス ( *Semiela cher petiolatus* ) + TX、シトピオン・アベナエ ( *Sitobion avenae* ) ( *Ervibank* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・カルポカプサエ ( *Steinernema carpocapsae* ) ( *Nematac C* (登録商標)) + TX、Millenium (登録商標) + TX、BioNem C (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemastar (登録商標) + TX、Capsanem (登録商標) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ ( *Steinernema feltiae* ) ( *NemaShield* (登録商標)) + TX、Nemasys F (登録商標) + TX、BioNem F (登録商標) + TX、Steinernema - System (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemaplus (登録商標) + TX、Exhibitline sf (登録商標) + TX、Scia - rid (登録商標) + TX、Entonem (登録商標) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ ( *Steinernema kraussei* ) ( *Nemasys L* (登録商標)) + TX、BioNem L (登録商標) + TX、Exhibitline srb (登録商標) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ ( *Steinernema riobrave* ) ( *BioVector* (登録商標)) + TX、BioVektor (登録商標) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ ( *Steinernema scapterisci* ) ( *Nematac S* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ属 ( *Steinernema* ) の種 + TX、スタイナーネマチド属 ( *Steinernematid* ) の種 ( *Guardian Nematodes* (登録商標)) + TX、ステトルス・プンクチルム ( *Stethorus punctillum* ) ( *Stethorus* (登録商標)) + TX、タマリキシア・ラジアタ ( *Tamarixia radiate* ) + TX、テトラスティクス・セティファー ( *Tetrastichus setifer* ) + TX、トリボピウス・セミルテウス ( *Thripobius semiluteus* ) + TX、トリムス・シネンシス ( *Torymus sinensis* ) + TX、タマゴヤドリバチ ( *Trichogramma brassicae* ) ( *Tricholine b* (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ ( *Trichogramma brassicae* ) ( *Tricho - Strip* (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ ( *Trichogramma evanescens* ) + TX、トリコグラムマ・ミヌツム ( *Trichogramma minutum* ) + TX、アワノメイガタマゴバチ ( *Trichogramma ostrinia* ) + TX、ト

リコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*) ;

以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標) + TX、コンドロステレウム・ブルブレウム (*Chondrostereum purpureum*) (Chontrol Paste (登録商標)) + TX、コレトリウム・グレオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、リン酸第二鉄 (Ferramol (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモ・ブラシノリド + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (*Microctonus hyperodae*) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (*Mycroleptodiscus terrestris*) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (Milstop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (*Nosema locustae*) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Rebell Amarillo (登録商標)) + TX 及びトラップ (Takitrapline y + b (登録商標)) + TX ; 並びに

毒性緩和剤、例えばベノキサコール + TX、クロキントセット (クロキントセット - メキシルを含めた) + TX、シブロスルファミド + TX、ジクロルミド + TX、フェンクロラゾール (フェンクロラゾール - エチルを含めた) + TX、フェンクロリム + TX、フルキソフェニム + TX、フリラゾール + TX、イソオキサジフェン (イソオキサジフェン - エチルを含めた) + TX、メフェンピル (メフェンピル - ジエチルを含めた) + TX、メトカミフェン + TX 及びオキサベトリニル + TX。

【0992】

有効成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば [3878-19-1] は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は、公知である。有効成分は、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会 (The British Crop Protection Council)] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており ; 例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号 (1) で記載されている。「[CN]」が上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names” に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権) 1995 - 2004] ; 例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス : <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole> .

10

20

30

40

50

htmlに記載されている。

【0993】

上記の有効成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」又は別の「一般名」が個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が使用されるか、又はそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。

【0994】

表A-1~A-96、表C-1~C-96、表E-1~E-96、表F-1~F-96、表G-1~G-96及び表H-1~H-96並びに表Pから選択される式Iの化合物と、上記の有効成分との有効成分混合物は、表A-1~A-96、表C-1~C-96、表E-1~E-96、表F-1~F-96、表G-1~G-96及び表H-1~H-96並びに表Pから選択される化合物及び上記の有効成分を好ましくは100:1~1:6000、特に50:1~1:50の混合比、より特に20:1~1:20、さらにより特に10:1~1:10、非常に特に5:1及び1:5の比率で(2:1~1:2の比率が特に好ましく、4:1~2:1の比率が同様に好ましい)、とりわけ1:1、又は5:1、又は5:2、又は5:3、又は5:4、又は4:1、又は4:2、又は4:3、又は3:1、又は3:2、又は2:1、又は1:5、又は2:5、又は3:5、又は4:5、又は1:4、又は2:4、又は3:4、又は1:3、又は2:3、又は1:2、又は1:6000、又は1:3000、又は1:1500、又は1:350、又は2:350、又は4:350、又は1:750、又は2:750、又は4:750、又は1:60000、又は1:30000、又は1:15000、又は1:3500、又は2:3500、又は4:3500、又は1:7500、又は2:7500、又は4:7500の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

【0995】

上記の混合物は、有害生物を防除する方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に施用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療のための方法及び人又は動物の身体において実施される診断方法を除く。

【0996】

表A-1~A-96、表C-1~C-96、表E-1~E-96、表F-1~F-96、表G-1~G-96及び表H-1~H-96並びに表Pから選択される式Iの化合物と、上記の1つ又は複数の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一の「レディミックス」形態において、「タンクミックス」など、単一の有効成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として及び逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用され得る。表A-1~A-96、表C-1~C-96、表E-1~E-96、表F-1~F-96、表G-1~G-96及び表H-1~H-96並びに表Pから選択される式Iの化合物及び上記の有効成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0997】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油(例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油)、消泡剤、例えばシリコン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び/又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

【0998】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉碎し、篩にかけ、且つ/又は圧縮することにより、助剤の非存在下において及び例えば有効成分を1つ又は複数の助剤と均質混合し、且つ/又は粉碎することにより、少なくとも1つの助剤の存在下においてそれ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法及びこれらの組成物

10

20

30

40

50

の調製のための化合物 I の使用も本発明の主題である。

【0999】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ（これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである）など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1 ~ 1000 ppm、好ましくは 0.1 ~ 500 ppm の有効成分である。1 ヘクタール当たりの施用量は、一般に、1 ヘクタール当たり 1 ~ 2000 g の有効成分、特に 10 ~ 1000 g / ha、好ましくは 10 ~ 600 g / ha である。

【1000】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用（葉面施用）であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度及び施用量を選択することができる。代わりに、有効成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、又は固体形態の有効成分を植物の生息地、例えば土壤中に例えば粒剤の形態で導入すること（土壌施用）により、根系（全身作用）を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

【1001】

本発明の化合物及びその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば果実、塊茎若しくは穀粒などの種子又は苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。代わりに、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することにより又は固体組成物の層を塗布することにより種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を例えばドリルまきの際に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物及び防除される有害生物 / 真菌に応じて決まり、一般に、100 kg の種子当たり 1 ~ 200 グラム、好ましくは 100 kg の種子当たり 5 ~ 150 グラム（100 kg の種子当たり 10 ~ 100 グラムなど）である。

【1002】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【1003】

本発明は、式 I の化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「で被覆又は処理されるか及び / 又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分は、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部は、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式（I）の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、式（I）の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

【1004】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬及び種子ベレッティングなど、当技術分野において公知のすべての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、種まきの前又は種まき / 種子の植え付けの際に噴霧又は種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

【1005】

生物学的実施例：

以下の実施例は、本発明を例示するためのものである。本発明の特定の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物と区別が可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用いて、必要に応じて例えば 50 ppm、12.5 ppm、6

10

20

30

40

50



ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm又は0.2 ppmといった低施用量を用いて当業者により検証が可能である。

【1006】

実施例B1：ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) (コーンルートワーム)

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を寄生させた(1ウェル当たり6~10匹)。寄生の4日後、サンプルを死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比べて評価した。

【1007】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で2種のカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P48、P49、P50、P51、P52、P53、P54、P55、P56、P57、P58。

【1008】

実施例B2：ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウンスティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉にN2若虫を寄生させた。寄生の5日後、サンプルを死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比べて評価した。

【1009】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で2種のカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P1、P2、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P24、P25、P26、P27、P29、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P40、P42、P50、P51、P52、P53及びP58。

【1010】

実施例B3：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ)

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 DMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のハナアザミウマ属 (*Frankliniella*) の個体群を寄生させた。寄生の7日後、サンプルを死亡率について評価した。

【1011】

下記の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P1、P2、P12、P20、P21、P26、P27、P40、P57。

【1012】

実施例B4：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をプラスチック製のステンシルを介してゲル吸い取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。寄生から8日後、死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。

【1013】

10

20

30

40

50

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリ（死亡率又は成長阻害）の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P48、P49、P50、P51、P52、P53、P54、P55、P56、P57、P58。

#### 【1014】

実施例B5：モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（モモアカアブラムシ）。摂食／接触活性

10

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000ppmのDMISOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシの個体群を寄生させた。サンプルを寄生の6日後に死亡率について評価した。

#### 【1015】

以下の化合物は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P1、P3、P9、P11、P12、P13、P17、P18、P19、P20、P21、P26、P27、P44、P45、P50、P51、P52、P53、P57。

#### 【1016】

20

実施例B6：タバココナジラミ（*Bemisia tabaci*）（綿コナジラミ）。摂食／接触活性

綿葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000ppmのDMISOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片にコナジラミの成虫を寄生させた。インキュベーションの6日後、サンプルを死亡率について確認した。

#### 【1017】

下記の化合物は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P1、P7、P17、P33、P34、P57、P58。

#### 【1018】

30

実施例B7：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）

綿の葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000ppmのDMISOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を寄生させた。寄生の3日後、サンプルを死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について未処理のサンプルと比較して評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリの少なくとも1つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるエジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）の防除がもたらされている。

#### 【1019】

40

以下の化合物は、200ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P48、P49、P50、P51、P52、P53、P54、P55、P57、P58。

#### 【1020】

実施例B8：モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（モモアカアブラムシ）。浸透移行活性

50

様々な齡数のアブラムシの個体群を寄生させたエンドウマメの実生の根を、10,000 DMSOストック溶液から調製したテスト水溶液中に直接入れた。実生をテスト溶液中に入れてから6日後、サンプルを死亡率について評価した。

【1021】

下記の化合物は、24 ppmのテスト量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P20、P21、P32。

【1022】

実施例B9：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニカメイガ)

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を寄生させた(1ウェル当たり6~8匹)。寄生の6日後、サンプルを未処理のサンプルと比較して、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリーの少なくとも1つが未処理のサンプルより高いとき、テストサンプルによるニカメイガ (*Chilo suppressalis*) の防除をもたらされる。

【1023】

例えば、下記の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：P57、P58。

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

## (51)国際特許分類

F I

A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P	7/02	
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04	
A 0 1 P	5/00 (2006.01)	A 0 1 P	5/00	
A 0 1 N	43/76 (2006.01)	A 0 1 N	43/76	1 0 1
A 0 1 N	43/52 (2006.01)	A 0 1 N	43/52	
A 0 1 M	29/12 (2011.01)	A 0 1 M	29/12	
A 0 1 N	43/90 (2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 4
A 0 1 P	9/00 (2006.01)	A 0 1 P	9/00	

## (33)優先権主張国・地域又は機関

インド(IN)

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100123766

弁理士 松田 七重

(74)代理人 100212509

弁理士 太田 知子

(72)発明者 シケルヴァル ヴィカス

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム サンタ モニカ ワークス シンジェンタ バイオサイエンスーズ プライベート リミテッド内

(72)発明者 セン インディラ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム サンタ モニカ ワークス シンジェンタ バイオサイエンスーズ プライベート リミテッド内

(72)発明者 ミューレバッハ ミシェル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタールシュトラーセ 6 7 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 シュトラー アンドレ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エメリー ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ブッフホルツ アンケ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 クルツ ベネディクト

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト内

審査官 土橋 敬介

(56)参考文献 特開 2 0 1 9 - 0 0 6 6 8 6 ( J P , A )

特表 2 0 1 8 - 5 0 7 1 8 4 ( J P , A )

特開 2 0 1 4 - 0 0 5 2 6 3 ( J P , A )

(58)調査した分野 (Int.Cl. , D B 名)

C 0 7 D

A 0 1 N

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