

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6030640号
(P6030640)

(45) 発行日 平成28年11月24日 (2016. 11. 24)

(24) 登録日 平成28年10月28日 (2016. 10. 28)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 261/04 (2006. 01)

C O 7 D 261/04 C S P

C O 7 D 413/04 (2006. 01)

C O 7 D 413/04

A 6 1 K 31/42 (2006. 01)

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/422 (2006. 01)

A 6 1 K 31/422

A 6 1 P 33/00 (2006. 01)

A 6 1 P 33/00

請求項の数 9 (全 313 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2014-510774 (P2014-510774)
 (86) (22) 出願日 平成24年5月15日 (2012. 5. 15)
 (65) 公表番号 特表2014-517837 (P2014-517837A)
 (43) 公表日 平成26年7月24日 (2014. 7. 24)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2012/059014
 (87) 国際公開番号 W02012/156400
 (87) 国際公開日 平成24年11月22日 (2012. 11. 22)
 審査請求日 平成27年5月13日 (2015. 5. 13)
 (31) 優先権主張番号 11166535. 2
 (32) 優先日 平成23年5月18日 (2011. 5. 18)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 300091441
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アーゲー
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
 バルトアレー 215
 (74) 代理人 100086771
 弁理士 西島 孝喜
 (74) 代理人 100088694
 弁理士 弟子丸 健
 (74) 代理人 100094569
 弁理士 田中 伸一郎
 (74) 代理人 100084663
 弁理士 箱田 篤
 (74) 代理人 100093300
 弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

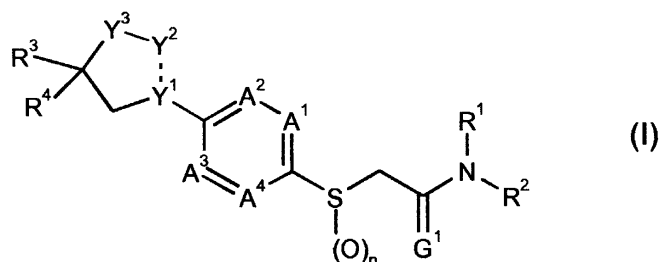
(54) 【発明の名称】 アリールチオアセトアミド誘導体をベースとする殺虫化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



10

(式中、

A¹が C - R^{5b}であり；A²、A³および A⁴が、C - Hであり；G¹が、酸素であり；

20

$Y_1 - Y_2 - Y_3$ が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または
 $N-CH_2-CH_2-$ であり；

n が、0、1または2であり；

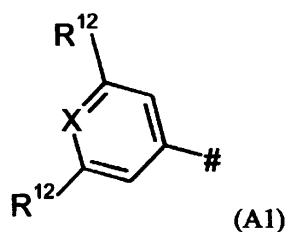
R^1 が、水素であり；

R^2 が、プロピル、ブチル、フルオロプロピル、フルオロブチル、ジフルオロプロピル、ジフルオロブチル、トリフルオロプロピル、トリフルオロブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチレン、シクロブチルメチレン、アリル、またはプロパギルであり； R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり；

R^4 が、基 A 1

【化 2】

10



20

(式中、

X が、 $C-R^{12}$ であり、

各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも 2 つの R^{12} が水素でない；

R^{5b} が、クロロ、ブロモまたはメチルである。)

の化合物；あるいはその塩またはN-オキシド。

【請求項 2】

$Y_1 - Y_2 - Y_3$ が、 $-C=N-O-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 3】

$Y_1 - Y_2 - Y_3$ が、 $-C=N-CH_2-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

$Y_1 - Y_2 - Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

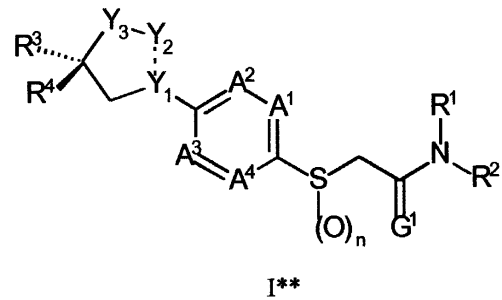
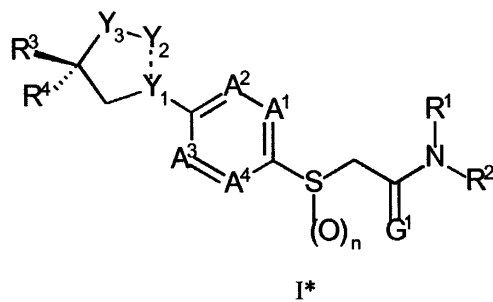
【請求項 5】

$Y_1 - Y_2 - Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

式 I^* の化合物および式 II^* の化合物

【化 3】



10

を含む混合物であって、式中、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—、—C=N—CH₂—、—C=CH—O—または—N—CH₂—CH₂—であり、A¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、G¹およびnが、請求項1～5のいずれか一項に定義されるとおりであり、式I*およびI**の前記化合物両方の総量と比較した式I**の前記化合物のモル比が50%を超える、式I*の化合物および式I**の化合物を含む混合物。

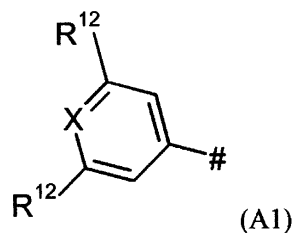
【請求項7】

20

A¹がC—R^{5b}であり；A²、A³およびA⁴がC—Hであり；G¹が酸素であり；Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—、—C=N—CH₂—、—C=CH—O—または—N—CH₂—CH₂—であり；R¹が水素であり；R²が、プロピル、ブチル、フルオロプロピル、フルオロブチル、ジフルオロプロピル、ジフルオロブチル、トリフルオロプロピル、トリフルオロブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチレン、シクロブチルメチレン、アリルまたはプロパルギルであり；R³が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり；R⁴が基A1

【化 4】

30



であり、式中、XがC—R¹²であり、各R¹²が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つのR¹²が水素でなく；R^{5b}が、クロロ、ブロモまたはメチルであり、式I*およびI**の前記化合物両方の総量と比較した式I**の前記化合物のモル比が70%を超える、請求項6に記載の化合物。

40

【請求項8】

殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物に有効な量の請求項1～7のいずれか一項に記載の式(I)の化合物と、場合により、生物学的活性を有する少なくとも1種の追加の化合物とを含む、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物組成物。

【請求項9】

殺虫的に有効な量の成分Aと、殺虫的に有効な量の成分Bとを含む組合せ生成物であって、成分Aが、請求項1～7のいずれか一項に記載の式(I)の化合物であり、成分Bが

50

、イミダクロプリド、エンロフロキサシン、プラジカンテル、エンボン酸ピランテル、フェバンテル、ペネタマート、メロキシカム、セファレキシン、カナマイシン、ピモベンダ
ン、クレンプテロール、フィプロニル、イベルメクチン、オメプラゾール、チアムリン、
ベナゼプリル、ミルベマイシン、シロマジン、チアメトキサム、ピリプロール、デルタメ
トリン、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォベシン、ツラスロマイシ
ン、セフチオフル、セラメクチン、カルプロフェン、メタフルミゾン、モキシデクチン、
メトプレン（S-メトプレンを含む）、クロルスロン、ピランテル、アミトラズ、トリク
ラベンダゾール、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、ド
ラメクチン、セラメクチン、ネマデクチン、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェ
ンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、オキシベ
ンダゾール、パーベンダゾール、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル、オ
キサニテル、モランテル、トリクラベンダゾール、エプシプランテル、フィプロニル、ル
フェヌロン、エクジソンおよびテブフェノジドからなる群から選択される少なくとも1種
の化合物である組合せ生成物。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、特定のアリールチオアセトアミドおよびその誘導体、これらの化合物を調製
するための方法および中間体、これらの化合物を含む殺虫、殺ダニ、殺線虫および殺軟体
動物組成物ならびに昆虫、ダニ、線虫および軟体動物有害生物を防除するためにこれらの
化合物を使用する方法に関する。

20

【背景技術】

【0002】

殺虫性を有する特定の化合物が、例えば、特開2007106756号公報に開示され
ている。ここで、意外にも、特定のオルト置換アリールチオアセトアミドが、オルト置換
基およびチオアセトアミド側鎖がない以外は構造的に類似した化合物と比較して、大幅に
向上した殺虫性を有することが見出された。

【発明の概要】

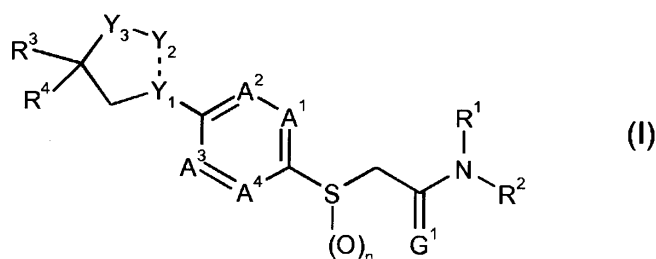
【課題を解決するための手段】

【0003】

30

したがって、第1の態様において、本発明は、式I

【化1】



40

(式中、

A¹がC-R^{5b}であり；

A²、A³およびA⁴が、互いに独立して、C-H、C-R^{5a}または窒素であり；

G¹が、酸素または硫黄であり；

Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-O-、-C=N-CH₂-、-C=CH-O-または
N-CH₂-CH₂-であり；

nが、0、1または2であり；

50

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、1～5つの R^6 で置換される $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_8$ アルコキシカルボニルであり；

R^2 が、 $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、アリール- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはアリール- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、アリール部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ヘテロシクリル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはヘテロシクリル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、ヘテロシクリル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、アリールまたは1～5つの R^8 で置換されるアリール、ヘテロシクリルまたは1～5つの R^8 で置換されるヘテロシクリル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルアミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル-アミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O-N=CH-または $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル-O-N=CH-、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O-N=CH- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル-O-N=CH- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、シアノ、または $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルであり；

R^3 が、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルであり；

R^4 が、アリールまたは1～5つの R^9 で置換されるアリール、あるいはヘテロアリールまたは1～5つの R^9 で置換されるヘテロアリールであり；

各 R^{5a} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルであり；

R^{5b} が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルであり、

または R^{5a} および R^{5b} が一緒に、-CH=CH-CH=CH-架橋または-N=CH-CH=CH-架橋を形成し；

各 R^6 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、メルカプト、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、または $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルであり；

各 R^7 が、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルであり；

各 R^8 および R^9 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、メルカプト、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、アリールまたは1～5つの R^{10} で置換されるアリールあるいはヘテロシクリルまたは1～5つの R^{10} で置換されるヘテロシクリルであり；

各 R^{10} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシである）の化合物；あるいはその塩またはN-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0004】

式(I)の化合物は、様々な幾何異性体または光学異性体または互変異性体の形で存在してもよい。本発明は、あらゆる割合における全てのこのような異性体および互変異性体ならびにそれらの混合物ならびに重水素化合物などの同位体を包含する。

【0005】

本発明の化合物は、例えば、 $-CR^3R^4-$ 基において1個以上の不斉炭素原子を含有してもよく、エナンチオマーとして（またはジアステレオ異性体対として）あるいはこれらの混合物として存在してもよい。さらに、いずれかの基がSOである場合、本発明の化合物は、スルホキッドであり、これは、2つのエナンチオマー形態で存在することもできる。

10

【0006】

アルキル基（単独であるいはアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルカルボニルまたはアルコシカルボニルなどの大きい基の一部として）は、直鎖または分枝鎖の形態であり得、例えば、メチル、エチル、プロピル、プロパー2-イル、ブチル、ブター2-イル、2-メチルプロパー1-イルまたは2-メチルプロパー2-イルである。アルキル基は、好ましくは $C_1 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_1 \sim C_4$ 、最も好ましくは $C_1 \sim C_3$ アルキル基である。アルキル部分が置換されていることが記載される場合、アルキル部分は、好ましくは1~4つの置換基、最も好ましくは1~3つの置換基で置換される。

20

【0007】

アルキレン基は、直鎖または分枝鎖の形態であり得、例えば、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-CH_2-$ 、または $-CH(CH_2CH_3)-$ である。アルキレン基は、好ましくは $C_1 \sim C_3$ 、より好ましくは $C_1 \sim C_2$ 、最も好ましくは C_1 アルキレン基である。

【0008】

アルケニル基は、直鎖または分枝鎖の形態であり得、必要に応じて、(E)-または(Z)-配置のいずれかのものであり得る。例は、ビニルおよびアリルである。アルケニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルケニル基である。

30

【0009】

アルキニル基は、直鎖または分枝鎖の形態であり得る。例は、エチニルおよびプロパルギルである。アルキニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルキニル基である。

【0010】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。

【0011】

ハロアルキル基（単独であるいはハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニルまたはハロアルキルスルホニルなどの大きい基の一部として）は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1個以上で置換されるアルキル基であり、例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチルまたは2, 2, 2-トリフルオロエチルである。

40

【0012】

ハロアルケニル基は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1個以上で置換されるアルケニル基であり、例えば、2, 2-ジフルオロビニルまたは1, 2-ジクロロ-2-フルオロビニルである。

【0013】

ハロアルキニル基は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1個以上で置換されるアルキニル基であり、例えば、1-クロロプロパー2-イニルである。

【0014】

50

シクロアルキル基または炭素環は、単環または二環式であり得、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロヘキシルおよびビシクロ [2, 2, 1] -ヘプタン-2-イルである。シクロアルキル基は、好ましくは $C_3 \sim C_8$ 、より好ましくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基である。シクロアルキル部分が置換されていることが記載される場合、シクロアルキル部分は、好ましくは1～4つの置換基、最も好ましくは1～3つの置換基で置換される。

【0015】

アリール基（単独であるいはアリール-アルキレン-などの大きい基の一部として）は、単環、二環または三環式であり得る芳香環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニルまたはフェナントレニルが挙げられる。好ましいアリール基は、フェニルおよびナフチルであり、フェニルが最も好ましい。アリール部分が置換されていることが記載される場合、アリール部分は、好ましくは1～4つの置換基、最も好ましくは1～3つの置換基で置換される。

10

【0016】

ヘテロアリール基（単独であるいはヘテロアリール-アルキレン-などの大きい基の一部として）は、少なくとも1個のヘテロ原子を含有し、単環または2つ以上の縮合環のいずれかからなる芳香環系である。好ましくは、単環は、最大で3個のヘテロ原子を含有し、二環系は、最大で4個のヘテロ原子を含有し、ヘテロ原子は、好ましくは窒素、酸素および硫黄から選択される。単環式基の例としては、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル（例えば1, 2, 4トリアゾリル）、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリルおよびチアジアゾリルが挙げられる。二環式基の例としては、プリニル、キノリニル、シンノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニルおよびベンゾチアゾリルが挙げられる。単環式ヘテロアリール基が好ましく、ピリジルが最も好ましい。ヘテロアリール部分が置換されていることが記載される場合、ヘテロアリール部分は、好ましくは1～4つの置換基、最も好ましくは1～3つの置換基で置換される。

20

【0017】

ヘテロシクリル基または複素環（単独であるいはヘテロシクリル-アルキレン-などの大きい基の一部として）は、ヘテロアリール基およびさらにそれらの不飽和または部分的に不飽和の類似体を含むものと定義される。単環式基の例としては、イソオキサゾリル、チエタニル (thietanyl)、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1, 3]ジオキサラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1, 4]ジオキサニル、ならびにモルホリニルまたは1-オキソ-チエタニルおよび1, 1-ジオキソ-チエタニルなどのそれらの酸化形態が挙げられる。二環式基の例としては、2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、ベンゾ[1, 4]ジオキサラニル、ベンゾ[1, 3]ジオキサラニル、クロメニル、および2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキシニル (dioxiny l) が挙げられる。ヘテロシクリル部分が置換されていることが記載される場合、ヘテロシクリル部分は、好ましくは1～4つの置換基、最も好ましくは1～3つの置換基で置換される。

30

【0018】

A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 G^1 、 n 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} の好ましい値は、任意の組合せで、以下のとおりである。

40

【0019】

好ましくは A^2 、 A^3 および A^4 のうちの2つ以下が窒素である。

【0020】

好ましくは A^2 がC-H、C- R^{5a} またはNであり、より好ましくは A^2 がC-HまたはC- R^{5a} であり、最も好ましくは A^2 がC-Hである。

【0021】

好ましくは A^3 がC-HまたはNであり、最も好ましくは A^3 がC-Hである。

50

【0022】

好ましくは A^4 がC-HまたはNであり、最も好ましくは A^4 がC-Hである。

【0023】

化合物の1つの群において、 A^2 、 A^3 および A^4 がC-HまたはNであり、 A^2 、 A^3 および A^4 のうちの2つ以下がNであり、 A^3 および A^4 が両方ともNであるというわけではない。好ましくは A^2 がC-Hであり、 A^3 および A^4 がC-Hであり、または A^3 および A^4 の一方がNである。より好ましくは A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hである。

【0024】

好ましくは G^1 が酸素である。

【0025】

好ましくは R^1 が、水素、メチル、エチル、メチルカルボニルまたはメトキシカルボニル、より好ましくは水素、メチルまたはエチル、さらにより好ましくは水素またはメチル、最も好ましくは水素である。

【0026】

好ましくは、 R^2 が、 $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、アリール- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはアリール- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、アリール部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ヘテロシクリル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはヘテロシクリル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、ヘテロシクリル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、アリールまたは1～5つの R^8 で置換されるアリール、ヘテロシクリルまたは1～5つの R^8 で置換されるヘテロシクリル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルアミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル-アミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンであり、式中、各アリール基がフェニル基であり、各ヘテロシクリル基が、独立して、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラヒドロチオフェニル、テトラゾリル、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、キノリニル、シンノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、オキセタニル、チエタニル、オキソ-チエタニル、ジオキソ-チエタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1, 3] ジオキソラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1, 4] ジオキサニル、およびモルホリニル、2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、ベンゾ[1, 3] ジオキソラニル、および2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4] ジオキシニルから選択される。

【0027】

より好ましくは R^2 が、 $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン、フェニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはフェニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、フェニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ピリジル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはピリジル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、ピリジル部分が、1～4つの R^8 で置換される）、オキセタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるオキセタニル、チエタニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはチエタニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、チエタニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、オキソ-チエタニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはオキソ-チエタニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、オキソ-チエタニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ジオキソ-チエタニル- $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたはジオ

10

20

30

40

50

キソーチエタニル— $C_1 \sim C_4$ アルキレン（ここで、ジオキソーチエタニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、チエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるチエタニル、オキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるオキソーチエタニル、ジオキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるジオキソーチエタニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル— $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルアミノカルボニル— $C_1 \sim C_4$ アルキレンまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル—アミノカルボニル— $C_1 \sim C_4$ アルキレンである。

【0028】

さらにより好ましくは R^2 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル—メチレンまたは1～5つの R^7 で置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル—メチレン、フェニル— $C_1 \sim C_2$ アルキレンまたはフェニル— $C_1 \sim C_2$ アルキレン（ここで、フェニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ピリジル— $C_1 \sim C_2$ アルキレンまたはピリジル— $C_1 \sim C_2$ アルキレン（ここで、ピリジル部分が、1～4つの R^8 で置換される）、チエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるチエタニル、オキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるオキソーチエタニル、ジオキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるジオキソーチエタニルである。

【0029】

最も好ましくは R^2 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル—メチレンまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル—メチレン、 $C_2 \sim C_4$ アルケニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2 \sim C_4$ アルキニルである。具体的な基の例としては、エチル、プロピル、ブチル、フルオロエチル、フルオロプロピル、フルオロブチル、ジフルオロエチル、ジフルオロプロピル、ジフルオロブチル、トリフルオロエチル、トリフルオロプロピル、トリフルオロブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチレン、シクロブチルメチレン、アリル、プロパルギルが挙げられる。

【0030】

好ましくは R^3 が、クロロジフルオロメチルまた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。

【0031】

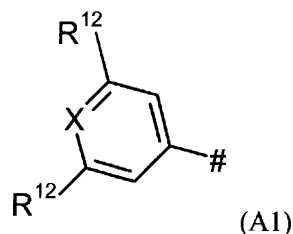
好ましくは R^4 が、アリールまたは1～3つの R^9 で置換されるアリールであり、より好ましくは R^4 が、フェニルまたは1～3つの R^9 で置換されるフェニルであり、さらにより好ましくは R^4 が、1～3つの R^9 で置換されるフェニルであり、より好ましくは R^4 が、3, 5-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-ブromoフェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ジクロロ-4-ヨードフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-ブromoフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3, 4-ジクロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、4-クロロ-3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、3-(トリフルオロメチル)フェニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジル、2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジル、より好ましくは3, 5-ジクロロフェニル、より好ましくは3-クロロ-5-ブromoフェニル、3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ビス(トリフルオロ

メチル)フェニル、3-(トリフルオロメチル)フェニル、2,6-ジクロロ-4-ピリジル、2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジル、3,5-ジクロロ-4-ブロモフェニル、3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3,5-ジブロモフェニル、または3,4-ジクロロフェニルである。

【0032】

化合物の1つの群において、 R^4 が基A1

【化2】



10

であり、式中、 X が、 $C-R^{12}$ または窒素（好ましくは $C-R^{12}$ ）であり、各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つの R^{12} が水素でない。

20

【0033】

好ましくは各 R^{5a} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2\sim C_8$ アルケニル、より好ましくはハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_2\sim C_8$ アルケニル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキル、さらにより好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、ビニル、最も好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シクロプロピル、トリフルオロメチル、ビニルまたはメチルである。

【0034】

好ましくは R^{5b} が、ハロゲン、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2\sim C_8$ アルケニル、より好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、ビニル、さらにより好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シクロプロピル、トリフルオロメチル、ビニルまたはメチル、最も好ましくはブロモ、クロロ、またはメチル、最も好ましくはクロロ、ブロモまたはメチルである。化合物の1つの群において、 R^{5b} がブロモである。化合物の1つの群において、 R^{5b} がクロロである。化合物の1つの群において、 R^{5b} がメチルである。化合物の1つの群において、 R^{5b} が、クロロまたはブロモである。

30

【0035】

好ましくは各 R^6 が、独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、より好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、さらにより好ましくはクロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシまたはトリフルオロメトキシ、最も好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、またはトリフルオロメチルである。

40

【0036】

好ましくは各 R^7 が、独立して、クロロ、フルオロ、シアノ、またはメチルまたはトリフルオロメチル、最も好ましくはフルオロ、シアノ、またはメチルである。

【0037】

好ましくは各 R^8 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_1\sim$

50

C₈ハロアルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、ヒドロキシ、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、メルカプト、C₁～C₈アルキルチオ、C₁～C₈ハロアルキルチオ、C₁～C₈アルキルスルフィニル、C₁～C₈ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₈アルキルスルホニル、C₁～C₈ハロアルキルスルホニル、C₁～C₈アルキルカルボニル、C₁～C₈アルコキシカルボニル、アリールまたは1～5つのR¹⁰で置換されるアリール、またはヘテロシクリルまたは1～5つのR¹⁰で置換されるヘテロシクリル、より好ましくは各R⁸が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₈アルキル、C₁～C₈ハロアルキル、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、より好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、またはトリフルオロメトキシ、最も好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、シアノまたはメチルである。

10

【0038】

好ましくは各R⁹が、独立して、ハロゲン、C₁～C₈アルキル、C₁～C₈ハロアルキル、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₁～C₈アルキルチオ、またはC₁～C₈ハロアルキルチオ、より好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、メトキシ、またはメチルチオ、最も好ましくはトリフルオロメチル、ブロモまたはクロロである。

【0039】

好ましくは各R¹⁰が、独立して、ブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、またはトリフルオロメトキシ、より好ましくはブロモ、クロロ、フルオロ、ニトロ、またはメチル、最も好ましくはクロロ、フルオロ、またはメチルである。

20

【0040】

化合物の1つの群において、nが0である。化合物の別の群において、nが1である。化合物の別の群において、nが2である。好ましくはnが0である。

【0041】

化合物の1つの群において、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—である。化合物の別の群において、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—である。化合物の別の群において、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—である。化合物の別の群において、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—である。

30

【0042】

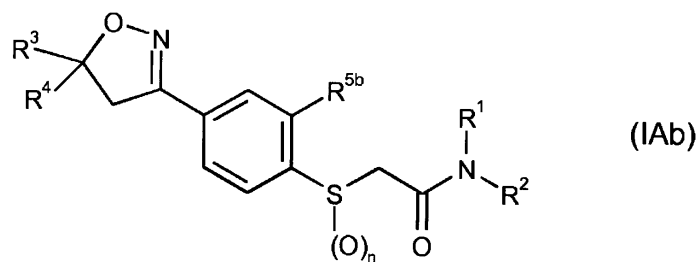
化合物の1つの群において、隣接する炭素原子上のR^{5a}およびR^{5b}が一緒に、—CH=CH—CH=CH—架橋または—N=CH—CH=CH—架橋を形成する。化合物の別の群において、隣接する炭素原子上のR^{5a}およびR^{5b}が一緒に、—CH=CH—CH=CH—架橋または—N=CH—CH=CH—架橋を形成しない。

【0043】

化合物の1つの群において、本発明は、式I A a（式中、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—である）の化合物に関し、他の置換基の定義およびその好ましい定義は、上に定義されるとおりである。化合物のこの群内の特に好ましい実施形態が、式I A b

40

【化 3】



10

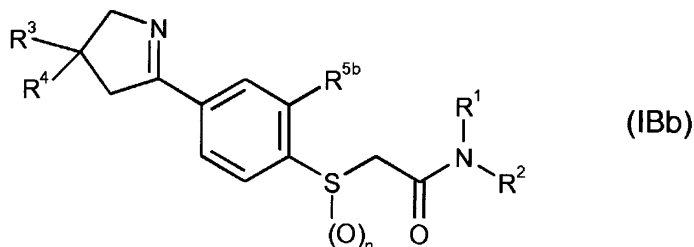
の化合物によって表され、式中、 R^3 、 R^4 、 R^{5b} 、 n 、 R^1 および R^2 が、その好ましい定義を含めて、式 I の化合物について定義されたとおりである。好ましくは R^{5b} が、ブロモ、クロロ、またはメチルである。式 I A b の化合物の 1 つの群において、 R^{5b} が、ブロモまたはクロロである。

【0044】

化合物の 1 つの群において、本発明は、式 I B a (式中、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=N-CH_2-$ である) の化合物に関し、他の置換基の定義およびその好ましい定義は、上に定義されたとおりである。化合物のこの群内の特に好ましい実施形態が、式 I B b

20

【化 4】



30

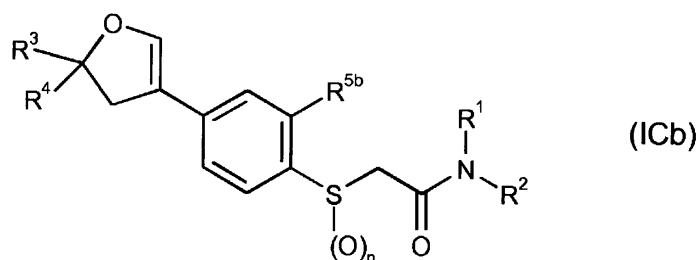
の化合物によって表され、式中、 R^3 、 R^4 、 R^{5b} 、 n 、 R^1 および R^2 が、その好ましい定義を含めて、式 I の化合物について定義されたとおりである。好ましくは R^{5b} が、ブロモ、クロロ、またはメチルである。式 I B b の化合物の 1 つの群において、 R^{5b} が、ブロモまたはクロロである。

【0045】

化合物の 1 つの群において、本発明は、式 I C a (式中、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=CH-O-$ である) の化合物に関し、他の置換基の定義およびその好ましい定義は、上に定義されたとおりである。化合物のこの群内の特に好ましい実施形態が、式 I C b

40

【化 5】



10

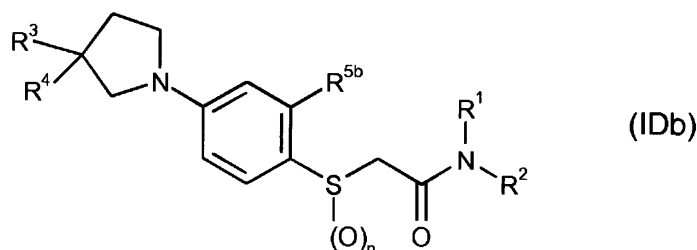
の化合物によって表され、式中、 R^3 、 R^4 、 R^{5b} 、 n 、 R^1 および R^2 が、その好ましい定義を含めて、式 I の化合物について定義されたとおりである。好ましくは R^{5b} が、プロモ、クロロ、またはメチルである。式 I C b の化合物の 1 つの群において、 R^{5b} が、プロモまたはクロロである。

【0046】

化合物の 1 つの群において、本発明は、式 I D a (式中、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ である) の化合物に関し、他の置換基の定義およびその好ましい定義は、

20

【化 6】



30

の化合物によって表され、式中、 R^3 、 R^4 、 R^{5b} 、 n 、 R^1 および R^2 が、その好ましい定義を含めて、式 I の化合物について定義されたとおりである。好ましくは R^{5b} が、プロモ、クロロ、またはメチルである。式 I D b の化合物の 1 つの群において、 R^{5b} が、プロモまたはクロロである。

【0047】

化合物の 1 つの群において、 A^2 が C—H であり、 A^3 および A^4 が C—H であり、または A^3 および A^4 の一方が N であり； G^1 が O であり、 R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が、3, 5-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-ブromoフェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ジクロロ-4-ヨードフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-ブromoフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3, 4-ジクロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、4-クロロ-3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル、3-(トリフルオロメチル)フェニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジル、2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジル、特に、3, 5-ジブromoフェニル、3, 5-ジク

40

50

ロローフェニル、3, 5-ビス- (トリフルオロメチル) -フェニル、4-ブロモ-3, 5-ジクロロフェニルまたは3, 4, 5-トリクロロフェニルである。

【0048】

化合物の1つの群において、 A^2 がC-Hであり、 A^3 および A^4 がC-Hであり、または A^3 および A^4 の一方がNであり； G^1 がOであり、 R^1 がHであり、 R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が、3, 5-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-ブロモフェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ジクロロ-4-ヨードフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-ブロモフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-クロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 4-ジクロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、4-クロロ-3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、3- (トリフルオロメチル) フェニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジル、2, 6-ビス (トリフルオロメチル) -4-ピリジル、特に、3, 5-ジブロモフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 5-ビス- (トリフルオロメチル) -フェニル、4-ブロモ-3, 5-ジクロロフェニルまたは3, 4, 5-トリクロロフェニルである。

10

【0049】

化合物の1つの群において、 A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hであり； G^1 がOであり、 R^1 がHであり、 R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が、3, 5-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-ブロモフェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ジクロロ-4-ヨードフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-ブロモフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-クロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 4-ジクロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、4-クロロ-3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、3- (トリフルオロメチル) フェニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジル、2, 6-ビス (トリフルオロメチル) -4-ピリジル、特に、3, 5-ジブロモフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 5-ビス- (トリフルオロメチル) -フェニル、4-ブロモ-3, 5-ジクロロフェニルまたは3, 4, 5-トリクロロフェニルである。

20

30

【0050】

化合物の1つの群において、 A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hであり； G^1 がOであり、 R^1 がHであり、 R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が、3, 5-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-ブロモフェニル、3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、3, 5-ジクロロ-4-ヨードフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-ブロモフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、3-クロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 4-ジクロロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、4-クロロ-3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル、3- (トリフルオロメチル) フェニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジル、2, 6-ビス (トリフルオロメチル) -4-ピリジル、特に、3, 5-ジブロモフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 5-ビス- (トリフルオロメチル) -フェニル、4-ブロモ-3, 5-ジクロロフェニルまたは3, 4, 5-トリクロロフェニルであり； R^{5b} が、ブロモ、クロロ、またはメチルである。

40

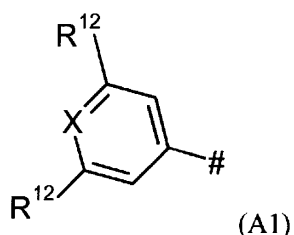
【0051】

化合物の1つの群において、 A^1 がC- R^{5b} であり； A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hであり

50

； G^1 がOであり； $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $-N-CH_2-CH_2-$ であり； R^1 が水素であり； R^2 が、 $C_1\sim C_4$ アルキルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル-メチレンまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3\sim C_6$ シクロアルキル-メチレン、 $C_2\sim C_4$ アルケニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_2\sim C_4$ アルキニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2\sim C_4$ アルキニルであり； R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が基A 1

【化 7】



であり、式中、Xが、 $C-R^{12}$ または窒素（好ましくは $C-R^{12}$ ）であり、各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つの R^{12} が水素でなく； R^{5b} が、クロロ、ブロモまたはメチルである。

【0052】

化合物の1つの群において、 A^1 が $C-R^{5b}$ であり； A^2 、 A^3 および A^4 が $C-H$ であり； G^1 がOであり； $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ であり； R^1 が水素であり； R^2 が、 $C_1\sim C_4$ アルキルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル-メチレンまたはハロゲン、メチルおよびハロメチルから独立して選択される1～5つの基で置換される $C_3\sim C_6$ シクロアルキル-メチレン、 $C_2\sim C_4$ アルケニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_2\sim C_4$ アルキニルまたは1～5つのハロゲンで置換される $C_2\sim C_4$ アルキニルであり； R^3 がトリフルオロメチルであり； R^4 が基A 1であり、式中、Xが、 $C-R^{12}$ または窒素（好ましくは $C-R^{12}$ ）であり、各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つの R^{12} が水素でなく； R^{5b} が、クロロ、ブロモまたはメチルである。

【0053】

化合物の1つの群において、 A^1 が $C-R^{5b}$ であり； A^2 、 A^3 および A^4 が $C-H$ であり； G^1 が酸素であり； $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $-N-CH_2-CH_2-$ であり； R^1 が水素であり； R^2 が、エチル、プロピル、ブチル、フルオロエチル、フルオロプロピル、フルオロブチル、ジフルオロエチル、ジフルオロプロピル、ジフルオロブチル、トリフルオロエチル、トリフルオロプロピル、トリフルオロブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチレン、シクロブチルメチレン、アリルまたはプロパルギルであり； R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が基A 1であり、式中、Xが $C-R^{12}$ であり、各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つの R^{12} が水素でなく； R^{5b} が、クロロ、ブロモまたはメチルである。

【0054】

化合物の1つの群において、 A^1 が $C-R^{5b}$ であり； A^2 、 A^3 および A^4 が $C-H$ であり

; G^1 がOであり; $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ であり; R^1 が水素であり; R^2 が、 C_1-C_4 アルキルまたは1~5つのハロゲンで置換される C_1-C_4 アルキルであり; R^3 がトリフルオロメチルであり; R^4 が基A 1であり、式中、Xが、 $C-R^{12}$ または窒素(好ましくは $C-R^{12}$)であり、各 R^{12} が、独立して、水素、ハロゲンまたはトリハロメチルであり、少なくとも2つの R^{12} が水素でなく; R^{5b} が、クロロ、ブロモまたはメチルである。

【0055】

化合物の1つの群において、本発明は、式I(式中、

A^1 が $C-R^{5b}$ であり;

A^2 、 A^3 および A^4 が、互いに独立して、 $C-H$ 、 $C-R^{5a}$ または窒素であり;

G^1 が、酸素または硫黄であり;

$Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $N-CH_2-CH_2-$ であり;

nが、0、1または2であり;

R^1 が、水素、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_8 アルコキシ、 C_1-C_8 アルキルカルボニルまたは C_1-C_8 アルコキシカルボニルであり;

R^2 が、 C_1-C_8 アルキルまたは1~5つの R^6 で置換される C_1-C_8 アルキル、 C_2-C_8 アルケニルまたは1~5つの R^6 で置換される C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 アルキニルまたは1~5つの R^6 で置換される C_2-C_8 アルキニル、 C_3-C_{10} シクロアルキルまたは1~5つの R^7 で置換される C_3-C_{10} シクロアルキル、アリール- C_1-C_4 アルキレンまたはアリール- C_1-C_4 アルキレン(ここで、アリール部分が、1~5つの R^8 で置換される)、ヘテロシクリル- C_1-C_4 アルキレンまたはヘテロシクリル- C_1-C_4 アルキレン(ここで、ヘテロシクリル部分が、1~5つの R^8 で置換される)、アリールまたは1~5つの R^8 で置換されるアリール、ヘテロシクリルまたは1~5つの R^8 で置換されるヘテロシクリル、 C_1-C_8 アルキルアミノカルボニル- C_1-C_4 アルキレン、 C_1-C_8 ハロアルキルアミノカルボニル- C_1-C_4 アルキレン、 C_3-C_8 シクロアルキル-アミノカルボニル- C_1-C_4 アルキレン、 C_1-C_6 アルキル- $O-N=CH-$ または C_1-C_6 ハロアルキル- $O-N=CH-$ であり;

R^3 が、 C_1-C_8 ハロアルキルであり;

R^4 が、アリールまたは1~5つの R^9 で置換されるアリールあるいはヘテロアリールまたは1~5つの R^9 で置換されるヘテロアリールであり;

各 R^{5a} および R^{5b} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_8 ハロアルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 ハロアルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、 C_2-C_8 ハロアルキニル、 C_3-C_{10} シクロアルキル、 C_1-C_8 アルコキシ、 C_1-C_8 ハロアルコキシ、 C_1-C_8 アルキルチオ、 C_1-C_8 ハロアルキルチオ、 C_1-C_8 アルキルスルフィニル、 C_1-C_8 ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_8 アルキルスルホニルまたは C_1-C_8 ハロアルキルスルホニルであり;

各 R^6 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1-C_8 アルコキシ、 C_1-C_8 ハロアルコキシ、 C_1-C_8 アルキルカルボニル、 C_1-C_8 アルコキシカルボニル、メルカプト、 C_1-C_8 アルキルチオ、 C_1-C_8 ハロアルキルチオ、 C_1-C_8 アルキルスルフィニル、 C_1-C_8 ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_8 アルキルスルホニル、または C_1-C_8 ハロアルキルスルホニルであり;

各 R^7 が、独立して、ハロゲンまたは C_1-C_8 アルキルであり;

各 R^8 および R^9 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_8 アルキル、 C_1-C_8 ハロアルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 ハロアルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、 C_2-C_8 ハロアルキニル、ヒドロキシ、 C_1-C_8 アルコキシ、 C_1-C_8 ハロアルコキシ、メルカプト、 C_1-C_8 アルキルチオ、 C_1-C_8 ハロアルキルチオ、 C_1-C_8 アルキルスルフィニル、 C_1-C_8 ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_8 アルキルスルホニル、 C_1-C_8 ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_8 アルキルカルボニル、 C_1-C_8 アルコキシカルボニル、アリールまたは1~5つの R^{10} で置換されるアリールあるいはヘテロシクリルまた

10

20

30

40

50

は1～5つの R^{10} で置換されるヘテロシクリルであり；

各 R^{10} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシまたは $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシである）の化合物を提供する。

【0056】

化合物の1つの群において、 A^2 、 A^3 および A^4 が $C-H$ であり； G^1 が O であり、 R^1 が H であり； R^2 が、 $C_1\sim C_4$ アルキルまたは1～5つの R^6 で置換される $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_4\sim C_6$ シクロアルキルまたは1～5つの R^7 で置換される $C_4\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル- $C_1\sim C_2$ アルキレンまたはフェニル- $C_1\sim C_2$ アルキレン（ここで、フェニル部分が、1～5つの R^8 で置換される）、ピリジル- $C_1\sim C_2$ アルキレンまたはピリジル- $C_1\sim C_2$ アルキレン（ここで、ピリジル部分が、1～4つの R^8 で置換される）、チエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるチエタニル、オキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるオキソーチエタニル、ジオキソーチエタニルまたは1～5つの R^8 で置換されるジオキソーチエタニルであり； R^3 が、クロロジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルであり； R^4 が、3, 5-ジブロモフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 5-ビス（トリフルオロメチル）フェニル、4-ブロモ-3, 5-ジクロロフェニルまたは3, 4, 5-トリクロロフェニルであり； R^{5b} が、ブロモ、クロロまたはメチルであり；各 R^6 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $C_1\sim C_8$ アルコキシ、 $C_1\sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_8$ アルコキシカルボニル、メルカプト、 $C_1\sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_8$ アルキルスルホニル、または $C_1\sim C_8$ ハロアルキルスルホニルであり；各 R^7 が、独立して、ハロゲンまたは $C_1\sim C_8$ アルキルであり；

各 R^8 および R^9 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2\sim C_8$ アルケニル、 $C_2\sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2\sim C_8$ アルキニル、 $C_2\sim C_8$ ハロアルキニル、ヒドロキシ、 $C_1\sim C_8$ アルコキシ、 $C_1\sim C_8$ ハロアルコキシ、メルカプト、 $C_1\sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_8$ アルコキシカルボニル、アリールまたは1～5つの R^{10} で置換されるアリールあるいはヘテロシクリルまたは1～5つの R^{10} で置換されるヘテロシクリルであり；各 R^{10} が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシまたは $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシである。

【0057】

前述の好ましい置換基の値は、実現可能である場合、上記の化合物の群に適用可能である。

【0058】

特定の間体が新規であり、本発明のさらなる態様としても含まれる。

【0059】

さらなる態様において、本発明は、式 I n t - I

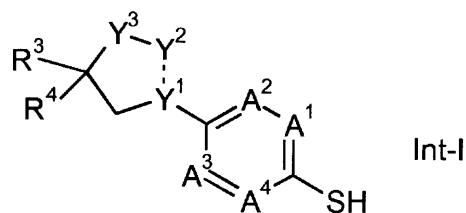
10

20

30

40

【化 8】



10

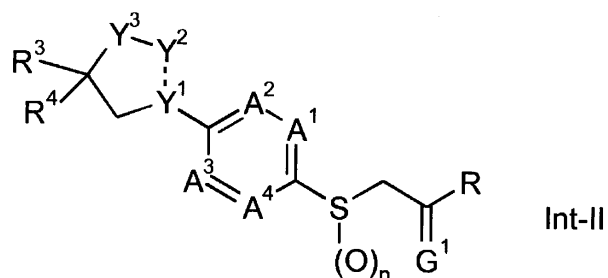
(式中、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 が、式 I の化合物について定義されたとおりである) の化合物あるいはその塩または N-オキsid を提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されたとおりである。式 Int-I の化合物の 1 つの群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-CH_2-$ である。式 Int-I の化合物の別の群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ である。式 Int-I の化合物の別の群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ である。

【0060】

20

さらなる態様において、本発明は、式 Int-I I

【化 9】



30

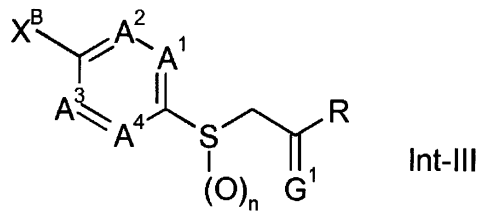
(式中、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 、 R^4 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されたとおりであり、 R が、 OH 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 Cl 、 F または Br である) の化合物あるいはその塩または N-オキsid を提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 、 R^4 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されたとおりである。式 Int-II の化合物の 1 つの群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ である。式 Int-II の化合物の別の群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-CH_2-$ である。式 Int-II の化合物の別の群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ である。式 Int-II の化合物の別の群において、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ である。

40

【0061】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-I I I

【化 1 0】



10

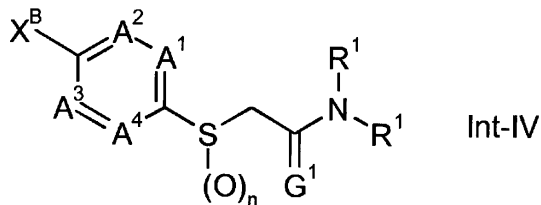
(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されたとおりであり、 R が、 OH 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 Cl 、 F または Br であり、 X^B が、脱離基、例えば、プロモなどのハロゲンであり、または X^B が、シアノまたは $C(O)R^x$ （ここで、 R^x が、 H 、 OH または $C_1 \sim C_{15}$ アルコキシである）であり、好ましくは X^B が、シアノ、ホルミルまたはアセチルである）の化合物、あるいはその塩または N -オキシドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されたとおりである。

【0062】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-IV

20

【化 1 1】



30

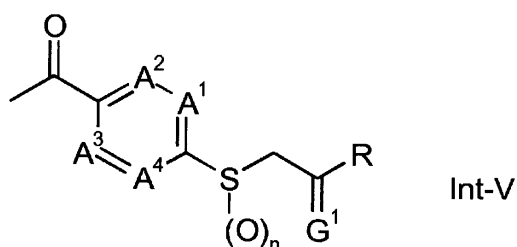
(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されたとおりであり、 X^B が、脱離基、例えば、プロモなどのハロゲンであり、または X^B が、シアノまたは $C(O)R^x$ （ここで、 R^x が、 H 、 OH または $C_1 \sim C_{15}$ アルコキシである）であり、好ましくは X^B が、シアノ、ホルミルまたはアセチルである）の化合物、あるいはその塩または N -オキシドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されたとおりである。

【0063】

式 Int-III の化合物の例は、式 Int-V

【化 1 2】

40

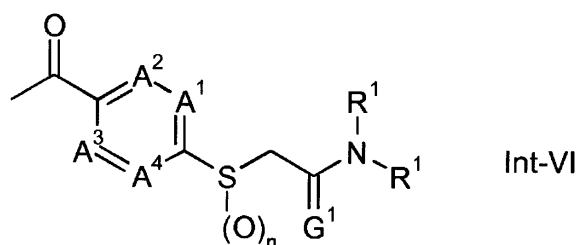


50

(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されるとおりであり、 R が、 OH 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 Cl 、 F または Br である)の化合物あるいはその塩または N -オキシドである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。

【0064】

式 Int-V の化合物の例は、式 Int-VI
【化13】



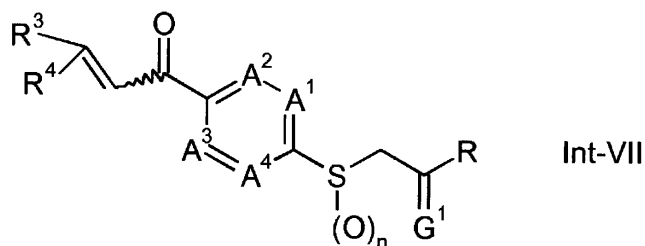
10

(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されるとおりである)の化合物あるいはその塩または N -オキシドである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。

20

【0065】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-VII
【化14】



30

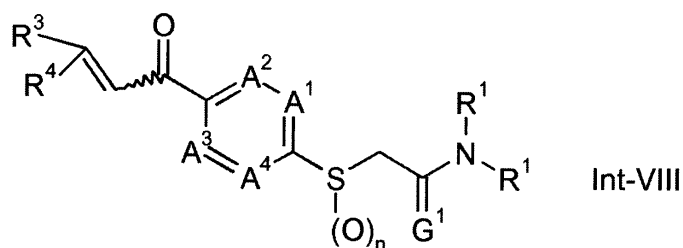
(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 、 R^4 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されるとおりであり、 R が、 OH 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 Cl 、 F または Br である)の化合物あるいはその塩または N -オキシドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 、 R^4 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。

40

【0066】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-VIII

【化 1 5】



10

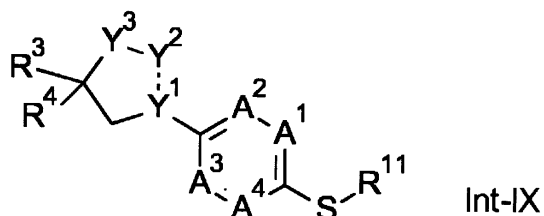
(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 G^1 および n が、式 I の化合物について定義されるとおりである) の化合物あるいはその塩またはN-オキシドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 G^1 および n の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。

【0067】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-IX

【化 1 6】

20



30

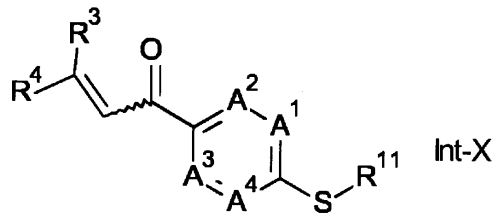
(式中、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=N-O-$ 、 $-C=N-CH_2-$ 、 $-C=CH-O-$ または $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 が、式 I の化合物について定義されるとおりであり、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである) の化合物あるいはその塩またはN-オキシドであって、場合により、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=N-O-$ である場合、 R^4 が3, 5-ジクロロフェニルでないことを条件とする化合物あるいはその塩またはN-オキシドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。アリールが、例えば、フェニルまたはシアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ メトキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロメトキシから選択される1~3つの基で場合により置換されるフェニルである。式 Int-IXの化合物の1つの群において、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=N-O-$ である。式 Int-IXの化合物の別の群において、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=N-CH_2-$ である。式 Int-IXの化合物の別の群において、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-C=CH-O-$ である。式 Int-IXの化合物の別の群において、 Y_1 — Y_2 — Y_3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ である。

40

【0068】

さらなる態様において、本発明は、式 Int-X

【化 1 7】



10

(式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 が、式 I の化合物について定義されるとおりであり、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物あるいはその塩またはN-オキッドを提供する。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^3 および R^4 の好ましい定義は、式 I の化合物について定義されるとおりである。アリールが、例えば、フェニルまたはシアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ メトキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロメトキシから選択される1～3つの基で場合により置換されるフェニルである。

【0069】

本明細書において言及される際の脱離基は、例えば、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アリールスルホニルオキシ、場合により置換される $C_1 \sim C_8$ アリールスルホニルオキシ(アリールが、好ましくはフェニルである)、ジアゾニウム塩(例えば、 $-N_2^+Cl^-$ 、 $-N_2^+BF_4^-$ 、 $-N_2^+Br^-$ 、 $-N_2^+PF_6^-$)、ホスホン酸エステル(例えば $-OP(O)(OR)_2$ であり、ここで、Rが、メチルまたはエチルである)、好ましくはブロモ、ヨード、クロロ、トリフルオロメチルスルホキシ、p-トルエンスルホキシ、塩化ジアゾニウムであり得る。

20

【0070】

以下の表1～672は、本発明の化合物を例示する。

【0071】

30

【表 1】

表 Y

	R5b	n	R2
Y.1	F	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2	F	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3	F	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.4	F	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.5	F	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-

40

【0072】

【表 2】

Y.6	F	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.7	F	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.8	F	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.9	F	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.10	F	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.11	F	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.12	F	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.13	F	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.14	F	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.15	F	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.16	F	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.17	F	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.18	F	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.19	F	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.20	F	0	1-シアノシクロブチル-
Y.21	F	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.22	F	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.23	F	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.24	F	0	1-メチルアリル-
Y.25	F	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.26	F	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.27	F	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.28	F	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.29	F	0	2-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.30	F	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.31	F	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.32	F	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.33	F	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.34	F	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.35	F	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.36	F	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.37	F	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.38	F	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.39	F	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.40	F	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.41	F	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.42	F	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.43	F	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.44	F	0	2-ブロモアリル-
Y.45	F	0	2-ブロモフェニル-
Y.46	F	0	2-ブテニル-
Y.47	F	0	2-クロロアリル-
Y.48	F	0	2-クロロフェニル-
Y.49	F	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.50	F	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.51	F	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.52	F	0	2-シアノエチル-
Y.53	F	0	2-エチルフェニル-
Y.54	F	0	2-フルオロエチル-
Y.55	F	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.56	F	0	2-フルオロプロピル-
Y.57	F	0	2-フリルメチル-
Y.58	F	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.59	F	0	2-メトキシ-エチル-

【0073】

10

20

30

40

【表 3】

Y.60	F	0	2-メトキシフェニル-
Y.61	F	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.62	F	0	2-メチルアリル-
Y.63	F	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.64	F	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.65	F	0	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.66	F	0	2-メチルフェニル-
Y.67	F	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.68	F	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.69	F	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.70	F	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.71	F	0	2-ニトロフェニル-
Y.72	F	0	2-プロピル-
Y.73	F	0	2-ピリジル-
Y.74	F	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.75	F	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.76	F	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.77	F	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.78	F	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.79	F	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.80	F	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.81	F	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.82	F	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.83	F	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.84	F	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.85	F	0	3-プロモアリル-
Y.86	F	0	3-プロモフェニル-
Y.87	F	0	3-ブチル-
Y.88	F	0	3-クロロアリル-
Y.89	F	0	3-クロロフェニル-
Y.90	F	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.91	F	0	3-シアノプロピル-
Y.92	F	0	3-エチルフェニル-
Y.93	F	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.94	F	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.95	F	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.96	F	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.97	F	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.98	F	0	3-メチルフェニル-
Y.99	F	0	3-ニトロフェニル-
Y.100	F	0	3-ピリジル-
Y.101	F	0	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.102	F	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.103	F	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.104	F	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.105	F	0	4-プロモフェニル-
Y.106	F	0	4-クロロフェニル-
Y.107	F	0	4-エチルフェニル-
Y.108	F	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.109	F	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.110	F	0	4-メトキシフェニル-
Y.111	F	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.112	F	0	4-メチルフェニル-
Y.113	F	0	4-メチルピリダ-2-イル

【0074】

【表 4】

Y.114	F	0	4-ニトロフェニル-
Y.115	F	0	4-ピリジル-
Y.116	F	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.117	F	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.118	F	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.119	F	0	アリル-
Y.120	F	0	ブタ-2-イニル-
Y.121	F	0	ブタ-3-イニル-
Y.122	F	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.123	F	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.124	F	0	シアノジメチルメチル-
Y.125	F	0	シアノエチル-
Y.126	F	0	シアノメチル-
Y.127	F	0	シクロベンチル-
Y.128	F	0	シクロプロピル-メチル-
Y.129	F	0	メチルプロパルギル-
Y.130	F	0	オキセタン-3-イル-
Y.131	F	0	ペンタ-3-イル-
Y.132	F	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.133	F	0	プロパルギル-
Y.134	F	0	tert-ブチル-
Y.135	F	0	テトラゾリル-
Y.136	F	0	チアゾール-2-イル-
Y.137	F	0	チアゾール-4-イル-
Y.138	F	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.139	F	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.140	F	0	エチル-
Y.141	F	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.142	F	0	ブタ-2-イル-
Y.143	F	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.144	F	0	ベンジル-
Y.145	F	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.146	F	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.147	F	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.148	F	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.149	F	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.150	F	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.151	F	0	n-ブチル-
Y.152	F	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.153	F	0	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.154	F	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.155	F	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.156	F	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.157	F	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.158	F	0	チエタン-3-イル-
Y.159	F	0	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.160	F	0	シクロブチル-
Y.161	F	0	メチル-
Y.162	F	0	シクロプロピル-
Y.163	F	0	n-プロピル-
Y.164	F	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.165	F	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.166	F	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.167	F	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-

【0075】

【表 5】

Y.168	F	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.169	F	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.170	F	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.171	F	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.172	F	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.173	F	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.174	F	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.175	F	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.176	F	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.177	F	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.178	F	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.179	F	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.180	F	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.181	F	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.182	F	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.183	F	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.184	F	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.185	F	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.186	F	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.187	F	1	1-シアノシクロブチル-
Y.188	F	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.189	F	1	1-シアノシクロヘキシル-
Y.190	F	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.191	F	1	1-メチルアリル-
Y.192	F	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.193	F	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.194	F	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.195	F	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.196	F	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.197	F	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.198	F	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.199	F	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.200	F	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.201	F	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.202	F	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.203	F	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.204	F	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.205	F	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.206	F	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.207	F	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.208	F	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.209	F	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.210	F	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.211	F	1	2-ブロモアリル-
Y.212	F	1	2-ブロモフェニル-
Y.213	F	1	2-ブテニル-
Y.214	F	1	2-クロロアリル-
Y.215	F	1	2-クロロフェニル-
Y.216	F	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.217	F	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.218	F	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.219	F	1	2-シアノエチル-
Y.220	F	1	2-エチルフェニル-
Y.221	F	1	2-フルオロエチル-

【表 6】

Y.222	F	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.223	F	1	2-フルオロプロピル-
Y.224	F	1	2-フリルメチル-
Y.225	F	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.226	F	1	2-メトキシ-エチル-
Y.227	F	1	2-メトキシフェニル-
Y.228	F	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.229	F	1	2-メチルアリル-
Y.230	F	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.231	F	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.232	F	1	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.233	F	1	2-メチルフェニル-
Y.234	F	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.235	F	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.236	F	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.237	F	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.238	F	1	2-ニトロフェニル-
Y.239	F	1	2-プロピル-
Y.240	F	1	2-ピリジル-
Y.241	F	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.242	F	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.243	F	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.244	F	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.245	F	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.246	F	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.247	F	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.248	F	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.249	F	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.250	F	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.251	F	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.252	F	1	3-プロモアリル-
Y.253	F	1	3-プロモフェニル-
Y.254	F	1	3-ブテニル-
Y.255	F	1	3-クロロアリル-
Y.256	F	1	3-クロロフェニル-
Y.257	F	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.258	F	1	3-シアノプロピル-
Y.259	F	1	3-エチルフェニル-
Y.260	F	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.261	F	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.262	F	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.263	F	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.264	F	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.265	F	1	3-メチルフェニル-
Y.266	F	1	3-ニトロフェニル-
Y.267	F	1	3-ピリジル-
Y.268	F	1	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.269	F	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.270	F	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.271	F	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.272	F	1	4-プロモフェニル-
Y.273	F	1	4-クロロフェニル-
Y.274	F	1	4-エチルフェニル-
Y.275	F	1	4-フルオロ-フェニル-

【0077】

【表 7】

Y.276	F	1	4H-1,2,4トリアゾール-3-イル-
Y.277	F	1	4-メトキシフェニル-
Y.278	F	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.279	F	1	4-メチルフェニル-
Y.280	F	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.281	F	1	4-ニトロフェニル-
Y.282	F	1	4-ピリジル-
Y.283	F	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.284	F	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.285	F	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.286	F	1	アリル-
Y.287	F	1	ブタ-2-イニル-
Y.288	F	1	ブタ-3-イニル-
Y.289	F	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.290	F	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.291	F	1	シアノジメチルメチル-
Y.292	F	1	シアノエチル-
Y.293	F	1	シアノメチル-
Y.294	F	1	シクロベンチル-
Y.295	F	1	シクロプロピル-メチル-
Y.296	F	1	メチルプロパルギル-
Y.297	F	1	オキセタン-3-イル-
Y.298	F	1	ペンタ-3-イル-
Y.299	F	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.300	F	1	プロパルギル-
Y.301	F	1	tert-ブチル-
Y.302	F	1	テトラゾリル-
Y.303	F	1	チアゾール-2-イル-
Y.304	F	1	チアゾール-4-イル-
Y.305	F	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.306	F	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.307	F	1	エチル-
Y.308	F	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.309	F	1	ブタ-2-イル-
Y.310	F	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.311	F	1	ベンジル-
Y.312	F	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.313	F	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.314	F	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.315	F	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.316	F	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.317	F	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.318	F	1	n-ブチル-
Y.319	F	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.320	F	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.321	F	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.322	F	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.323	F	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.324	F	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.325	F	1	チエタン-3-イル-
Y.326	F	1	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.327	F	1	シクロブチル-
Y.328	F	1	メチル-
Y.329	F	1	シクロプロピル-

【表 8】

Y.330	F	1	n-プロピル-
Y.331	F	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.332	F	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.333	F	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.334	F	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.335	F	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.336	F	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.337	F	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.338	F	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.339	F	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.340	F	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.341	F	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.342	F	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.343	F	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.344	F	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.345	F	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.346	F	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.347	F	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.348	F	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.349	F	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.350	F	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.351	F	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.352	F	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.353	F	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.354	F	2	1-シアノシクロブチル-
Y.355	F	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.356	F	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.357	F	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.358	F	2	1-メチルアリル-
Y.359	F	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.360	F	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.361	F	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.362	F	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.363	F	2	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.364	F	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.365	F	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.366	F	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.367	F	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.368	F	2	2,3-ジフルオロフェニル-
Y.369	F	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.370	F	2	2,4-ジフルオロフェニル-
Y.371	F	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.372	F	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.373	F	2	2,5-ジフルオロフェニル-
Y.374	F	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.375	F	2	2,6-ジフルオロフェニル-
Y.376	F	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.377	F	2	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.378	F	2	2-ブロモアリル-
Y.379	F	2	2-ブロモフェニル-
Y.380	F	2	2-ブテニル-
Y.381	F	2	2-クロロアリル-
Y.382	F	2	2-クロロフェニル-
Y.383	F	2	2-クロロピリダ-2-イル-

【表 9】

Y.384	F	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.385	F	2	2-シアノシクロプロピル-
Y.386	F	2	2-シアノエチル-
Y.387	F	2	2-エチルフェニル-
Y.388	F	2	2-フルオロエチル-
Y.389	F	2	2-フルオロ-フェニル-
Y.390	F	2	2-フルオロプロピル-
Y.391	F	2	2-フリルメチル-
Y.392	F	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.393	F	2	2-メトキシ-エチル-
Y.394	F	2	2-メトキシフェニル-
Y.395	F	2	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.396	F	2	2-メチルアリル-
Y.397	F	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.398	F	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.399	F	2	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.400	F	2	2-メチルフェニル-
Y.401	F	2	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.402	F	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.403	F	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.404	F	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.405	F	2	2-ニトロフェニル-
Y.406	F	2	2-プロピル-
Y.407	F	2	2-ピリジル-
Y.408	F	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.409	F	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.410	F	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.411	F	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.412	F	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.413	F	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.414	F	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.415	F	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.416	F	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.417	F	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.418	F	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.419	F	2	3-プロモアリル-
Y.420	F	2	3-プロモフェニル-
Y.421	F	2	3-ブテニル-
Y.422	F	2	3-クロロアリル-
Y.423	F	2	3-クロロフェニル-
Y.424	F	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.425	F	2	3-シアノプロピル-
Y.426	F	2	3-エチルフェニル-
Y.427	F	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.428	F	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.429	F	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.430	F	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.431	F	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.432	F	2	3-メチルフェニル-
Y.433	F	2	3-ニトロフェニル-
Y.434	F	2	3-ピリジル-
Y.435	F	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.436	F	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.437	F	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-

【 0 0 8 0 】

【表 10】

Y.438	F	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.439	F	2	4-プロモフェニル-
Y.440	F	2	4-クロロフェニル-
Y.441	F	2	4-エチルフェニル-
Y.442	F	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.443	F	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.444	F	2	4-メトキシフェニル-
Y.445	F	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.446	F	2	4-メチルフェニル-
Y.447	F	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.448	F	2	4-ニトロフェニル-
Y.449	F	2	4-ピリジル-
Y.450	F	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.451	F	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.452	F	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.453	F	2	アリル-
Y.454	F	2	ブタ-2-イル-
Y.455	F	2	ブタ-3-イル-
Y.456	F	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.457	F	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.458	F	2	シアノジメチルメチル-
Y.459	F	2	シアノエチル-
Y.460	F	2	シアノメチル-
Y.461	F	2	シクロベンチル-
Y.462	F	2	シクロプロピル-メチル-
Y.463	F	2	メチルプロパルギル-
Y.464	F	2	オキセタン-3-イル-
Y.465	F	2	ペンタ-3-イル-
Y.466	F	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.467	F	2	プロパルギル-
Y.468	F	2	tert-ブチル-
Y.469	F	2	テトラノリル-
Y.470	F	2	チアゾール-2-イル-
Y.471	F	2	チアゾール-4-イル-
Y.472	F	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.473	F	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.474	F	2	エチル-
Y.475	F	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.476	F	2	ブタ-2-イル-
Y.477	F	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.478	F	2	ベンジル-
Y.479	F	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.480	F	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.481	F	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.482	F	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.483	F	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.484	F	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.485	F	2	n-ブチル-
Y.486	F	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.487	F	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.488	F	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.489	F	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.490	F	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.491	F	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-

【表 1 1】

Y.492	F	2	チエタン-3-イル-
Y.493	F	2	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.494	F	2	シクロブチル-
Y.495	F	2	メチル-
Y.496	F	2	シクロプロピル-
Y.497	F	2	n-プロピル-
Y.498	F	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.499	F	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.500	F	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.501	F	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.502	Cl	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.503	Cl	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.504	Cl	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.505	Cl	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.506	Cl	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.507	Cl	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.508	Cl	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.509	Cl	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.510	Cl	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.511	Cl	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.512	Cl	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.513	Cl	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.514	Cl	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.515	Cl	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.516	Cl	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.517	Cl	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.518	Cl	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.519	Cl	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.520	Cl	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.521	Cl	0	1-シアノシクロブチル-
Y.522	Cl	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.523	Cl	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.524	Cl	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.525	Cl	0	1-メチルアリル-
Y.526	Cl	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.527	Cl	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.528	Cl	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.529	Cl	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.530	Cl	0	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.531	Cl	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.532	Cl	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.533	Cl	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.534	Cl	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.535	Cl	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.536	Cl	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.537	Cl	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.538	Cl	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.539	Cl	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.540	Cl	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.541	Cl	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.542	Cl	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.543	Cl	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.544	Cl	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.545	Cl	0	2-ブロモアリル-

10

20

30

40

【表 1 2】

Y.546	Cl	0	2-ブロモフェニル-
Y.547	Cl	0	2-ブテニル-
Y.548	Cl	0	2-クロロアリル-
Y.549	Cl	0	2-クロロフェニル-
Y.550	Cl	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.551	Cl	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.552	Cl	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.553	Cl	0	2-シアノエチル-
Y.554	Cl	0	2-エチルフェニル-
Y.555	Cl	0	2-フルオロエチル-
Y.556	Cl	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.557	Cl	0	2-フルオロプロピル-
Y.558	Cl	0	2-フリルメチル-
Y.559	Cl	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.560	Cl	0	2-メトキシ-エチル-
Y.561	Cl	0	2-メトキシフェニル-
Y.562	Cl	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.563	Cl	0	2-メチルアリル-
Y.564	Cl	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.565	Cl	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.566	Cl	0	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.567	Cl	0	2-メチルフェニル-
Y.568	Cl	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.569	Cl	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.570	Cl	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.571	Cl	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.572	Cl	0	2-ニトロフェニル-
Y.573	Cl	0	2-プロピル-
Y.574	Cl	0	2-ピリジル-
Y.575	Cl	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.576	Cl	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.577	Cl	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.578	Cl	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.579	Cl	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.580	Cl	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.581	Cl	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.582	Cl	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.583	Cl	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.584	Cl	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.585	Cl	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.586	Cl	0	3-プロモアリル-
Y.587	Cl	0	3-ブロモフェニル-
Y.588	Cl	0	3-ブテニル-
Y.589	Cl	0	3-クロロアリル-
Y.590	Cl	0	3-クロロフェニル-
Y.591	Cl	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.592	Cl	0	3-シアノプロピル-
Y.593	Cl	0	3-エチルフェニル-
Y.594	Cl	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.595	Cl	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.596	Cl	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.597	Cl	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.598	Cl	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.599	Cl	0	3-メチルフェニル-

【 0 0 8 3 】

10

20

30

40

【表 1 3】

Y.600	Cl	0	3-ニトロフェニル-
Y.601	Cl	0	3-ピリジル-
Y.602	Cl	0	4-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.603	Cl	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.604	Cl	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.605	Cl	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.606	Cl	0	4-プロモフェニル-
Y.607	Cl	0	4-クロロフェニル-
Y.608	Cl	0	4-エチルフェニル-
Y.609	Cl	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.610	Cl	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.611	Cl	0	4-メチルフェニル-
Y.612	Cl	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.613	Cl	0	4-メチルフェニル-
Y.614	Cl	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.615	Cl	0	4-ニトロフェニル-
Y.616	Cl	0	4-ピリジル-
Y.617	Cl	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.618	Cl	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.619	Cl	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.620	Cl	0	アリル-
Y.621	Cl	0	ブタ-2-イル-
Y.622	Cl	0	ブタ-3-イル-
Y.623	Cl	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.624	Cl	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.625	Cl	0	シアノジメチルメチル-
Y.626	Cl	0	シアノエチル-
Y.627	Cl	0	シアノメチル-
Y.628	Cl	0	シクロベンチル-
Y.629	Cl	0	シクロプロピル-メチル-
Y.630	Cl	0	メチルプロパルギル-
Y.631	Cl	0	オキセタン-3-イル-
Y.632	Cl	0	ペンタ-3-イル-
Y.633	Cl	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.634	Cl	0	プロパルギル-
Y.635	Cl	0	tert-ブチル-
Y.636	Cl	0	テトラゾリル-
Y.637	Cl	0	チアゾール-2-イル-
Y.638	Cl	0	チアゾール-4-イル-
Y.639	Cl	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.640	Cl	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.641	Cl	0	エチル-
Y.642	Cl	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.643	Cl	0	ブタ-2-イル-
Y.644	Cl	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.645	Cl	0	ベンジル-
Y.646	Cl	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.647	Cl	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.648	Cl	0	(4-メチル-フェニル)-メチル-
Y.649	Cl	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.650	Cl	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.651	Cl	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.652	Cl	0	n-ブチル-
Y.653	Cl	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-

10

20

30

40

【表 1 4】

Y.654	Cl	0	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
Y.655	Cl	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.656	Cl	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.657	Cl	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.658	Cl	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.659	Cl	0	チエタン-3-イル-
Y.660	Cl	0	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.661	Cl	0	シクロブチル-
Y.662	Cl	0	メチル-
Y.663	Cl	0	シクロプロピル-
Y.664	Cl	0	n-プロピル-
Y.665	Cl	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.666	Cl	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.667	Cl	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.668	Cl	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.669	Cl	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.670	Cl	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.671	Cl	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.672	Cl	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.673	Cl	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.674	Cl	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.675	Cl	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.676	Cl	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.677	Cl	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.678	Cl	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.679	Cl	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.680	Cl	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.681	Cl	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.682	Cl	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.683	Cl	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.684	Cl	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.685	Cl	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.686	Cl	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.687	Cl	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.688	Cl	1	1-シアノシクロブチル-
Y.689	Cl	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.690	Cl	1	1-シアノシクロプロピル-
Y.691	Cl	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.692	Cl	1	1-メチルアリル-
Y.693	Cl	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.694	Cl	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.695	Cl	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.696	Cl	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.697	Cl	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.698	Cl	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.699	Cl	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.700	Cl	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.701	Cl	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.702	Cl	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.703	Cl	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.704	Cl	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.705	Cl	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.706	Cl	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.707	Cl	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-

【 0 0 8 5 】

【表 1 5】

Y.708	Cl	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.709	Cl	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.710	Cl	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.711	Cl	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.712	Cl	1	2-ブロモアリル-
Y.713	Cl	1	2-ブロモフェニル-
Y.714	Cl	1	2-ブテニル-
Y.715	Cl	1	2-クロロアリル-
Y.716	Cl	1	2-クロロフェニル-
Y.717	Cl	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.718	Cl	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.719	Cl	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.720	Cl	1	2-シアノエチル-
Y.721	Cl	1	2-エチルフェニル-
Y.722	Cl	1	2-フルオロエチル-
Y.723	Cl	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.724	Cl	1	2-フルオロプロピル-
Y.725	Cl	1	2-フリルメチル-
Y.726	Cl	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.727	Cl	1	2-メトキシ-エチル-
Y.728	Cl	1	2-メトキシフェニル-
Y.729	Cl	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.730	Cl	1	2-メチルアリル-
Y.731	Cl	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.732	Cl	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.733	Cl	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.734	Cl	1	2-メチルフェニル-
Y.735	Cl	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.736	Cl	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.737	Cl	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.738	Cl	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.739	Cl	1	2-ニトロフェニル-
Y.740	Cl	1	2-プロピル-
Y.741	Cl	1	2-ピリジル-
Y.742	Cl	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.743	Cl	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.744	Cl	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.745	Cl	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.746	Cl	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.747	Cl	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.748	Cl	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.749	Cl	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.750	Cl	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.751	Cl	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.752	Cl	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.753	Cl	1	3-プロモアリル-
Y.754	Cl	1	3-プロモフェニル-
Y.755	Cl	1	3-ブテニル-
Y.756	Cl	1	3-クロロアリル-
Y.757	Cl	1	3-クロロフェニル-
Y.758	Cl	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.759	Cl	1	3-シアノプロピル-
Y.760	Cl	1	3-エチルフェニル-
Y.761	Cl	1	3-ヒドロキシフェニル-

【表 1 6】

Y.762	Cl	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.763	Cl	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.764	Cl	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.765	Cl	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.766	Cl	1	3-メチルフェニル-
Y.767	Cl	1	3-ニトロフェニル-
Y.768	Cl	1	3-ピリジル-
Y.769	Cl	1	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.770	Cl	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.771	Cl	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.772	Cl	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.773	Cl	1	4-ブロモフェニル-
Y.774	Cl	1	4-クロロフェニル-
Y.775	Cl	1	4-エチルフェニル-
Y.776	Cl	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.777	Cl	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.778	Cl	1	4-メトキシフェニル-
Y.779	Cl	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.780	Cl	1	4-メチルフェニル-
Y.781	Cl	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.782	Cl	1	4-ニトロフェニル-
Y.783	Cl	1	4-ピリジル-
Y.784	Cl	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.785	Cl	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.786	Cl	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.787	Cl	1	アリル-
Y.788	Cl	1	ブタ-2-イニル-
Y.789	Cl	1	ブタ-3-イニル-
Y.790	Cl	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.791	Cl	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.792	Cl	1	シアノジメチルメチル-
Y.793	Cl	1	シアノエチル-
Y.794	Cl	1	シアノメチル-
Y.795	Cl	1	シクロベンチル-
Y.796	Cl	1	シクロプロピル-メチル-
Y.797	Cl	1	メチルプロパルギル-
Y.798	Cl	1	オキセタン-3-イル-
Y.799	Cl	1	ペンタ-3-イル-
Y.800	Cl	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.801	Cl	1	プロパルギル-
Y.802	Cl	1	tert-ブチル-
Y.803	Cl	1	テトラゾリル-
Y.804	Cl	1	チアゾール-2-イル-
Y.805	Cl	1	チアゾール-4-イル-
Y.806	Cl	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.807	Cl	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.808	Cl	1	エチル-
Y.809	Cl	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.810	Cl	1	ブタ-2-イル-
Y.811	Cl	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.812	Cl	1	ベンジル-
Y.813	Cl	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.814	Cl	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.815	Cl	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-

【 0 0 8 7 】

【表 17】

Y.816	Cl	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.817	Cl	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.818	Cl	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.819	Cl	1	n-ブチル-
Y.820	Cl	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.821	Cl	1	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
Y.822	Cl	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.823	Cl	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.824	Cl	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.825	Cl	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.826	Cl	1	チエタン-3-イル-
Y.827	Cl	1	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.828	Cl	1	シクロブチル-
Y.829	Cl	1	メチル-
Y.830	Cl	1	シクロプロピル-
Y.831	Cl	1	n-プロピル-
Y.832	Cl	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.833	Cl	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.834	Cl	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.835	Cl	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.836	Cl	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.837	Cl	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.838	Cl	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.839	Cl	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.840	Cl	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.841	Cl	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.842	Cl	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.843	Cl	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.844	Cl	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.845	Cl	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.846	Cl	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.847	Cl	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.848	Cl	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.849	Cl	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.850	Cl	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.851	Cl	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.852	Cl	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.853	Cl	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.854	Cl	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.855	Cl	2	1-シアノシクロブチル-
Y.856	Cl	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.857	Cl	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.858	Cl	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.859	Cl	2	1-メチルアリル-
Y.860	Cl	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.861	Cl	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.862	Cl	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.863	Cl	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.864	Cl	2	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.865	Cl	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.866	Cl	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.867	Cl	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.868	Cl	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.869	Cl	2	2,3-ジフルオロ-フェニル-

【表 18】

Y.870	Cl	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.871	Cl	2	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.872	Cl	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.873	Cl	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.874	Cl	2	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.875	Cl	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.876	Cl	2	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.877	Cl	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.878	Cl	2	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.879	Cl	2	2-ブロモアリル-
Y.880	Cl	2	2-ブロモフェニル-
Y.881	Cl	2	2-ブテニル-
Y.882	Cl	2	2-クロロアリル-
Y.883	Cl	2	2-クロロフェニル-
Y.884	Cl	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.885	Cl	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.886	Cl	2	2-シアノクロプロピル-
Y.887	Cl	2	2-シアノエチル-
Y.888	Cl	2	2-エチルフェニル-
Y.889	Cl	2	2-フルオロエチル-
Y.890	Cl	2	2-フルオロ-フェニル-
Y.891	Cl	2	2-フルオロプロピル-
Y.892	Cl	2	2-フリルメチル-
Y.893	Cl	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.894	Cl	2	2-メキシ-エチル-
Y.895	Cl	2	2-メキシフェニル-
Y.896	Cl	2	2-メキシ-プロパ-3-イル-
Y.897	Cl	2	2-メチルアリル-
Y.898	Cl	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.899	Cl	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.900	Cl	2	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.901	Cl	2	2-メチルフェニル-
Y.902	Cl	2	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.903	Cl	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.904	Cl	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.905	Cl	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.906	Cl	2	2-ニトロフェニル-
Y.907	Cl	2	2-プロピル-
Y.908	Cl	2	2-ピリジル-
Y.909	Cl	2	2-トリフルオロメキシ-エチル-
Y.910	Cl	2	3-(トリフルオロメキシ)フェニル-
Y.911	Cl	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.912	Cl	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.913	Cl	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.914	Cl	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.915	Cl	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.916	Cl	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.917	Cl	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.918	Cl	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.919	Cl	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.920	Cl	2	3-プロモアリル-
Y.921	Cl	2	3-プロモフェニル-
Y.922	Cl	2	3-ブテニル-
Y.923	Cl	2	3-クロロアリル-

10

20

30

40

【表 19】

Y.924	Cl	2	3-クロロフェニル-
Y.925	Cl	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.926	Cl	2	3-シアノプロピル-
Y.927	Cl	2	3-エチルフェニル-
Y.928	Cl	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.929	Cl	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.930	Cl	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.931	Cl	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.932	Cl	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.933	Cl	2	3-メチルフェニル-
Y.934	Cl	2	3-ニトロフェニル-
Y.935	Cl	2	3-ピリジル-
Y.936	Cl	2	4-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.937	Cl	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.938	Cl	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.939	Cl	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.940	Cl	2	4-ブロモフェニル-
Y.941	Cl	2	4-クロロフェニル-
Y.942	Cl	2	4-エチルフェニル-
Y.943	Cl	2	4-フルオロフェニル-
Y.944	Cl	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.945	Cl	2	4-メチルフェニル-
Y.946	Cl	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.947	Cl	2	4-メチルフェニル-
Y.948	Cl	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.949	Cl	2	4-ニトロフェニル-
Y.950	Cl	2	4-ピリジル-
Y.951	Cl	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.952	Cl	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.953	Cl	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.954	Cl	2	アリル-
Y.955	Cl	2	ブタ-2-イル-
Y.956	Cl	2	ブタ-3-イル-
Y.957	Cl	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.958	Cl	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.959	Cl	2	シアノジメチルメチル-
Y.960	Cl	2	シアノエチル-
Y.961	Cl	2	シアノメチル-
Y.962	Cl	2	シクロペンチル-
Y.963	Cl	2	シクロプロピル-メチル-
Y.964	Cl	2	メチルプロパルギル-
Y.965	Cl	2	オキセタン-3-イル-
Y.966	Cl	2	ペンタ-3-イル-
Y.967	Cl	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.968	Cl	2	プロパルギル-
Y.969	Cl	2	tert-ブチル-
Y.970	Cl	2	テトラゾリル-
Y.971	Cl	2	チアゾール-2-イル-
Y.972	Cl	2	チアゾール-4-イル-
Y.973	Cl	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.974	Cl	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.975	Cl	2	エチル-
Y.976	Cl	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.977	Cl	2	ブタ-2-イル-

10

20

30

40

【表 20】

Y.978	Cl	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.979	Cl	2	ベンジル-
Y.980	Cl	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.981	Cl	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.982	Cl	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.983	Cl	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.984	Cl	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.985	Cl	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.986	Cl	2	n-ブチル-
Y.987	Cl	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.988	Cl	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.989	Cl	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.990	Cl	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.991	Cl	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.992	Cl	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.993	Cl	2	チエタン-3-イル-
Y.994	Cl	2	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.995	Cl	2	シクロブチル-
Y.996	Cl	2	メチル-
Y.997	Cl	2	シクロプロピル-
Y.998	Cl	2	n-プロピル-
Y.999	Cl	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1000	Cl	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1001	Cl	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1002	Cl	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1003	Br	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1004	Br	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1005	Br	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1006	Br	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1007	Br	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1008	Br	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1009	Br	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1010	Br	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1011	Br	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1012	Br	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1013	Br	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1014	Br	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1015	Br	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1016	Br	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.1017	Br	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1018	Br	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1019	Br	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1020	Br	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1021	Br	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1022	Br	0	1-シアノシクロブチル-
Y.1023	Br	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.1024	Br	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.1025	Br	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1026	Br	0	1-メチルアリル-
Y.1027	Br	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1028	Br	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1029	Br	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1030	Br	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1031	Br	0	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-

【表 2 1】

Y.1032	Br	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1033	Br	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1034	Br	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1035	Br	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1036	Br	0	2,3-ジフルオロフェニル-
Y.1037	Br	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1038	Br	0	2,4-ジフルオロフェニル-
Y.1039	Br	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1040	Br	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1041	Br	0	2,5-ジフルオロフェニル-
Y.1042	Br	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1043	Br	0	2,6-ジフルオロフェニル-
Y.1044	Br	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1045	Br	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.1046	Br	0	2-ブロモアリル-
Y.1047	Br	0	2-ブロモフェニル-
Y.1048	Br	0	2-ブテニル-
Y.1049	Br	0	2-クロロアリル-
Y.1050	Br	0	2-クロロフェニル-
Y.1051	Br	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1052	Br	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1053	Br	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.1054	Br	0	2-シアノエチル-
Y.1055	Br	0	2-エチルフェニル-
Y.1056	Br	0	2-フルオロエチル-
Y.1057	Br	0	2-フルオロフェニル-
Y.1058	Br	0	2-フルオロプロピル-
Y.1059	Br	0	2-フリルメチル-
Y.1060	Br	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.1061	Br	0	2-メトキシ-エチル-
Y.1062	Br	0	2-メトキシフェニル-
Y.1063	Br	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.1064	Br	0	2-メチルアリル-
Y.1065	Br	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1066	Br	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1067	Br	0	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.1068	Br	0	2-メチルフェニル-
Y.1069	Br	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.1070	Br	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.1071	Br	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.1072	Br	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.1073	Br	0	2-ニトロフェニル-
Y.1074	Br	0	2-プロピル-
Y.1075	Br	0	2-ピリジル-
Y.1076	Br	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.1077	Br	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1078	Br	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1079	Br	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1080	Br	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.1081	Br	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.1082	Br	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1083	Br	0	3,4-ジフルオロフェニル-
Y.1084	Br	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1085	Br	0	3,5-ジフルオロフェニル-

【表 2 2】

Y.1086	Br	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1087	Br	0	3-ブロモアリル-
Y.1088	Br	0	3-ブロモフェニル-
Y.1089	Br	0	3-ブテニル-
Y.1090	Br	0	3-クロロアリル-
Y.1091	Br	0	3-クロロフェニル-
Y.1092	Br	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1093	Br	0	3-シアノプロピル-
Y.1094	Br	0	3-エチルフェニル-
Y.1095	Br	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1096	Br	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1097	Br	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1098	Br	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1099	Br	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1100	Br	0	3-メチルフェニル-
Y.1101	Br	0	3-ニトロフェニル-
Y.1102	Br	0	3-ピリジル-
Y.1103	Br	0	4-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.1104	Br	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1105	Br	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1106	Br	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1107	Br	0	4-ブロモフェニル-
Y.1108	Br	0	4-クロロフェニル-
Y.1109	Br	0	4-エチルフェニル-
Y.1110	Br	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.1111	Br	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1112	Br	0	4-メチルフェニル-
Y.1113	Br	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1114	Br	0	4-メチルフェニル-
Y.1115	Br	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1116	Br	0	4-ニトロフェニル-
Y.1117	Br	0	4-ピリジル-
Y.1118	Br	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1119	Br	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1120	Br	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1121	Br	0	アリル-
Y.1122	Br	0	ブタ-2-イル-
Y.1123	Br	0	ブタ-3-イル-
Y.1124	Br	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1125	Br	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1126	Br	0	シアノジメチルメチル-
Y.1127	Br	0	シアノエチル-
Y.1128	Br	0	シアノメチル-
Y.1129	Br	0	シクロベンチル-
Y.1130	Br	0	シクロプロピル-メチル-
Y.1131	Br	0	メチルプロパルギル-
Y.1132	Br	0	オキセタン-3-イル-
Y.1133	Br	0	ベンタ-3-イル-
Y.1134	Br	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.1135	Br	0	プロパルギル-
Y.1136	Br	0	tert-ブチル-
Y.1137	Br	0	テトラリル-
Y.1138	Br	0	チアゾール-2-イル-
Y.1139	Br	0	チアゾール-4-イル-

【表 2 3】

Y.1140	Br	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.1141	Br	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.1142	Br	0	エチル-
Y.1143	Br	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1144	Br	0	ブタ-2-イル-
Y.1145	Br	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1146	Br	0	ベンジル-
Y.1147	Br	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1148	Br	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1149	Br	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1150	Br	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1151	Br	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1152	Br	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.1153	Br	0	n-ブチル-
Y.1154	Br	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1155	Br	0	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
Y.1156	Br	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1157	Br	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1158	Br	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1159	Br	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1160	Br	0	チエタン-3-イル-
Y.1161	Br	0	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1162	Br	0	シクロブチル-
Y.1163	Br	0	メチル-
Y.1164	Br	0	シクロプロピル-
Y.1165	Br	0	n-プロピル-
Y.1166	Br	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1167	Br	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1168	Br	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1169	Br	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1170	Br	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1171	Br	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1172	Br	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1173	Br	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1174	Br	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1175	Br	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1176	Br	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1177	Br	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1178	Br	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1179	Br	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1180	Br	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1181	Br	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1182	Br	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1183	Br	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.1184	Br	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1185	Br	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1186	Br	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1187	Br	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1188	Br	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1189	Br	1	1-シアノシクロブチル-
Y.1190	Br	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.1191	Br	1	1-シアノシクロプロピル-
Y.1192	Br	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1193	Br	1	1-メチルアリル-

【表 2 4】

Y.1194	Br	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1195	Br	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1196	Br	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1197	Br	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1198	Br	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1199	Br	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1200	Br	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1201	Br	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1202	Br	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1203	Br	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.1204	Br	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1205	Br	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1206	Br	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1207	Br	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1208	Br	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1209	Br	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1210	Br	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1211	Br	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1212	Br	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.1213	Br	1	2-ブロモアリル-
Y.1214	Br	1	2-ブロモフェニル-
Y.1215	Br	1	2-ブテニル-
Y.1216	Br	1	2-クロロアリル-
Y.1217	Br	1	2-クロロフェニル-
Y.1218	Br	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1219	Br	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1220	Br	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.1221	Br	1	2-シアノエチル-
Y.1222	Br	1	2-エチルフェニル-
Y.1223	Br	1	2-フルオロエチル-
Y.1224	Br	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.1225	Br	1	2-フルオロプロピル-
Y.1226	Br	1	2-フリルメチル-
Y.1227	Br	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.1228	Br	1	2-メトキシ-エチル-
Y.1229	Br	1	2-メトキシフェニル-
Y.1230	Br	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.1231	Br	1	2-メチルアリル-
Y.1232	Br	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1233	Br	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1234	Br	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.1235	Br	1	2-メチルフェニル-
Y.1236	Br	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.1237	Br	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.1238	Br	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.1239	Br	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.1240	Br	1	2-ニトロフェニル-
Y.1241	Br	1	2-プロピル-
Y.1242	Br	1	2-ピリジル-
Y.1243	Br	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.1244	Br	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1245	Br	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1246	Br	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1247	Br	1	3,3-ジプロモアリル-

【表 2 5】

Y.1248	Br	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.1249	Br	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1250	Br	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1251	Br	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1252	Br	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1253	Br	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1254	Br	1	3-ブロモアリル-
Y.1255	Br	1	3-ブロモフェニル-
Y.1256	Br	1	3-ブテニル-
Y.1257	Br	1	3-クロロアリル-
Y.1258	Br	1	3-クロロフェニル-
Y.1259	Br	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1260	Br	1	3-シアノプロピル-
Y.1261	Br	1	3-エチルフェニル-
Y.1262	Br	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1263	Br	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1264	Br	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1265	Br	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1266	Br	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1267	Br	1	3-メチルフェニル-
Y.1268	Br	1	3-ニトロフェニル-
Y.1269	Br	1	3-ピリジル-
Y.1270	Br	1	4-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.1271	Br	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1272	Br	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1273	Br	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1274	Br	1	4-ブロモフェニル-
Y.1275	Br	1	4-クロロフェニル-
Y.1276	Br	1	4-エチルフェニル-
Y.1277	Br	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.1278	Br	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1279	Br	1	4-メチルフェニル-
Y.1280	Br	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1281	Br	1	4-メチルフェニル-
Y.1282	Br	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1283	Br	1	4-ニトロフェニル-
Y.1284	Br	1	4-ピリジル-
Y.1285	Br	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1286	Br	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1287	Br	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1288	Br	1	アリル-
Y.1289	Br	1	ブタ-2-イル-
Y.1290	Br	1	ブタ-3-イル-
Y.1291	Br	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1292	Br	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1293	Br	1	シアノジメチルメチル-
Y.1294	Br	1	シアノエチル-
Y.1295	Br	1	シアノメチル-
Y.1296	Br	1	シクロペンチル-
Y.1297	Br	1	シクロプロピル-メチル-
Y.1298	Br	1	メチルプロパルギル-
Y.1299	Br	1	オキセタン-3-イル-
Y.1300	Br	1	ペンタ-3-イル-
Y.1301	Br	1	フェニル-メチル-メチル-

【表 2 6】

Y.1302	Br	1	プロパルギル-
Y.1303	Br	1	tert-ブチル-
Y.1304	Br	1	テトラソリル-
Y.1305	Br	1	チアゾール-2-イル-
Y.1306	Br	1	チアゾール-4-イル-
Y.1307	Br	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.1308	Br	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.1309	Br	1	エチル-
Y.1310	Br	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1311	Br	1	ブタ-2-イル-
Y.1312	Br	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1313	Br	1	ベンジル-
Y.1314	Br	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1315	Br	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1316	Br	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1317	Br	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1318	Br	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1319	Br	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.1320	Br	1	n-ブチル-
Y.1321	Br	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1322	Br	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.1323	Br	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1324	Br	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1325	Br	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1326	Br	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1327	Br	1	チエタン-3-イル-
Y.1328	Br	1	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1329	Br	1	シクロブチル-
Y.1330	Br	1	メチル-
Y.1331	Br	1	シクロプロピル-
Y.1332	Br	1	n-プロピル-
Y.1333	Br	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1334	Br	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1335	Br	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1336	Br	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1337	Br	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1338	Br	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1339	Br	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1340	Br	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1341	Br	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1342	Br	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1343	Br	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1344	Br	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1345	Br	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1346	Br	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1347	Br	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1348	Br	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1349	Br	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1350	Br	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.1351	Br	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1352	Br	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1353	Br	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1354	Br	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1355	Br	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-

10

20

30

40

【表 27】

Y.1356	Br	2	1-シアノシクロブチル-
Y.1357	Br	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.1358	Br	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.1359	Br	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1360	Br	2	1-メチルアリル-
Y.1361	Br	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1362	Br	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1363	Br	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1364	Br	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1365	Br	2	2-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.1366	Br	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソチエタン-3-イル-
Y.1367	Br	2	2,2-ジメチル-1-オキソチエタン-3-イル-
Y.1368	Br	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1369	Br	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1370	Br	2	2,3-ジフルオロフェニル-
Y.1371	Br	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1372	Br	2	2,4-ジフルオロフェニル-
Y.1373	Br	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1374	Br	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1375	Br	2	2,5-ジフルオロフェニル-
Y.1376	Br	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1377	Br	2	2,6-ジフルオロフェニル-
Y.1378	Br	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1379	Br	2	2-ブromo-4-フルオロフェニル-
Y.1380	Br	2	2-ブromoアリル-
Y.1381	Br	2	2-ブromoフェニル-
Y.1382	Br	2	2-ブテンニル-
Y.1383	Br	2	2-クロロアリル-
Y.1384	Br	2	2-クロロフェニル-
Y.1385	Br	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1386	Br	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1387	Br	2	2-シアノシクロプロピル-
Y.1388	Br	2	2-シアノエチル-
Y.1389	Br	2	2-エチルフェニル-
Y.1390	Br	2	2-フルオロエチル-
Y.1391	Br	2	2-フルオロフェニル-
Y.1392	Br	2	2-フルオロプロピル-
Y.1393	Br	2	2-フリルメチル-
Y.1394	Br	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.1395	Br	2	2-メトキシエチル-
Y.1396	Br	2	2-メトキシフェニル-
Y.1397	Br	2	2-メトキシプロパ-3-イル-
Y.1398	Br	2	2-メチルアリル-
Y.1399	Br	2	2-メチルブタ-1-イル-
Y.1400	Br	2	2-メチルブタ-2-イル-
Y.1401	Br	2	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.1402	Br	2	2-メチルフェニル-
Y.1403	Br	2	2-メチルプロパ-1-イル-
Y.1404	Br	2	2-メチルスルファニルエチル-
Y.1405	Br	2	2-メチルスルファニルプロパ-3-イル-
Y.1406	Br	2	2-メチルチアゾール-4-イル-
Y.1407	Br	2	2-ニトロフェニル-
Y.1408	Br	2	2-プロピル-
Y.1409	Br	2	2-ピリジル-

【表 28】

Y.1410	Br	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.1411	Br	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1412	Br	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1413	Br	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1414	Br	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.1415	Br	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.1416	Br	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1417	Br	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1418	Br	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1419	Br	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1420	Br	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1421	Br	2	3-プロモアリル-
Y.1422	Br	2	3-プロモフェニル-
Y.1423	Br	2	3-ブテニル-
Y.1424	Br	2	3-クロロアリル-
Y.1425	Br	2	3-クロロフェニル-
Y.1426	Br	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1427	Br	2	3-シアノプロピル-
Y.1428	Br	2	3-エチルフェニル-
Y.1429	Br	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1430	Br	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1431	Br	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1432	Br	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1433	Br	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1434	Br	2	3-メチルフェニル-
Y.1435	Br	2	3-ニトロフェニル-
Y.1436	Br	2	3-ピリジル-
Y.1437	Br	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1438	Br	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1439	Br	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1440	Br	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1441	Br	2	4-プロモフェニル-
Y.1442	Br	2	4-クロロフェニル-
Y.1443	Br	2	4-エチルフェニル-
Y.1444	Br	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.1445	Br	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1446	Br	2	4-メトキシフェニル-
Y.1447	Br	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1448	Br	2	4-メチルフェニル-
Y.1449	Br	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1450	Br	2	4-ニトロフェニル-
Y.1451	Br	2	4-ピリジル-
Y.1452	Br	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1453	Br	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1454	Br	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1455	Br	2	アリル-
Y.1456	Br	2	ブタ-2-イニル-
Y.1457	Br	2	ブタ-3-イニル-
Y.1458	Br	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1459	Br	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1460	Br	2	シアノジメチルメチル-
Y.1461	Br	2	シアノエチル-
Y.1462	Br	2	シアノメチル-
Y.1463	Br	2	シクロベンチル-

【表 29】

Y.1464	Br	2	シクロプロピル-メチル-
Y.1465	Br	2	メチルプロパルギル-
Y.1466	Br	2	オキセタン-3-イル-
Y.1467	Br	2	ペンタ-3-イル-
Y.1468	Br	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.1469	Br	2	プロパルギル-
Y.1470	Br	2	tert-ブチル-
Y.1471	Br	2	テトラゾリル-
Y.1472	Br	2	チアゾール-2-イル-
Y.1473	Br	2	チアゾール-4-イル-
Y.1474	Br	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.1475	Br	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.1476	Br	2	エチル-
Y.1477	Br	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1478	Br	2	ブタ-2-イル-
Y.1479	Br	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1480	Br	2	ベンジル-
Y.1481	Br	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1482	Br	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1483	Br	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1484	Br	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1485	Br	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1486	Br	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.1487	Br	2	n-ブチル-
Y.1488	Br	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1489	Br	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.1490	Br	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1491	Br	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1492	Br	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1493	Br	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1494	Br	2	チエタン-3-イル-
Y.1495	Br	2	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1496	Br	2	シクロブチル-
Y.1497	Br	2	メチル-
Y.1498	Br	2	シクロプロピル-
Y.1499	Br	2	n-プロピル-
Y.1500	Br	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1501	Br	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1502	Br	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1503	Br	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1504	メチル	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1505	メチル	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1506	メチル	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1507	メチル	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1508	メチル	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1509	メチル	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1510	メチル	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1511	メチル	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1512	メチル	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1513	メチル	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1514	メチル	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1515	メチル	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1516	メチル	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1517	メチル	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-

【0100】

10

20

30

40

【表 30】

Y.1518	メチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1519	メチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1520	メチル	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1521	メチル	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1522	メチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1523	メチル	0	1-シアノシクロブチル-
Y.1524	メチル	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.1525	メチル	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.1526	メチル	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1527	メチル	0	1-メチルアリル-
Y.1528	メチル	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1529	メチル	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1530	メチル	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1531	メチル	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1532	メチル	0	2-(トリフルオロメチキ)フェニル-
Y.1533	メチル	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1534	メチル	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1535	メチル	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1536	メチル	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1537	メチル	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.1538	メチル	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1539	メチル	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1540	メチル	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1541	メチル	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1542	メチル	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1543	メチル	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1544	メチル	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1545	メチル	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1546	メチル	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.1547	メチル	0	2-ブロモアリル-
Y.1548	メチル	0	2-ブロモフェニル-
Y.1549	メチル	0	2-ブテニル-
Y.1550	メチル	0	2-クロロアリル-
Y.1551	メチル	0	2-クロロフェニル-
Y.1552	メチル	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1553	メチル	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1554	メチル	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.1555	メチル	0	2-シアノエチル-
Y.1556	メチル	0	2-エチルフェニル-
Y.1557	メチル	0	2-フルオロエチル-
Y.1558	メチル	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.1559	メチル	0	2-フルオロプロピル-
Y.1560	メチル	0	2-フリルメチル-
Y.1561	メチル	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.1562	メチル	0	2-メトキシ-エチル-
Y.1563	メチル	0	2-メトキシフェニル-
Y.1564	メチル	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.1565	メチル	0	2-メチルアリル-
Y.1566	メチル	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1567	メチル	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1568	メチル	0	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.1569	メチル	0	2-メチルフェニル-
Y.1570	メチル	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.1571	メチル	0	2-メチルスルファニル-エチル-

10

20

30

40

【0101】

【表 3 1】

Y.1572	メチル	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.1573	メチル	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.1574	メチル	0	2-ニトロフェニル-
Y.1575	メチル	0	2-プロピル-
Y.1576	メチル	0	2-ピリジル-
Y.1577	メチル	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.1578	メチル	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1579	メチル	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1580	メチル	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1581	メチル	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.1582	メチル	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.1583	メチル	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1584	メチル	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1585	メチル	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1586	メチル	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1587	メチル	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1588	メチル	0	3-プロモアリル-
Y.1589	メチル	0	3-プロモフェニル-
Y.1590	メチル	0	3-ブテニル-
Y.1591	メチル	0	3-クロロアリル-
Y.1592	メチル	0	3-クロロフェニル-
Y.1593	メチル	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1594	メチル	0	3-シアノプロピル-
Y.1595	メチル	0	3-エチルフェニル-
Y.1596	メチル	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1597	メチル	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1598	メチル	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1599	メチル	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1600	メチル	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1601	メチル	0	3-メチルフェニル-
Y.1602	メチル	0	3-ニトロフェニル-
Y.1603	メチル	0	3-ピリジル-
Y.1604	メチル	0	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1605	メチル	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1606	メチル	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1607	メチル	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1608	メチル	0	4-プロモフェニル-
Y.1609	メチル	0	4-クロロフェニル-
Y.1610	メチル	0	4-エチルフェニル-
Y.1611	メチル	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.1612	メチル	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1613	メチル	0	4-メトキシフェニル-
Y.1614	メチル	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1615	メチル	0	4-メチルフェニル-
Y.1616	メチル	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1617	メチル	0	4-ニトロフェニル-
Y.1618	メチル	0	4-ピリジル-
Y.1619	メチル	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1620	メチル	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1621	メチル	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1622	メチル	0	アリル-
Y.1623	メチル	0	ブタ-2-イニル-
Y.1624	メチル	0	ブタ-3-イニル-
Y.1625	メチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-

10

20

30

40

【0 1 0 2】

【表 3 2】

Y.1626	メチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1627	メチル	0	シアノジメチルメチル-
Y.1628	メチル	0	シアノエチル-
Y.1629	メチル	0	シアノメチル-
Y.1630	メチル	0	シクロベンチル-
Y.1631	メチル	0	シクロプロピル-メチル-
Y.1632	メチル	0	メチルプロパルギル-
Y.1633	メチル	0	オキセタン-3-イル-
Y.1634	メチル	0	ペンタ-3-イル-
Y.1635	メチル	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.1636	メチル	0	プロパルギル-
Y.1637	メチル	0	tert-ブチル-
Y.1638	メチル	0	テトラノリル-
Y.1639	メチル	0	チアゾール-2-イル-
Y.1640	メチル	0	チアゾール-4-イル-
Y.1641	メチル	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.1642	メチル	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.1643	メチル	0	エチル-
Y.1644	メチル	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1645	メチル	0	ブタ-2-イル-
Y.1646	メチル	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1647	メチル	0	ベンジル-
Y.1648	メチル	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1649	メチル	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1650	メチル	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1651	メチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1652	メチル	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1653	メチル	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.1654	メチル	0	n-ブチル-
Y.1655	メチル	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1656	メチル	0	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.1657	メチル	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1658	メチル	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1659	メチル	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1660	メチル	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1661	メチル	0	チエタン-3-イル-
Y.1662	メチル	0	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1663	メチル	0	シクロブチル-
Y.1664	メチル	0	メチル-
Y.1665	メチル	0	シクロプロピル-
Y.1666	メチル	0	n-プロピル-
Y.1667	メチル	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1668	メチル	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1669	メチル	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1670	メチル	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1671	メチル	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1672	メチル	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1673	メチル	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1674	メチル	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1675	メチル	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1676	メチル	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1677	メチル	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1678	メチル	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1679	メチル	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-

【0103】

10

20

30

40

【表 3 3】

Y.1680	メチル	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1681	メチル	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1682	メチル	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1683	メチル	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1684	メチル	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.1685	メチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1686	メチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1687	メチル	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1688	メチル	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1689	メチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1690	メチル	1	1-シアノシクロブチル-
Y.1691	メチル	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.1692	メチル	1	1-シアノシクロヘキシル-
Y.1693	メチル	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1694	メチル	1	1-メチルアリル-
Y.1695	メチル	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1696	メチル	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1697	メチル	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1698	メチル	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1699	メチル	1	2-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.1700	メチル	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1701	メチル	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1702	メチル	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1703	メチル	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1704	メチル	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.1705	メチル	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1706	メチル	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1707	メチル	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1708	メチル	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1709	メチル	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1710	メチル	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1711	メチル	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1712	メチル	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1713	メチル	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.1714	メチル	1	2-ブロモアリル-
Y.1715	メチル	1	2-ブロモフェニル-
Y.1716	メチル	1	2-ブテニル-
Y.1717	メチル	1	2-クロロアリル-
Y.1718	メチル	1	2-クロロフェニル-
Y.1719	メチル	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1720	メチル	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1721	メチル	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.1722	メチル	1	2-シアノエチル-
Y.1723	メチル	1	2-エチルフェニル-
Y.1724	メチル	1	2-フルオロエチル-
Y.1725	メチル	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.1726	メチル	1	2-フルオロプロピル-
Y.1727	メチル	1	2-フリルメチル-
Y.1728	メチル	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.1729	メチル	1	2-メトキシ-エチル-
Y.1730	メチル	1	2-メトキシフェニル-
Y.1731	メチル	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.1732	メチル	1	2-メチルアリル-
Y.1733	メチル	1	2-メチル-ブタ-1-イル-

【 0 1 0 4 】

【表 3 4】

Y.1734	メチル	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1735	メチル	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.1736	メチル	1	2-メチルフェニル-
Y.1737	メチル	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.1738	メチル	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.1739	メチル	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.1740	メチル	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.1741	メチル	1	2-ニトロフェニル-
Y.1742	メチル	1	2-プロピル-
Y.1743	メチル	1	2-ピリジル-
Y.1744	メチル	1	2-トリフルオロメチキシル-エチル-
Y.1745	メチル	1	3-(トリフルオロメチキシル)フェニル-
Y.1746	メチル	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1747	メチル	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1748	メチル	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.1749	メチル	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.1750	メチル	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1751	メチル	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1752	メチル	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1753	メチル	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1754	メチル	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1755	メチル	1	3-プロモアリル-
Y.1756	メチル	1	3-プロモフェニル-
Y.1757	メチル	1	3-ブテニル-
Y.1758	メチル	1	3-クロロアリル-
Y.1759	メチル	1	3-クロロフェニル-
Y.1760	メチル	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1761	メチル	1	3-シアノプロピル-
Y.1762	メチル	1	3-エチルフェニル-
Y.1763	メチル	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1764	メチル	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1765	メチル	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1766	メチル	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1767	メチル	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1768	メチル	1	3-メチルフェニル-
Y.1769	メチル	1	3-ニトロフェニル-
Y.1770	メチル	1	3-ピリジル-
Y.1771	メチル	1	4-(トリフルオロメチキシル)フェニル-
Y.1772	メチル	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1773	メチル	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1774	メチル	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1775	メチル	1	4-プロモフェニル-
Y.1776	メチル	1	4-クロロフェニル-
Y.1777	メチル	1	4-エチルフェニル-
Y.1778	メチル	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.1779	メチル	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1780	メチル	1	4-メチキシルフェニル-
Y.1781	メチル	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1782	メチル	1	4-メチルフェニル-
Y.1783	メチル	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1784	メチル	1	4-ニトロフェニル-
Y.1785	メチル	1	4-ピリジル-
Y.1786	メチル	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1787	メチル	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-

【0 1 0 5】

10

20

30

40

【表 3 5】

Y.1788	メチル	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1789	メチル	1	アリル-
Y.1790	メチル	1	ブタ-2-イニル-
Y.1791	メチル	1	ブタ-3-イニル-
Y.1792	メチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1793	メチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1794	メチル	1	シアノジメチルメチル-
Y.1795	メチル	1	シアノエチル-
Y.1796	メチル	1	シアノメチル-
Y.1797	メチル	1	シクロベンチル-
Y.1798	メチル	1	シクロプロピル-メチル-
Y.1799	メチル	1	メチルプロパルギル-
Y.1800	メチル	1	オキセタン-3-イル-
Y.1801	メチル	1	ペンタ-3-イル-
Y.1802	メチル	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.1803	メチル	1	プロパルギル-
Y.1804	メチル	1	tert-ブチル-
Y.1805	メチル	1	テトラリル-
Y.1806	メチル	1	チアゾール-2-イル-
Y.1807	メチル	1	チアゾール-4-イル-
Y.1808	メチル	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.1809	メチル	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.1810	メチル	1	エチル-
Y.1811	メチル	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1812	メチル	1	ブタ-2-イル-
Y.1813	メチル	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1814	メチル	1	ベンジル-
Y.1815	メチル	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1816	メチル	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1817	メチル	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1818	メチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1819	メチル	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1820	メチル	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.1821	メチル	1	n-ブチル-
Y.1822	メチル	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1823	メチル	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.1824	メチル	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1825	メチル	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1826	メチル	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1827	メチル	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1828	メチル	1	チエタン-3-イル-
Y.1829	メチル	1	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1830	メチル	1	シクロブチル-
Y.1831	メチル	1	メチル-
Y.1832	メチル	1	シクロプロピル-
Y.1833	メチル	1	n-プロピル-
Y.1834	メチル	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.1835	メチル	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.1836	メチル	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.1837	メチル	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.1838	メチル	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1839	メチル	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.1840	メチル	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1841	メチル	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-

【0 1 0 6】

10

20

30

40

【表 3 6】

Y.1842	メチル	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1843	メチル	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1844	メチル	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1845	メチル	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1846	メチル	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1847	メチル	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1848	メチル	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.1849	メチル	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.1850	メチル	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.1851	メチル	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.1852	メチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.1853	メチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.1854	メチル	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.1855	メチル	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.1856	メチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1857	メチル	2	1-シアノシクロブチル-
Y.1858	メチル	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.1859	メチル	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.1860	メチル	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.1861	メチル	2	1-メチルアリル-
Y.1862	メチル	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.1863	メチル	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1864	メチル	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.1865	メチル	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.1866	メチル	2	2-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.1867	メチル	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1868	メチル	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1869	メチル	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.1870	メチル	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.1871	メチル	2	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.1872	メチル	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.1873	メチル	2	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1874	メチル	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.1875	メチル	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.1876	メチル	2	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1877	メチル	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.1878	メチル	2	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1879	メチル	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.1880	メチル	2	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.1881	メチル	2	2-ブロモアリル-
Y.1882	メチル	2	2-ブロモフェニル-
Y.1883	メチル	2	2-ブテニル-
Y.1884	メチル	2	2-クロロアリル-
Y.1885	メチル	2	2-クロロフェニル-
Y.1886	メチル	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.1887	メチル	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.1888	メチル	2	2-シアノシクロプロピル-
Y.1889	メチル	2	2-シアノエチル-
Y.1890	メチル	2	2-エチルフェニル-
Y.1891	メチル	2	2-フルオロエチル-
Y.1892	メチル	2	2-フルオロ-フェニル-
Y.1893	メチル	2	2-フルオロプロピル-
Y.1894	メチル	2	2-フリルメチル-
Y.1895	メチル	2	2-ヒドロキシフェニル-

10

20

30

40

【0107】

【表 3 7】

Y.1896	メチル	2	2-メトキシ-エチル-
Y.1897	メチル	2	2-メトキシフェニル-
Y.1898	メチル	2	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.1899	メチル	2	2-メチルアリル-
Y.1900	メチル	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1901	メチル	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1902	メチル	2	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.1903	メチル	2	2-メチルフェニル-
Y.1904	メチル	2	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.1905	メチル	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.1906	メチル	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.1907	メチル	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.1908	メチル	2	2-ニトロフェニル-
Y.1909	メチル	2	2-プロピル-
Y.1910	メチル	2	2-ピリジル-
Y.1911	メチル	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.1912	メチル	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1913	メチル	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.1914	メチル	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.1915	メチル	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.1916	メチル	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.1917	メチル	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.1918	メチル	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.1919	メチル	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.1920	メチル	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.1921	メチル	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.1922	メチル	2	3-プロモアリル-
Y.1923	メチル	2	3-プロモフェニル-
Y.1924	メチル	2	3-ブテニル-
Y.1925	メチル	2	3-クロロアリル-
Y.1926	メチル	2	3-クロロフェニル-
Y.1927	メチル	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.1928	メチル	2	3-シアノプロピル-
Y.1929	メチル	2	3-エチルフェニル-
Y.1930	メチル	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.1931	メチル	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1932	メチル	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1933	メチル	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.1934	メチル	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.1935	メチル	2	3-メチルフェニル-
Y.1936	メチル	2	3-ニトロフェニル-
Y.1937	メチル	2	3-ピリジル-
Y.1938	メチル	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.1939	メチル	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1940	メチル	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1941	メチル	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.1942	メチル	2	4-プロモフェニル-
Y.1943	メチル	2	4-クロロフェニル-
Y.1944	メチル	2	4-エチルフェニル-
Y.1945	メチル	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.1946	メチル	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.1947	メチル	2	4-メトキシフェニル-
Y.1948	メチル	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1949	メチル	2	4-メチルフェニル-

【0108】

【表 3 8】

Y.1950	メチル	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.1951	メチル	2	4-ニトロフェニル-
Y.1952	メチル	2	4-ピリジル-
Y.1953	メチル	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.1954	メチル	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1955	メチル	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.1956	メチル	2	アリル-
Y.1957	メチル	2	ブタ-2-イニル-
Y.1958	メチル	2	ブタ-3-イニル-
Y.1959	メチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1960	メチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.1961	メチル	2	シアノジメチルメチル-
Y.1962	メチル	2	シアノエチル-
Y.1963	メチル	2	シアノメチル-
Y.1964	メチル	2	シクロベンチル-
Y.1965	メチル	2	シクロプロピル-メチル-
Y.1966	メチル	2	メチルプロパルギル-
Y.1967	メチル	2	オキセタン-3-イル-
Y.1968	メチル	2	ペンタ-3-イル-
Y.1969	メチル	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.1970	メチル	2	プロパルギル-
Y.1971	メチル	2	tert-ブチル-
Y.1972	メチル	2	テトラゾリル-
Y.1973	メチル	2	チアゾール-2-イル-
Y.1974	メチル	2	チアゾール-4-イル-
Y.1975	メチル	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.1976	メチル	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.1977	メチル	2	エチル-
Y.1978	メチル	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.1979	メチル	2	ブタ-2-イル-
Y.1980	メチル	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.1981	メチル	2	ベンジル-
Y.1982	メチル	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.1983	メチル	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.1984	メチル	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.1985	メチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.1986	メチル	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.1987	メチル	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.1988	メチル	2	n-ブチル-
Y.1989	メチル	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.1990	メチル	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.1991	メチル	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.1992	メチル	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.1993	メチル	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.1994	メチル	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.1995	メチル	2	チエタン-3-イル-
Y.1996	メチル	2	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.1997	メチル	2	シクロブチル-
Y.1998	メチル	2	メチル-
Y.1999	メチル	2	シクロプロピル-
Y.2000	メチル	2	n-プロピル-
Y.2001	メチル	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2002	メチル	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2003	メチル	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル

【0109】

【表 3 9】

Y.2004	メチル	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2005	トリフルオロメチル	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2006	トリフルオロメチル	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2007	トリフルオロメチル	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2008	トリフルオロメチル	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2009	トリフルオロメチル	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2010	トリフルオロメチル	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2011	トリフルオロメチル	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2012	トリフルオロメチル	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2013	トリフルオロメチル	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2014	トリフルオロメチル	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2015	トリフルオロメチル	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2016	トリフルオロメチル	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2017	トリフルオロメチル	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2018	トリフルオロメチル	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2019	トリフルオロメチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2020	トリフルオロメチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2021	トリフルオロメチル	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2022	トリフルオロメチル	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2023	トリフルオロメチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2024	トリフルオロメチル	0	1-シアノシクロブチル-
Y.2025	トリフルオロメチル	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.2026	トリフルオロメチル	0	1-シアノシクロヘキシル-
Y.2027	トリフルオロメチル	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2028	トリフルオロメチル	0	1-メチルアリル-
Y.2029	トリフルオロメチル	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2030	トリフルオロメチル	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2031	トリフルオロメチル	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2032	トリフルオロメチル	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.2033	トリフルオロメチル	0	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2034	トリフルオロメチル	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2035	トリフルオロメチル	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2036	トリフルオロメチル	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2037	トリフルオロメチル	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.2038	トリフルオロメチル	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2039	トリフルオロメチル	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2040	トリフルオロメチル	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2041	トリフルオロメチル	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2042	トリフルオロメチル	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.2043	トリフルオロメチル	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2044	トリフルオロメチル	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2045	トリフルオロメチル	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2046	トリフルオロメチル	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2047	トリフルオロメチル	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.2048	トリフルオロメチル	0	2-ブロモアリル-
Y.2049	トリフルオロメチル	0	2-ブロモフェニル-
Y.2050	トリフルオロメチル	0	2-ブテニル-
Y.2051	トリフルオロメチル	0	2-クロロアリル-
Y.2052	トリフルオロメチル	0	2-クロロフェニル-
Y.2053	トリフルオロメチル	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2054	トリフルオロメチル	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2055	トリフルオロメチル	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.2056	トリフルオロメチル	0	2-シアノエチル-
Y.2057	トリフルオロメチル	0	2-エチルフェニル-

10

20

30

40

【0 1 1 0】

【表 40】

Y.2058	トリフルオロメチル	0	2-フルオロエチル-
Y.2059	トリフルオロメチル	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.2060	トリフルオロメチル	0	2-フルオロプロピル-
Y.2061	トリフルオロメチル	0	2-フリルメチル-
Y.2062	トリフルオロメチル	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2063	トリフルオロメチル	0	2-メトキシ-エチル-
Y.2064	トリフルオロメチル	0	2-メトキシフェニル-
Y.2065	トリフルオロメチル	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2066	トリフルオロメチル	0	2-メチルアリル-
Y.2067	トリフルオロメチル	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2068	トリフルオロメチル	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2069	トリフルオロメチル	0	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.2070	トリフルオロメチル	0	2-メチルフェニル-
Y.2071	トリフルオロメチル	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2072	トリフルオロメチル	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2073	トリフルオロメチル	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2074	トリフルオロメチル	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2075	トリフルオロメチル	0	2-ニトロフェニル-
Y.2076	トリフルオロメチル	0	2-プロピル-
Y.2077	トリフルオロメチル	0	2-ピリジル-
Y.2078	トリフルオロメチル	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2079	トリフルオロメチル	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2080	トリフルオロメチル	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.2081	トリフルオロメチル	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2082	トリフルオロメチル	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.2083	トリフルオロメチル	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.2084	トリフルオロメチル	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2085	トリフルオロメチル	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2086	トリフルオロメチル	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.2087	トリフルオロメチル	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2088	トリフルオロメチル	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2089	トリフルオロメチル	0	3-プロモアリル-
Y.2090	トリフルオロメチル	0	3-プロモフェニル-
Y.2091	トリフルオロメチル	0	3-ブテニル-
Y.2092	トリフルオロメチル	0	3-クロロアリル-
Y.2093	トリフルオロメチル	0	3-クロロフェニル-
Y.2094	トリフルオロメチル	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2095	トリフルオロメチル	0	3-シアノプロピル-
Y.2096	トリフルオロメチル	0	3-エチルフェニル-
Y.2097	トリフルオロメチル	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2098	トリフルオロメチル	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2099	トリフルオロメチル	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2100	トリフルオロメチル	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2101	トリフルオロメチル	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2102	トリフルオロメチル	0	3-メチルフェニル-
Y.2103	トリフルオロメチル	0	3-ニトロフェニル-
Y.2104	トリフルオロメチル	0	3-ピリジル-
Y.2105	トリフルオロメチル	0	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2106	トリフルオロメチル	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2107	トリフルオロメチル	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2108	トリフルオロメチル	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2109	トリフルオロメチル	0	4-プロモフェニル-
Y.2110	トリフルオロメチル	0	4-クロロフェニル-
Y.2111	トリフルオロメチル	0	4-エチルフェニル-

10

20

30

40

【0111】

【表 4 1】

Y.2112	トリフルオロメチル	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.2113	トリフルオロメチル	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2114	トリフルオロメチル	0	4-メトキシフェニル-
Y.2115	トリフルオロメチル	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2116	トリフルオロメチル	0	4-メチルフェニル-
Y.2117	トリフルオロメチル	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2118	トリフルオロメチル	0	4-ニトロフェニル-
Y.2119	トリフルオロメチル	0	4-ピリジル-
Y.2120	トリフルオロメチル	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2121	トリフルオロメチル	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2122	トリフルオロメチル	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2123	トリフルオロメチル	0	アリル-
Y.2124	トリフルオロメチル	0	ブタ-2-イル-
Y.2125	トリフルオロメチル	0	ブタ-3-イル-
Y.2126	トリフルオロメチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2127	トリフルオロメチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2128	トリフルオロメチル	0	シアノジメチルメチル-
Y.2129	トリフルオロメチル	0	シアノエチル-
Y.2130	トリフルオロメチル	0	シアノメチル-
Y.2131	トリフルオロメチル	0	シクロペンチル-
Y.2132	トリフルオロメチル	0	シクロプロピル-メチル-
Y.2133	トリフルオロメチル	0	メチルプロパルギル-
Y.2134	トリフルオロメチル	0	オキセタン-3-イル-
Y.2135	トリフルオロメチル	0	ペンタ-3-イル-
Y.2136	トリフルオロメチル	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.2137	トリフルオロメチル	0	プロパルギル-
Y.2138	トリフルオロメチル	0	tert-ブチル-
Y.2139	トリフルオロメチル	0	テトラリル-
Y.2140	トリフルオロメチル	0	チアゾール-2-イル-
Y.2141	トリフルオロメチル	0	チアゾール-4-イル-
Y.2142	トリフルオロメチル	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.2143	トリフルオロメチル	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.2144	トリフルオロメチル	0	エチル-
Y.2145	トリフルオロメチル	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.2146	トリフルオロメチル	0	ブタ-2-イル-
Y.2147	トリフルオロメチル	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2148	トリフルオロメチル	0	ベンジル-
Y.2149	トリフルオロメチル	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2150	トリフルオロメチル	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.2151	トリフルオロメチル	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2152	トリフルオロメチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2153	トリフルオロメチル	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2154	トリフルオロメチル	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.2155	トリフルオロメチル	0	n-ブチル-
Y.2156	トリフルオロメチル	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2157	トリフルオロメチル	0	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.2158	トリフルオロメチル	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2159	トリフルオロメチル	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2160	トリフルオロメチル	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.2161	トリフルオロメチル	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2162	トリフルオロメチル	0	チエタン-3-イル-
Y.2163	トリフルオロメチル	0	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2164	トリフルオロメチル	0	シクロブチル-
Y.2165	トリフルオロメチル	0	メチル-

10

20

30

40

【0 1 1 2】

【表 4 2】

Y.2166	トリフルオロメチル	0	シクロプロピル-
Y.2167	トリフルオロメチル	0	n-プロピル-
Y.2168	トリフルオロメチル	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2169	トリフルオロメチル	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2170	トリフルオロメチル	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.2171	トリフルオロメチル	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2172	トリフルオロメチル	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2173	トリフルオロメチル	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2174	トリフルオロメチル	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2175	トリフルオロメチル	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2176	トリフルオロメチル	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2177	トリフルオロメチル	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2178	トリフルオロメチル	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2179	トリフルオロメチル	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2180	トリフルオロメチル	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2181	トリフルオロメチル	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2182	トリフルオロメチル	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2183	トリフルオロメチル	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2184	トリフルオロメチル	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2185	トリフルオロメチル	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2186	トリフルオロメチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2187	トリフルオロメチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2188	トリフルオロメチル	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2189	トリフルオロメチル	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2190	トリフルオロメチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2191	トリフルオロメチル	1	1-シアノシクロブチル-
Y.2192	トリフルオロメチル	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.2193	トリフルオロメチル	1	1-シアノシクロプロピル-
Y.2194	トリフルオロメチル	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2195	トリフルオロメチル	1	1-メチルアリル-
Y.2196	トリフルオロメチル	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2197	トリフルオロメチル	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2198	トリフルオロメチル	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2199	トリフルオロメチル	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.2200	トリフルオロメチル	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2201	トリフルオロメチル	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2202	トリフルオロメチル	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2203	トリフルオロメチル	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2204	トリフルオロメチル	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.2205	トリフルオロメチル	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2206	トリフルオロメチル	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2207	トリフルオロメチル	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2208	トリフルオロメチル	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2209	トリフルオロメチル	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.2210	トリフルオロメチル	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2211	トリフルオロメチル	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2212	トリフルオロメチル	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2213	トリフルオロメチル	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2214	トリフルオロメチル	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.2215	トリフルオロメチル	1	2-ブロモアリル-
Y.2216	トリフルオロメチル	1	2-ブロモフェニル-
Y.2217	トリフルオロメチル	1	2-ブテニル-
Y.2218	トリフルオロメチル	1	2-クロロアリル-
Y.2219	トリフルオロメチル	1	2-クロロフェニル-

【0 1 1 3】

【表 4 3】

Y.2220	トリフルオロメチル	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2221	トリフルオロメチル	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2222	トリフルオロメチル	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.2223	トリフルオロメチル	1	2-シアノエチル-
Y.2224	トリフルオロメチル	1	2-エチルフェニル-
Y.2225	トリフルオロメチル	1	2-フルオロエチル-
Y.2226	トリフルオロメチル	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.2227	トリフルオロメチル	1	2-フルオロプロピル-
Y.2228	トリフルオロメチル	1	2-フリルメチル-
Y.2229	トリフルオロメチル	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2230	トリフルオロメチル	1	2-メトキシ-エチル-
Y.2231	トリフルオロメチル	1	2-メトキシフェニル-
Y.2232	トリフルオロメチル	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2233	トリフルオロメチル	1	2-メチルアリル-
Y.2234	トリフルオロメチル	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2235	トリフルオロメチル	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2236	トリフルオロメチル	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.2237	トリフルオロメチル	1	2-メチルフェニル-
Y.2238	トリフルオロメチル	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2239	トリフルオロメチル	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2240	トリフルオロメチル	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2241	トリフルオロメチル	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2242	トリフルオロメチル	1	2-ニトロフェニル-
Y.2243	トリフルオロメチル	1	2-プロピル-
Y.2244	トリフルオロメチル	1	2-ピリジル-
Y.2245	トリフルオロメチル	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2246	トリフルオロメチル	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2247	トリフルオロメチル	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.2248	トリフルオロメチル	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2249	トリフルオロメチル	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.2250	トリフルオロメチル	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.2251	トリフルオロメチル	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2252	トリフルオロメチル	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2253	トリフルオロメチル	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.2254	トリフルオロメチル	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2255	トリフルオロメチル	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2256	トリフルオロメチル	1	3-プロモアリル-
Y.2257	トリフルオロメチル	1	3-プロモフェニル-
Y.2258	トリフルオロメチル	1	3-ブテニル-
Y.2259	トリフルオロメチル	1	3-クロロアリル-
Y.2260	トリフルオロメチル	1	3-クロロフェニル-
Y.2261	トリフルオロメチル	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2262	トリフルオロメチル	1	3-シアノプロピル-
Y.2263	トリフルオロメチル	1	3-エチルフェニル-
Y.2264	トリフルオロメチル	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2265	トリフルオロメチル	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2266	トリフルオロメチル	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2267	トリフルオロメチル	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2268	トリフルオロメチル	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2269	トリフルオロメチル	1	3-メチルフェニル-
Y.2270	トリフルオロメチル	1	3-ニトロフェニル-
Y.2271	トリフルオロメチル	1	3-ピリジル-
Y.2272	トリフルオロメチル	1	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2273	トリフルオロメチル	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-

10

20

30

40

【表 4 4】

Y.2274	トリフルオロメチル	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2275	トリフルオロメチル	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2276	トリフルオロメチル	1	4-プロモフェニル-
Y.2277	トリフルオロメチル	1	4-クロロフェニル-
Y.2278	トリフルオロメチル	1	4-エチルフェニル-
Y.2279	トリフルオロメチル	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.2280	トリフルオロメチル	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2281	トリフルオロメチル	1	4-メトキシフェニル-
Y.2282	トリフルオロメチル	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2283	トリフルオロメチル	1	4-メチルフェニル-
Y.2284	トリフルオロメチル	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2285	トリフルオロメチル	1	4-ニトロフェニル-
Y.2286	トリフルオロメチル	1	4-ビリジル-
Y.2287	トリフルオロメチル	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2288	トリフルオロメチル	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2289	トリフルオロメチル	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2290	トリフルオロメチル	1	アリル-
Y.2291	トリフルオロメチル	1	ブタ-2-イニル-
Y.2292	トリフルオロメチル	1	ブタ-3-イニル-
Y.2293	トリフルオロメチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2294	トリフルオロメチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2295	トリフルオロメチル	1	シアノジメチルメチル-
Y.2296	トリフルオロメチル	1	シアノエチル-
Y.2297	トリフルオロメチル	1	シアノメチル-
Y.2298	トリフルオロメチル	1	シクロベンチル-
Y.2299	トリフルオロメチル	1	シクロプロピル-メチル-
Y.2300	トリフルオロメチル	1	メチルプロパルギル-
Y.2301	トリフルオロメチル	1	オキセタン-3-イル-
Y.2302	トリフルオロメチル	1	ベンタ-3-イル-
Y.2303	トリフルオロメチル	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.2304	トリフルオロメチル	1	プロパルギル-
Y.2305	トリフルオロメチル	1	tert-ブチル-
Y.2306	トリフルオロメチル	1	テトラゾリル-
Y.2307	トリフルオロメチル	1	チアゾール-2-イル-
Y.2308	トリフルオロメチル	1	チアゾール-4-イル-
Y.2309	トリフルオロメチル	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.2310	トリフルオロメチル	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.2311	トリフルオロメチル	1	エチル-
Y.2312	トリフルオロメチル	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.2313	トリフルオロメチル	1	ブタ-2-イル-
Y.2314	トリフルオロメチル	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2315	トリフルオロメチル	1	ベンジル-
Y.2316	トリフルオロメチル	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2317	トリフルオロメチル	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.2318	トリフルオロメチル	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2319	トリフルオロメチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2320	トリフルオロメチル	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2321	トリフルオロメチル	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.2322	トリフルオロメチル	1	n-ブチル-
Y.2323	トリフルオロメチル	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2324	トリフルオロメチル	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.2325	トリフルオロメチル	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2326	トリフルオロメチル	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2327	トリフルオロメチル	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル

10

20

30

40

【表 4 5】

Y.2328	トリフルオロメチル	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2329	トリフルオロメチル	1	チエタン-3-イル-
Y.2330	トリフルオロメチル	1	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2331	トリフルオロメチル	1	シクロブチル-
Y.2332	トリフルオロメチル	1	メチル-
Y.2333	トリフルオロメチル	1	シクロプロピル-
Y.2334	トリフルオロメチル	1	n-プロピル-
Y.2335	トリフルオロメチル	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2336	トリフルオロメチル	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2337	トリフルオロメチル	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.2338	トリフルオロメチル	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2339	トリフルオロメチル	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2340	トリフルオロメチル	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2341	トリフルオロメチル	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2342	トリフルオロメチル	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2343	トリフルオロメチル	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2344	トリフルオロメチル	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2345	トリフルオロメチル	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2346	トリフルオロメチル	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2347	トリフルオロメチル	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2348	トリフルオロメチル	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2349	トリフルオロメチル	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2350	トリフルオロメチル	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2351	トリフルオロメチル	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2352	トリフルオロメチル	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2353	トリフルオロメチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2354	トリフルオロメチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2355	トリフルオロメチル	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2356	トリフルオロメチル	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2357	トリフルオロメチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2358	トリフルオロメチル	2	1-シアノシクロブチル-
Y.2359	トリフルオロメチル	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.2360	トリフルオロメチル	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.2361	トリフルオロメチル	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2362	トリフルオロメチル	2	1-メチルアリル-
Y.2363	トリフルオロメチル	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2364	トリフルオロメチル	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2365	トリフルオロメチル	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2366	トリフルオロメチル	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.2367	トリフルオロメチル	2	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2368	トリフルオロメチル	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2369	トリフルオロメチル	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2370	トリフルオロメチル	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2371	トリフルオロメチル	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.2372	トリフルオロメチル	2	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2373	トリフルオロメチル	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2374	トリフルオロメチル	2	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2375	トリフルオロメチル	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2376	トリフルオロメチル	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.2377	トリフルオロメチル	2	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2378	トリフルオロメチル	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2379	トリフルオロメチル	2	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2380	トリフルオロメチル	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2381	トリフルオロメチル	2	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-

10

20

30

40

【表 4 6】

Y.2382	トリフルオロメチル	2	2-プロモアリル-
Y.2383	トリフルオロメチル	2	2-プロモフェニル-
Y.2384	トリフルオロメチル	2	2-ブテニル-
Y.2385	トリフルオロメチル	2	2-クロロアリル-
Y.2386	トリフルオロメチル	2	2-クロロフェニル-
Y.2387	トリフルオロメチル	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2388	トリフルオロメチル	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2389	トリフルオロメチル	2	2-シアノクロプロビル-
Y.2390	トリフルオロメチル	2	2-シアノエチル-
Y.2391	トリフルオロメチル	2	2-エチルフェニル-
Y.2392	トリフルオロメチル	2	2-フルオロエチル-
Y.2393	トリフルオロメチル	2	2-フルオロフェニル-
Y.2394	トリフルオロメチル	2	2-フルオロプロビル-
Y.2395	トリフルオロメチル	2	2-フリルメチル-
Y.2396	トリフルオロメチル	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2397	トリフルオロメチル	2	2-メトキシ-エチル-
Y.2398	トリフルオロメチル	2	2-メトキシフェニル-
Y.2399	トリフルオロメチル	2	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2400	トリフルオロメチル	2	2-メチルアリル-
Y.2401	トリフルオロメチル	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2402	トリフルオロメチル	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2403	トリフルオロメチル	2	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.2404	トリフルオロメチル	2	2-メチルフェニル-
Y.2405	トリフルオロメチル	2	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2406	トリフルオロメチル	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2407	トリフルオロメチル	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2408	トリフルオロメチル	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2409	トリフルオロメチル	2	2-ニトロフェニル-
Y.2410	トリフルオロメチル	2	2-プロビル-
Y.2411	トリフルオロメチル	2	2-ピリジル-
Y.2412	トリフルオロメチル	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2413	トリフルオロメチル	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2414	トリフルオロメチル	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロビル-
Y.2415	トリフルオロメチル	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2416	トリフルオロメチル	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.2417	トリフルオロメチル	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.2418	トリフルオロメチル	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2419	トリフルオロメチル	2	3,4-ジフルオロフェニル-
Y.2420	トリフルオロメチル	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.2421	トリフルオロメチル	2	3,5-ジフルオロフェニル-
Y.2422	トリフルオロメチル	2	3,6-ジフルオロフェニル-
Y.2423	トリフルオロメチル	2	3-プロモアリル-
Y.2424	トリフルオロメチル	2	3-プロモフェニル-
Y.2425	トリフルオロメチル	2	3-ブテニル-
Y.2426	トリフルオロメチル	2	3-クロロアリル-
Y.2427	トリフルオロメチル	2	3-クロロフェニル-
Y.2428	トリフルオロメチル	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2429	トリフルオロメチル	2	3-シアノプロビル-
Y.2430	トリフルオロメチル	2	3-エチルフェニル-
Y.2431	トリフルオロメチル	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2432	トリフルオロメチル	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2433	トリフルオロメチル	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2434	トリフルオロメチル	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2435	トリフルオロメチル	2	3-メチル-ブタ-2-イル-

【 0 1 1 7 】

【表 4 7】

Y.2436	トリフルオロメチル	2	3-メチルフェニル-
Y.2437	トリフルオロメチル	2	3-ニトロフェニル-
Y.2438	トリフルオロメチル	2	3-ピリジル-
Y.2439	トリフルオロメチル	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2440	トリフルオロメチル	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2441	トリフルオロメチル	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2442	トリフルオロメチル	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2443	トリフルオロメチル	2	4-ブロモフェニル-
Y.2444	トリフルオロメチル	2	4-クロロフェニル-
Y.2445	トリフルオロメチル	2	4-エチルフェニル-
Y.2446	トリフルオロメチル	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.2447	トリフルオロメチル	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2448	トリフルオロメチル	2	4-メトキシフェニル-
Y.2449	トリフルオロメチル	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2450	トリフルオロメチル	2	4-メチルフェニル-
Y.2451	トリフルオロメチル	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2452	トリフルオロメチル	2	4-ニトロフェニル-
Y.2453	トリフルオロメチル	2	4-ピリジル-
Y.2454	トリフルオロメチル	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2455	トリフルオロメチル	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2456	トリフルオロメチル	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2457	トリフルオロメチル	2	アリル-
Y.2458	トリフルオロメチル	2	ブタ-2-イニル-
Y.2459	トリフルオロメチル	2	ブタ-3-イニル-
Y.2460	トリフルオロメチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2461	トリフルオロメチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2462	トリフルオロメチル	2	シアノジメチルメチル-
Y.2463	トリフルオロメチル	2	シアノエチル-
Y.2464	トリフルオロメチル	2	シアノメチル-
Y.2465	トリフルオロメチル	2	シクロペンチル-
Y.2466	トリフルオロメチル	2	シクロプロピル-メチル-
Y.2467	トリフルオロメチル	2	メチルプロパルギル-
Y.2468	トリフルオロメチル	2	オキセタン-3-イル-
Y.2469	トリフルオロメチル	2	ペンタ-3-イル-
Y.2470	トリフルオロメチル	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.2471	トリフルオロメチル	2	プロパルギル-
Y.2472	トリフルオロメチル	2	tert-ブチル-
Y.2473	トリフルオロメチル	2	テトラゾリル-
Y.2474	トリフルオロメチル	2	チアゾール-2-イル-
Y.2475	トリフルオロメチル	2	チアゾール-4-イル-
Y.2476	トリフルオロメチル	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.2477	トリフルオロメチル	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.2478	トリフルオロメチル	2	エチル-
Y.2479	トリフルオロメチル	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.2480	トリフルオロメチル	2	ブタ-2-イル-
Y.2481	トリフルオロメチル	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2482	トリフルオロメチル	2	ベンジル-
Y.2483	トリフルオロメチル	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2484	トリフルオロメチル	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.2485	トリフルオロメチル	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2486	トリフルオロメチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2487	トリフルオロメチル	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2488	トリフルオロメチル	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.2489	トリフルオロメチル	2	n-ブチル-

【表 4 8】

Y.2490	トリフルオロメチル	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2491	トリフルオロメチル	2	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
Y.2492	トリフルオロメチル	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2493	トリフルオロメチル	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2494	トリフルオロメチル	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.2495	トリフルオロメチル	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2496	トリフルオロメチル	2	チエタン-3-イル-
Y.2497	トリフルオロメチル	2	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2498	トリフルオロメチル	2	シクロブチル-
Y.2499	トリフルオロメチル	2	メチル-
Y.2500	トリフルオロメチル	2	シクロプロピル-
Y.2501	トリフルオロメチル	2	n-プロピル-
Y.2502	トリフルオロメチル	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2503	トリフルオロメチル	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2504	トリフルオロメチル	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.2505	トリフルオロメチル	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2506	エチル	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2507	エチル	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2508	エチル	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2509	エチル	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2510	エチル	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2511	エチル	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2512	エチル	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2513	エチル	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2514	エチル	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2515	エチル	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2516	エチル	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2517	エチル	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2518	エチル	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2519	エチル	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2520	エチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2521	エチル	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2522	エチル	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2523	エチル	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2524	エチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2525	エチル	0	1-シアノシクロブチル-
Y.2526	エチル	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.2527	エチル	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.2528	エチル	0	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2529	エチル	0	1-メチルアリル-
Y.2530	エチル	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2531	エチル	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2532	エチル	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2533	エチル	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.2534	エチル	0	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2535	エチル	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2536	エチル	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2537	エチル	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2538	エチル	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.2539	エチル	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2540	エチル	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2541	エチル	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2542	エチル	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2543	エチル	0	2,5-ジクロロフェニル-

【表 4 9】

Y.2544	エチル	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2545	エチル	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2546	エチル	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2547	エチル	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2548	エチル	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.2549	エチル	0	2-ブロモアリル-
Y.2550	エチル	0	2-ブロモフェニル-
Y.2551	エチル	0	2-ブテニル-
Y.2552	エチル	0	2-クロロアリル-
Y.2553	エチル	0	2-クロロフェニル-
Y.2554	エチル	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2555	エチル	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2556	エチル	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.2557	エチル	0	2-シアノエチル-
Y.2558	エチル	0	2-エチルフェニル-
Y.2559	エチル	0	2-フルオロエチル-
Y.2560	エチル	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.2561	エチル	0	2-フルオロプロピル-
Y.2562	エチル	0	2-フリルメチル-
Y.2563	エチル	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2564	エチル	0	2-メトキシ-エチル-
Y.2565	エチル	0	2-メトキシフェニル-
Y.2566	エチル	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2567	エチル	0	2-メチルアリル-
Y.2568	エチル	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2569	エチル	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2570	エチル	0	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.2571	エチル	0	2-メチルフェニル-
Y.2572	エチル	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2573	エチル	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2574	エチル	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2575	エチル	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2576	エチル	0	2-ニトロフェニル-
Y.2577	エチル	0	2-プロピル-
Y.2578	エチル	0	2-ピリジル-
Y.2579	エチル	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2580	エチル	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2581	エチル	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.2582	エチル	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2583	エチル	0	3,3-ジブロモアリル-
Y.2584	エチル	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.2585	エチル	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2586	エチル	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2587	エチル	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.2588	エチル	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2589	エチル	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2590	エチル	0	3-ブロモアリル-
Y.2591	エチル	0	3-ブロモフェニル-
Y.2592	エチル	0	3-ブテニル-
Y.2593	エチル	0	3-クロロアリル-
Y.2594	エチル	0	3-クロロフェニル-
Y.2595	エチル	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2596	エチル	0	3-シアノプロピル-
Y.2597	エチル	0	3-エチルフェニル-

【 0 1 2 0 】

【表 50】

Y.2598	エチル	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2599	エチル	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2600	エチル	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2601	エチル	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2602	エチル	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2603	エチル	0	3-メチルフェニル-
Y.2604	エチル	0	3-ニトロフェニル-
Y.2605	エチル	0	3-ピリジル-
Y.2606	エチル	0	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2607	エチル	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2608	エチル	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2609	エチル	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2610	エチル	0	4-プロモフェニル-
Y.2611	エチル	0	4-クロロフェニル-
Y.2612	エチル	0	4-エチルフェニル-
Y.2613	エチル	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.2614	エチル	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2615	エチル	0	4-メトキシフェニル-
Y.2616	エチル	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2617	エチル	0	4-メチルフェニル-
Y.2618	エチル	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2619	エチル	0	4-ニトロフェニル-
Y.2620	エチル	0	4-ピリジル-
Y.2621	エチル	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2622	エチル	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2623	エチル	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2624	エチル	0	アリル-
Y.2625	エチル	0	ブタ-2-イニル-
Y.2626	エチル	0	ブタ-3-イニル-
Y.2627	エチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2628	エチル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2629	エチル	0	シアノジメチルメチル-
Y.2630	エチル	0	シアノエチル-
Y.2631	エチル	0	シアノメチル-
Y.2632	エチル	0	シクロベンチル-
Y.2633	エチル	0	シクロプロピル-メチル-
Y.2634	エチル	0	メチルプロパルギル-
Y.2635	エチル	0	オキセタン-3-イル-
Y.2636	エチル	0	ペンタ-3-イル-
Y.2637	エチル	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.2638	エチル	0	プロパルギル-
Y.2639	エチル	0	tert-ブチル-
Y.2640	エチル	0	テトラゾリル-
Y.2641	エチル	0	チアゾール-2-イル-
Y.2642	エチル	0	チアゾール-4-イル-
Y.2643	エチル	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.2644	エチル	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.2645	エチル	0	エチル-
Y.2646	エチル	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.2647	エチル	0	ブタ-2-イル-
Y.2648	エチル	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2649	エチル	0	ベンジル-
Y.2650	エチル	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2651	エチル	0	1-フェニル-エタ-1-イル-

10

20

30

40

【表 5 1】

Y.2652	エチル	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2653	エチル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2654	エチル	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2655	エチル	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.2656	エチル	0	n-ブチル-
Y.2657	エチル	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2658	エチル	0	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.2659	エチル	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2660	エチル	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2661	エチル	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.2662	エチル	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2663	エチル	0	チエタン-3-イル-
Y.2664	エチル	0	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2665	エチル	0	シクロブチル-
Y.2666	エチル	0	メチル-
Y.2667	エチル	0	シクロプロピル-
Y.2668	エチル	0	n-プロピル-
Y.2669	エチル	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2670	エチル	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2671	エチル	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.2672	エチル	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2673	エチル	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2674	エチル	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2675	エチル	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2676	エチル	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2677	エチル	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2678	エチル	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2679	エチル	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2680	エチル	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2681	エチル	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2682	エチル	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2683	エチル	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2684	エチル	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2685	エチル	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2686	エチル	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2687	エチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2688	エチル	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2689	エチル	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2690	エチル	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2691	エチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2692	エチル	1	1-シアノシクロブチル-
Y.2693	エチル	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.2694	エチル	1	1-シアノシクロプロピル-
Y.2695	エチル	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2696	エチル	1	1-メチルアリル-
Y.2697	エチル	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2698	エチル	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2699	エチル	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2700	エチル	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.2701	エチル	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2702	エチル	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2703	エチル	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2704	エチル	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2705	エチル	1	2,3-ジクロロフェニル-

【0 1 2 2】

【表 5 2】

Y.2706	エチル	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2707	エチル	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2708	エチル	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2709	エチル	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2710	エチル	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.2711	エチル	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2712	エチル	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2713	エチル	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2714	エチル	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2715	エチル	1	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.2716	エチル	1	2-ブロモアリル-
Y.2717	エチル	1	2-ブロモフェニル-
Y.2718	エチル	1	2-ブテニル-
Y.2719	エチル	1	2-クロロアリル-
Y.2720	エチル	1	2-クロロフェニル-
Y.2721	エチル	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2722	エチル	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2723	エチル	1	2-シアノクロプロピル-
Y.2724	エチル	1	2-シアノエチル-
Y.2725	エチル	1	2-エチルフェニル-
Y.2726	エチル	1	2-フルオロエチル-
Y.2727	エチル	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.2728	エチル	1	2-フルオロプロピル-
Y.2729	エチル	1	2-フリルメチル-
Y.2730	エチル	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2731	エチル	1	2-メトキシ-エチル-
Y.2732	エチル	1	2-メトキシフェニル-
Y.2733	エチル	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2734	エチル	1	2-メチルアリル-
Y.2735	エチル	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2736	エチル	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2737	エチル	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.2738	エチル	1	2-メチルフェニル-
Y.2739	エチル	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2740	エチル	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2741	エチル	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2742	エチル	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2743	エチル	1	2-ニトロフェニル-
Y.2744	エチル	1	2-プロピル-
Y.2745	エチル	1	2-ピリジル-
Y.2746	エチル	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2747	エチル	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2748	エチル	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.2749	エチル	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2750	エチル	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.2751	エチル	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.2752	エチル	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2753	エチル	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2754	エチル	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.2755	エチル	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2756	エチル	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2757	エチル	1	3-プロモアリル-
Y.2758	エチル	1	3-プロモフェニル-
Y.2759	エチル	1	3-ブテニル-

10

20

30

40

【表 5 3】

Y.2760	エチル	1	3-クロロアリル-
Y.2761	エチル	1	3-クロロフェニル-
Y.2762	エチル	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2763	エチル	1	3-シアノプロピル-
Y.2764	エチル	1	3-エチルフェニル-
Y.2765	エチル	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2766	エチル	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2767	エチル	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2768	エチル	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2769	エチル	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2770	エチル	1	3-メチルフェニル-
Y.2771	エチル	1	3-ニトロフェニル-
Y.2772	エチル	1	3-ピリジル-
Y.2773	エチル	1	4-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.2774	エチル	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2775	エチル	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2776	エチル	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2777	エチル	1	4-プロモフェニル-
Y.2778	エチル	1	4-クロロフェニル-
Y.2779	エチル	1	4-エチルフェニル-
Y.2780	エチル	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.2781	エチル	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2782	エチル	1	4-メトキシフェニル-
Y.2783	エチル	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2784	エチル	1	4-メチルフェニル-
Y.2785	エチル	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2786	エチル	1	4-ニトロフェニル-
Y.2787	エチル	1	4-ピリジル-
Y.2788	エチル	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2789	エチル	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2790	エチル	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2791	エチル	1	アリル-
Y.2792	エチル	1	ブタ-2-イル-
Y.2793	エチル	1	ブタ-3-イル-
Y.2794	エチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2795	エチル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2796	エチル	1	シアノジメチルメチル-
Y.2797	エチル	1	シアノエチル-
Y.2798	エチル	1	シアノメチル-
Y.2799	エチル	1	シクロペンチル-
Y.2800	エチル	1	シクロプロピル-メチル-
Y.2801	エチル	1	メチルプロパルギル-
Y.2802	エチル	1	オキセタン-3-イル-
Y.2803	エチル	1	ペンタ-3-イル-
Y.2804	エチル	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.2805	エチル	1	プロパルギル-
Y.2806	エチル	1	tert-ブチル-
Y.2807	エチル	1	テトラゾリル-
Y.2808	エチル	1	チアゾール-2-イル-
Y.2809	エチル	1	チアゾール-4-イル-
Y.2810	エチル	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.2811	エチル	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.2812	エチル	1	エチル-
Y.2813	エチル	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-

10

20

30

40

【表 5 4】

Y.2814	エチル	1	ブタ-2-イル-
Y.2815	エチル	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2816	エチル	1	ベンジル-
Y.2817	エチル	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2818	エチル	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.2819	エチル	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2820	エチル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2821	エチル	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2822	エチル	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.2823	エチル	1	n-ブチル-
Y.2824	エチル	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2825	エチル	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.2826	エチル	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2827	エチル	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2828	エチル	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.2829	エチル	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2830	エチル	1	チエタン-3-イル-
Y.2831	エチル	1	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2832	エチル	1	シクロブチル-
Y.2833	エチル	1	メチル-
Y.2834	エチル	1	シクロプロピル-
Y.2835	エチル	1	n-プロピル-
Y.2836	エチル	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.2837	エチル	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.2838	エチル	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.2839	エチル	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.2840	エチル	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2841	エチル	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.2842	エチル	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2843	エチル	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2844	エチル	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2845	エチル	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2846	エチル	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2847	エチル	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2848	エチル	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2849	エチル	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2850	エチル	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.2851	エチル	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.2852	エチル	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.2853	エチル	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.2854	エチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.2855	エチル	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.2856	エチル	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.2857	エチル	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.2858	エチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2859	エチル	2	1-シアノシクロブチル-
Y.2860	エチル	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.2861	エチル	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.2862	エチル	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.2863	エチル	2	1-メチルアリル-
Y.2864	エチル	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.2865	エチル	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2866	エチル	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.2867	エチル	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-

【0 1 2 5】

【表 5 5】

Y.2868	エチル	2	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2869	エチル	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2870	エチル	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2871	エチル	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.2872	エチル	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.2873	エチル	2	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.2874	エチル	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.2875	エチル	2	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2876	エチル	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.2877	エチル	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.2878	エチル	2	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2879	エチル	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.2880	エチル	2	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2881	エチル	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.2882	エチル	2	2-プロモ-4-フルオロフェニル-
Y.2883	エチル	2	2-プロモアリル-
Y.2884	エチル	2	2-プロモフェニル-
Y.2885	エチル	2	2-ブテニル-
Y.2886	エチル	2	2-クロロアリル-
Y.2887	エチル	2	2-クロロフェニル-
Y.2888	エチル	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.2889	エチル	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.2890	エチル	2	2-シアノクロプロピル-
Y.2891	エチル	2	2-シアノエチル-
Y.2892	エチル	2	2-エチルフェニル-
Y.2893	エチル	2	2-フルオロエチル-
Y.2894	エチル	2	2-フルオロ-フェニル-
Y.2895	エチル	2	2-フルオロプロピル-
Y.2896	エチル	2	2-フリルメチル-
Y.2897	エチル	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.2898	エチル	2	2-メトキシ-エチル-
Y.2899	エチル	2	2-メトキシフェニル-
Y.2900	エチル	2	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.2901	エチル	2	2-メチルアリル-
Y.2902	エチル	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2903	エチル	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2904	エチル	2	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.2905	エチル	2	2-メチルフェニル-
Y.2906	エチル	2	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.2907	エチル	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.2908	エチル	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.2909	エチル	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.2910	エチル	2	2-ニトロフェニル-
Y.2911	エチル	2	2-プロピル-
Y.2912	エチル	2	2-ピリジル-
Y.2913	エチル	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.2914	エチル	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2915	エチル	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.2916	エチル	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.2917	エチル	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.2918	エチル	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.2919	エチル	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.2920	エチル	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.2921	エチル	2	3,5-ジクロロフェニル-

【0 1 2 6】

【表 5 6】

Y.2922	エチル	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.2923	エチル	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.2924	エチル	2	3-プロモアリル-
Y.2925	エチル	2	3-プロモフェニル-
Y.2926	エチル	2	3-ブテニル-
Y.2927	エチル	2	3-クロロアリル-
Y.2928	エチル	2	3-クロロフェニル-
Y.2929	エチル	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.2930	エチル	2	3-シアノプロピル-
Y.2931	エチル	2	3-エチルフェニル-
Y.2932	エチル	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.2933	エチル	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2934	エチル	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2935	エチル	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.2936	エチル	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.2937	エチル	2	3-メチルフェニル-
Y.2938	エチル	2	3-ニトロフェニル-
Y.2939	エチル	2	3-ピリジル-
Y.2940	エチル	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.2941	エチル	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2942	エチル	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2943	エチル	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.2944	エチル	2	4-プロモフェニル-
Y.2945	エチル	2	4-クロロフェニル-
Y.2946	エチル	2	4-エチルフェニル-
Y.2947	エチル	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.2948	エチル	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.2949	エチル	2	4-メトキシフェニル-
Y.2950	エチル	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2951	エチル	2	4-メチルフェニル-
Y.2952	エチル	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.2953	エチル	2	4-ニトロフェニル-
Y.2954	エチル	2	4-ピリジル-
Y.2955	エチル	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.2956	エチル	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2957	エチル	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.2958	エチル	2	アリル-
Y.2959	エチル	2	ブタ-2-イニル-
Y.2960	エチル	2	ブタ-3-イニル-
Y.2961	エチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2962	エチル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.2963	エチル	2	シアノジメチルメチル-
Y.2964	エチル	2	シアノエチル-
Y.2965	エチル	2	シアノメチル-
Y.2966	エチル	2	シクロベンチル-
Y.2967	エチル	2	シクロプロピル-メチル-
Y.2968	エチル	2	メチルプロパルギル-
Y.2969	エチル	2	オキセタン-3-イル-
Y.2970	エチル	2	ペンタ-3-イル-
Y.2971	エチル	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.2972	エチル	2	プロパルギル-
Y.2973	エチル	2	tert-ブチル-
Y.2974	エチル	2	テトラゾリル-
Y.2975	エチル	2	チアゾール-2-イル-

10

20

30

40

【表 5 7】

Y.2976	エチル	2	チアゾール-4-イル-
Y.2977	エチル	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.2978	エチル	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.2979	エチル	2	エチル-
Y.2980	エチル	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.2981	エチル	2	ブタ-2-イル-
Y.2982	エチル	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.2983	エチル	2	ベンジル-
Y.2984	エチル	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.2985	エチル	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.2986	エチル	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.2987	エチル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.2988	エチル	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.2989	エチル	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.2990	エチル	2	n-ブチル-
Y.2991	エチル	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.2992	エチル	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.2993	エチル	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.2994	エチル	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.2995	エチル	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.2996	エチル	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.2997	エチル	2	チエタン-3-イル-
Y.2998	エチル	2	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.2999	エチル	2	シクロブチル-
Y.3000	エチル	2	メチル-
Y.3001	エチル	2	シクロプロピル-
Y.3002	エチル	2	n-プロピル-
Y.3003	エチル	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.3004	エチル	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.3005	エチル	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.3006	エチル	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.3007	シクロプロピル	0	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3008	シクロプロピル	0	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3009	シクロプロピル	0	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3010	シクロプロピル	0	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3011	シクロプロピル	0	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3012	シクロプロピル	0	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3013	シクロプロピル	0	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3014	シクロプロピル	0	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3015	シクロプロピル	0	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3016	シクロプロピル	0	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3017	シクロプロピル	0	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.3018	シクロプロピル	0	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.3019	シクロプロピル	0	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.3020	シクロプロピル	0	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.3021	シクロプロピル	0	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3022	シクロプロピル	0	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.3023	シクロプロピル	0	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.3024	シクロプロピル	0	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.3025	シクロプロピル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3026	シクロプロピル	0	1-シアノシクロブチル-
Y.3027	シクロプロピル	0	1-シアノシクロペンチル-
Y.3028	シクロプロピル	0	1-シアノシクロプロピル-
Y.3029	シクロプロピル	0	1-フルオロプロパ-2-イル-

【0 1 2 8】

10

20

30

40

【表 5 8】

Y.3030	シクロプロピル	0	1-メチルアリル-
Y.3031	シクロプロピル	0	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.3032	シクロプロピル	0	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3033	シクロプロピル	0	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3034	シクロプロピル	0	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.3035	シクロプロピル	0	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3036	シクロプロピル	0	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3037	シクロプロピル	0	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3038	シクロプロピル	0	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.3039	シクロプロピル	0	2,3-ジクロロフェニル-
Y.3040	シクロプロピル	0	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.3041	シクロプロピル	0	2,4-ジクロロフェニル-
Y.3042	シクロプロピル	0	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.3043	シクロプロピル	0	2,4-ジメチルフェニル-
Y.3044	シクロプロピル	0	2,5-ジクロロフェニル-
Y.3045	シクロプロピル	0	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.3046	シクロプロピル	0	2,6-ジクロロフェニル-
Y.3047	シクロプロピル	0	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.3048	シクロプロピル	0	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.3049	シクロプロピル	0	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.3050	シクロプロピル	0	2-ブロモアリル-
Y.3051	シクロプロピル	0	2-ブロモフェニル-
Y.3052	シクロプロピル	0	2-ブテニル-
Y.3053	シクロプロピル	0	2-クロロアリル-
Y.3054	シクロプロピル	0	2-クロロフェニル-
Y.3055	シクロプロピル	0	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.3056	シクロプロピル	0	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.3057	シクロプロピル	0	2-シアノシクロプロピル-
Y.3058	シクロプロピル	0	2-シアノエチル-
Y.3059	シクロプロピル	0	2-エチルフェニル-
Y.3060	シクロプロピル	0	2-フルオロエチル-
Y.3061	シクロプロピル	0	2-フルオロ-フェニル-
Y.3062	シクロプロピル	0	2-フルオロプロピル-
Y.3063	シクロプロピル	0	2-フリルメチル-
Y.3064	シクロプロピル	0	2-ヒドロキシフェニル-
Y.3065	シクロプロピル	0	2-メトキシ-エチル-
Y.3066	シクロプロピル	0	2-メトキシフェニル-
Y.3067	シクロプロピル	0	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.3068	シクロプロピル	0	2-メチルアリル-
Y.3069	シクロプロピル	0	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3070	シクロプロピル	0	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3071	シクロプロピル	0	2-メチル-ブタ-3-イン-2-イル-
Y.3072	シクロプロピル	0	2-メチルフェニル-
Y.3073	シクロプロピル	0	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.3074	シクロプロピル	0	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.3075	シクロプロピル	0	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.3076	シクロプロピル	0	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.3077	シクロプロピル	0	2-ニトロフェニル-
Y.3078	シクロプロピル	0	2-プロピル-
Y.3079	シクロプロピル	0	2-ピリジル-
Y.3080	シクロプロピル	0	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.3081	シクロプロピル	0	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3082	シクロプロピル	0	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.3083	シクロプロピル	0	3,3,3-トリフルオロ-ブチル

10

20

30

40

【表 5 9】

Y.3084	シクロプロピル	0	3,3-ジプロモアリル-
Y.3085	シクロプロピル	0	3,3-ジクロロアリル-
Y.3086	シクロプロピル	0	3,4-ジクロロフェニル-
Y.3087	シクロプロピル	0	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.3088	シクロプロピル	0	3,5-ジクロロフェニル-
Y.3089	シクロプロピル	0	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.3090	シクロプロピル	0	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.3091	シクロプロピル	0	3-プロモアリル-
Y.3092	シクロプロピル	0	3-プロモフェニル-
Y.3093	シクロプロピル	0	3-ブテニル-
Y.3094	シクロプロピル	0	3-クロロアリル-
Y.3095	シクロプロピル	0	3-クロロフェニル-
Y.3096	シクロプロピル	0	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.3097	シクロプロピル	0	3-シアノプロピル-
Y.3098	シクロプロピル	0	3-エチルフェニル-
Y.3099	シクロプロピル	0	3-ヒドロキシフェニル-
Y.3100	シクロプロピル	0	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3101	シクロプロピル	0	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3102	シクロプロピル	0	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3103	シクロプロピル	0	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3104	シクロプロピル	0	3-メチルフェニル-
Y.3105	シクロプロピル	0	3-ニトロフェニル-
Y.3106	シクロプロピル	0	3-ピリジル-
Y.3107	シクロプロピル	0	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3108	シクロプロピル	0	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3109	シクロプロピル	0	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3110	シクロプロピル	0	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.3111	シクロプロピル	0	4-プロモフェニル-
Y.3112	シクロプロピル	0	4-クロロフェニル-
Y.3113	シクロプロピル	0	4-エチルフェニル-
Y.3114	シクロプロピル	0	4-フルオロ-フェニル-
Y.3115	シクロプロピル	0	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.3116	シクロプロピル	0	4-メトキシフェニル-
Y.3117	シクロプロピル	0	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3118	シクロプロピル	0	4-メチルフェニル-
Y.3119	シクロプロピル	0	4-メチルピリダ-2-イル
Y.3120	シクロプロピル	0	4-ニトロフェニル-
Y.3121	シクロプロピル	0	4-ピリジル-
Y.3122	シクロプロピル	0	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3123	シクロプロピル	0	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3124	シクロプロピル	0	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.3125	シクロプロピル	0	アリル-
Y.3126	シクロプロピル	0	ブタ-2-イニル-
Y.3127	シクロプロピル	0	ブタ-3-イニル-
Y.3128	シクロプロピル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3129	シクロプロピル	0	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3130	シクロプロピル	0	シアノジメチルメチル-
Y.3131	シクロプロピル	0	シアノエチル-
Y.3132	シクロプロピル	0	シアノメチル-
Y.3133	シクロプロピル	0	シクロベンチル-
Y.3134	シクロプロピル	0	シクロプロピル-メチル-
Y.3135	シクロプロピル	0	メチルプロパルギル-
Y.3136	シクロプロピル	0	オキセタン-3-イル-
Y.3137	シクロプロピル	0	ペンタ-3-イル-

10

20

30

40

【0130】

【表 60】

Y.3138	シクロプロピル	0	フェニル-メチル-メチル-
Y.3139	シクロプロピル	0	プロパルギル-
Y.3140	シクロプロピル	0	tert-ブチル-
Y.3141	シクロプロピル	0	テトラソリル-
Y.3142	シクロプロピル	0	チアゾール-2-イル-
Y.3143	シクロプロピル	0	チアゾール-4-イル-
Y.3144	シクロプロピル	0	チエタン-2-イルメチル-
Y.3145	シクロプロピル	0	チエタン-3-イルメチル-
Y.3146	シクロプロピル	0	エチル-
Y.3147	シクロプロピル	0	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.3148	シクロプロピル	0	ブタ-2-イル-
Y.3149	シクロプロピル	0	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.3150	シクロプロピル	0	ベンジル-
Y.3151	シクロプロピル	0	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3152	シクロプロピル	0	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.3153	シクロプロピル	0	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3154	シクロプロピル	0	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3155	シクロプロピル	0	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.3156	シクロプロピル	0	3-フルオロ-フェニル-
Y.3157	シクロプロピル	0	n-ブチル-
Y.3158	シクロプロピル	0	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.3159	シクロプロピル	0	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.3160	シクロプロピル	0	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3161	シクロプロピル	0	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.3162	シクロプロピル	0	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.3163	シクロプロピル	0	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3164	シクロプロピル	0	チエタン-3-イル-
Y.3165	シクロプロピル	0	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.3166	シクロプロピル	0	シクロブチル-
Y.3167	シクロプロピル	0	メチル-
Y.3168	シクロプロピル	0	シクロプロピル-
Y.3169	シクロプロピル	0	n-プロピル-
Y.3170	シクロプロピル	0	2,2-ジフルオロエチル-
Y.3171	シクロプロピル	0	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.3172	シクロプロピル	0	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.3173	シクロプロピル	0	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.3174	シクロプロピル	1	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3175	シクロプロピル	1	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3176	シクロプロピル	1	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3177	シクロプロピル	1	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3178	シクロプロピル	1	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3179	シクロプロピル	1	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3180	シクロプロピル	1	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3181	シクロプロピル	1	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3182	シクロプロピル	1	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3183	シクロプロピル	1	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3184	シクロプロピル	1	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.3185	シクロプロピル	1	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.3186	シクロプロピル	1	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-
Y.3187	シクロプロピル	1	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.3188	シクロプロピル	1	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3189	シクロプロピル	1	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.3190	シクロプロピル	1	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.3191	シクロプロピル	1	(チアゾール-5-イル)-メチル-

10

20

30

40

【表 6 1】

Y.3192	シクロプロピル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3193	シクロプロピル	1	1-シアノシクロブチル-
Y.3194	シクロプロピル	1	1-シアノシクロペンチル-
Y.3195	シクロプロピル	1	1-シアノシクロプロピル-
Y.3196	シクロプロピル	1	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.3197	シクロプロピル	1	1-メチルアリル-
Y.3198	シクロプロピル	1	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.3199	シクロプロピル	1	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3200	シクロプロピル	1	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3201	シクロプロピル	1	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.3202	シクロプロピル	1	2-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3203	シクロプロピル	1	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3204	シクロプロピル	1	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3205	シクロプロピル	1	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.3206	シクロプロピル	1	2,3-ジクロロフェニル-
Y.3207	シクロプロピル	1	2,3-ジフルオロ-フェニル-
Y.3208	シクロプロピル	1	2,4-ジクロロフェニル-
Y.3209	シクロプロピル	1	2,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.3210	シクロプロピル	1	2,4-ジメチルフェニル-
Y.3211	シクロプロピル	1	2,5-ジクロロフェニル-
Y.3212	シクロプロピル	1	2,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.3213	シクロプロピル	1	2,6-ジクロロフェニル-
Y.3214	シクロプロピル	1	2,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.3215	シクロプロピル	1	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.3216	シクロプロピル	1	2-プロモ-4-フルオロフェニル-
Y.3217	シクロプロピル	1	2-プロモアリル-
Y.3218	シクロプロピル	1	2-プロモフェニル-
Y.3219	シクロプロピル	1	2-ブテニル-
Y.3220	シクロプロピル	1	2-クロロアリル-
Y.3221	シクロプロピル	1	2-クロロフェニル-
Y.3222	シクロプロピル	1	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.3223	シクロプロピル	1	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.3224	シクロプロピル	1	2-シアノシクロプロピル-
Y.3225	シクロプロピル	1	2-シアノエチル-
Y.3226	シクロプロピル	1	2-エチルフェニル-
Y.3227	シクロプロピル	1	2-フルオロエチル-
Y.3228	シクロプロピル	1	2-フルオロ-フェニル-
Y.3229	シクロプロピル	1	2-フルオロプロピル-
Y.3230	シクロプロピル	1	2-フリルメチル-
Y.3231	シクロプロピル	1	2-ヒドロキシフェニル-
Y.3232	シクロプロピル	1	2-メトキシ-エチル-
Y.3233	シクロプロピル	1	2-メトキシフェニル-
Y.3234	シクロプロピル	1	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.3235	シクロプロピル	1	2-メチルアリル-
Y.3236	シクロプロピル	1	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3237	シクロプロピル	1	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3238	シクロプロピル	1	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.3239	シクロプロピル	1	2-メチルフェニル-
Y.3240	シクロプロピル	1	2-メチル-プロパ-1-イル-
Y.3241	シクロプロピル	1	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.3242	シクロプロピル	1	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.3243	シクロプロピル	1	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.3244	シクロプロピル	1	2-ニトロフェニル-
Y.3245	シクロプロピル	1	2-プロピル-

10

20

30

40

【表 6 2】

Y.3246	シクロプロピル	1	2-ピリジル-
Y.3247	シクロプロピル	1	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.3248	シクロプロピル	1	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3249	シクロプロピル	1	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.3250	シクロプロピル	1	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.3251	シクロプロピル	1	3,3-ジプロモアリル-
Y.3252	シクロプロピル	1	3,3-ジクロロアリル-
Y.3253	シクロプロピル	1	3,4-ジクロロフェニル-
Y.3254	シクロプロピル	1	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.3255	シクロプロピル	1	3,5-ジクロロフェニル-
Y.3256	シクロプロピル	1	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.3257	シクロプロピル	1	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.3258	シクロプロピル	1	3-プロモアリル-
Y.3259	シクロプロピル	1	3-プロモフェニル-
Y.3260	シクロプロピル	1	3-ブテニル-
Y.3261	シクロプロピル	1	3-クロロアリル-
Y.3262	シクロプロピル	1	3-クロロフェニル-
Y.3263	シクロプロピル	1	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.3264	シクロプロピル	1	3-シアノプロピル-
Y.3265	シクロプロピル	1	3-エチルフェニル-
Y.3266	シクロプロピル	1	3-ヒドロキシフェニル-
Y.3267	シクロプロピル	1	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3268	シクロプロピル	1	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3269	シクロプロピル	1	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3270	シクロプロピル	1	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3271	シクロプロピル	1	3-メチルフェニル-
Y.3272	シクロプロピル	1	3-ニトロフェニル-
Y.3273	シクロプロピル	1	3-ピリジル-
Y.3274	シクロプロピル	1	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3275	シクロプロピル	1	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3276	シクロプロピル	1	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3277	シクロプロピル	1	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.3278	シクロプロピル	1	4-プロモフェニル-
Y.3279	シクロプロピル	1	4-クロロフェニル-
Y.3280	シクロプロピル	1	4-エチルフェニル-
Y.3281	シクロプロピル	1	4-フルオロ-フェニル-
Y.3282	シクロプロピル	1	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.3283	シクロプロピル	1	4-メトキシフェニル-
Y.3284	シクロプロピル	1	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3285	シクロプロピル	1	4-メチルフェニル-
Y.3286	シクロプロピル	1	4-メチルピリダ-2-イル
Y.3287	シクロプロピル	1	4-ニトロフェニル-
Y.3288	シクロプロピル	1	4-ピリジル-
Y.3289	シクロプロピル	1	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3290	シクロプロピル	1	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3291	シクロプロピル	1	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.3292	シクロプロピル	1	アリル-
Y.3293	シクロプロピル	1	ブタ-2-イニル-
Y.3294	シクロプロピル	1	ブタ-3-イニル-
Y.3295	シクロプロピル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3296	シクロプロピル	1	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3297	シクロプロピル	1	シアノジメチルメチル-
Y.3298	シクロプロピル	1	シアノエチル-
Y.3299	シクロプロピル	1	シアノメチル-

【表 6 3】

Y.3300	シクロプロピル	1	シクロベンチル-
Y.3301	シクロプロピル	1	シクロプロピル-メチル-
Y.3302	シクロプロピル	1	メチルプロパルギル-
Y.3303	シクロプロピル	1	オキセタン-3-イル-
Y.3304	シクロプロピル	1	ペンタ-3-イル-
Y.3305	シクロプロピル	1	フェニル-メチル-メチル-
Y.3306	シクロプロピル	1	プロパルギル-
Y.3307	シクロプロピル	1	tert-ブチル-
Y.3308	シクロプロピル	1	テトラゾリル-
Y.3309	シクロプロピル	1	チアゾール-2-イル-
Y.3310	シクロプロピル	1	チアゾール-4-イル-
Y.3311	シクロプロピル	1	チエタン-2-イルメチル-
Y.3312	シクロプロピル	1	チエタン-3-イルメチル-
Y.3313	シクロプロピル	1	エチル-
Y.3314	シクロプロピル	1	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.3315	シクロプロピル	1	ブタ-2-イル-
Y.3316	シクロプロピル	1	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.3317	シクロプロピル	1	ベンジル-
Y.3318	シクロプロピル	1	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3319	シクロプロピル	1	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.3320	シクロプロピル	1	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3321	シクロプロピル	1	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3322	シクロプロピル	1	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.3323	シクロプロピル	1	3-フルオロ-フェニル-
Y.3324	シクロプロピル	1	n-ブチル-
Y.3325	シクロプロピル	1	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.3326	シクロプロピル	1	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.3327	シクロプロピル	1	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3328	シクロプロピル	1	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.3329	シクロプロピル	1	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.3330	シクロプロピル	1	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3331	シクロプロピル	1	チエタン-3-イル-
Y.3332	シクロプロピル	1	ビスク[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.3333	シクロプロピル	1	シクロブチル-
Y.3334	シクロプロピル	1	メチル-
Y.3335	シクロプロピル	1	シクロプロピル-
Y.3336	シクロプロピル	1	n-プロピル-
Y.3337	シクロプロピル	1	2,2-ジフルオロエチル-
Y.3338	シクロプロピル	1	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.3339	シクロプロピル	1	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.3340	シクロプロピル	1	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
Y.3341	シクロプロピル	2	(1,1-ジオキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3342	シクロプロピル	2	(1-オキソチエタン-2-イル)メチル-
Y.3343	シクロプロピル	2	(2-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3344	シクロプロピル	2	(3-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3345	シクロプロピル	2	(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3346	シクロプロピル	2	(4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3347	シクロプロピル	2	(4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3348	シクロプロピル	2	(4-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3349	シクロプロピル	2	(4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3350	シクロプロピル	2	(5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3351	シクロプロピル	2	(ピリダ-3-イル)-メチル-
Y.3352	シクロプロピル	2	(ピリダ-4-イル)-メチル-
Y.3353	シクロプロピル	2	(テトラヒドロチオフェン-2-イル)-メチル-

10

20

30

40

【表 6 4】

Y.3354	シクロプロピル	2	(テトラヒドロチオフェン-3-イル)-メチル-
Y.3355	シクロプロピル	2	(チアゾール-2-イル)-メチル-
Y.3356	シクロプロピル	2	(チアゾール-2-イル)-メチルメチル-
Y.3357	シクロプロピル	2	(チアゾール-4-イル)-メチル-
Y.3358	シクロプロピル	2	(チアゾール-5-イル)-メチル-
Y.3359	シクロプロピル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3360	シクロプロピル	2	1-シアノシクロブチル-
Y.3361	シクロプロピル	2	1-シアノシクロペンチル-
Y.3362	シクロプロピル	2	1-シアノシクロプロピル-
Y.3363	シクロプロピル	2	1-フルオロプロパ-2-イル-
Y.3364	シクロプロピル	2	1-メチルアリル-
Y.3365	シクロプロピル	2	1-メチルスルファニル-プロパ-2-イル-
Y.3366	シクロプロピル	2	2-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3367	シクロプロピル	2	2-(1-オキソチエタン-3-イル)エタニル-
Y.3368	シクロプロピル	2	2-(チエタン-3-イル)エタニル-
Y.3369	シクロプロピル	2	2-(トリフルオロメチル)フェニル-
Y.3370	シクロプロピル	2	2,2-ジメチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3371	シクロプロピル	2	2,2-ジメチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3372	シクロプロピル	2	2,2-ジメチルチエタン-3-イル-
Y.3373	シクロプロピル	2	2,3-ジクロロフェニル-
Y.3374	シクロプロピル	2	2,3-ジフルオロフェニル-
Y.3375	シクロプロピル	2	2,4-ジクロロフェニル-
Y.3376	シクロプロピル	2	2,4-ジフルオロフェニル-
Y.3377	シクロプロピル	2	2,4-ジメチルフェニル-
Y.3378	シクロプロピル	2	2,5-ジクロロフェニル-
Y.3379	シクロプロピル	2	2,5-ジフルオロフェニル-
Y.3380	シクロプロピル	2	2,6-ジクロロフェニル-
Y.3381	シクロプロピル	2	2,6-ジフルオロフェニル-
Y.3382	シクロプロピル	2	2,6-ジイソプロピルフェニル-
Y.3383	シクロプロピル	2	2-ブロモ-4-フルオロフェニル-
Y.3384	シクロプロピル	2	2-ブロモアリル-
Y.3385	シクロプロピル	2	2-ブロモフェニル-
Y.3386	シクロプロピル	2	2-ブテニル-
Y.3387	シクロプロピル	2	2-クロロアリル-
Y.3388	シクロプロピル	2	2-クロロフェニル-
Y.3389	シクロプロピル	2	2-クロロピリダ-2-イル-
Y.3390	シクロプロピル	2	2-クロロピリダ-3-イル-
Y.3391	シクロプロピル	2	2-シアノシクロプロピル-
Y.3392	シクロプロピル	2	2-シアノエチル-
Y.3393	シクロプロピル	2	2-エチルフェニル-
Y.3394	シクロプロピル	2	2-フルオロエチル-
Y.3395	シクロプロピル	2	2-フルオロフェニル-
Y.3396	シクロプロピル	2	2-フルオロプロピル-
Y.3397	シクロプロピル	2	2-フリルメチル-
Y.3398	シクロプロピル	2	2-ヒドロキシフェニル-
Y.3399	シクロプロピル	2	2-メトキシエチル-
Y.3400	シクロプロピル	2	2-メトキシフェニル-
Y.3401	シクロプロピル	2	2-メトキシ-プロパ-3-イル-
Y.3402	シクロプロピル	2	2-メチルアリル-
Y.3403	シクロプロピル	2	2-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3404	シクロプロピル	2	2-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3405	シクロプロピル	2	2-メチルブタ-3-イン-2-イル-
Y.3406	シクロプロピル	2	2-メチルフェニル-
Y.3407	シクロプロピル	2	2-メチル-プロパ-1-イル-

10

20

30

40

【表 6 5】

Y.3408	シクロプロピル	2	2-メチルスルファニル-エチル-
Y.3409	シクロプロピル	2	2-メチルスルファニル-プロパ-3-イル-
Y.3410	シクロプロピル	2	2-メチル-チアゾール-4-イル-
Y.3411	シクロプロピル	2	2-ニトロフェニル-
Y.3412	シクロプロピル	2	2-プロピル-
Y.3413	シクロプロピル	2	2-ピリジル-
Y.3414	シクロプロピル	2	2-トリフルオロメトキシ-エチル-
Y.3415	シクロプロピル	2	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3416	シクロプロピル	2	3,3,3-トリフルオロ-2,2-ジフルオロプロピル-
Y.3417	シクロプロピル	2	3,3,3-トリフルオロ-ブチル-
Y.3418	シクロプロピル	2	3,3-ジプロモアリル-
Y.3419	シクロプロピル	2	3,3-ジクロロアリル-
Y.3420	シクロプロピル	2	3,4-ジクロロフェニル-
Y.3421	シクロプロピル	2	3,4-ジフルオロ-フェニル-
Y.3422	シクロプロピル	2	3,5-ジクロロフェニル-
Y.3423	シクロプロピル	2	3,5-ジフルオロ-フェニル-
Y.3424	シクロプロピル	2	3,6-ジフルオロ-フェニル-
Y.3425	シクロプロピル	2	3-プロモアリル-
Y.3426	シクロプロピル	2	3-プロモフェニル-
Y.3427	シクロプロピル	2	3-ブテニル-
Y.3428	シクロプロピル	2	3-クロロアリル-
Y.3429	シクロプロピル	2	3-クロロフェニル-
Y.3430	シクロプロピル	2	3-クロロピリダ-2-イル-
Y.3431	シクロプロピル	2	3-シアノプロピル-
Y.3432	シクロプロピル	2	3-エチルフェニル-
Y.3433	シクロプロピル	2	3-ヒドロキシフェニル-
Y.3434	シクロプロピル	2	3-メチル-1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3435	シクロプロピル	2	3-メチル-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3436	シクロプロピル	2	3-メチル-ブタ-1-イル-
Y.3437	シクロプロピル	2	3-メチル-ブタ-2-イル-
Y.3438	シクロプロピル	2	3-メチルフェニル-
Y.3439	シクロプロピル	2	3-ニトロフェニル-
Y.3440	シクロプロピル	2	3-ピリジル-
Y.3441	シクロプロピル	2	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-
Y.3442	シクロプロピル	2	4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3443	シクロプロピル	2	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3444	シクロプロピル	2	4,5-ジメチル-チアゾール-2-イル-
Y.3445	シクロプロピル	2	4-プロモフェニル-
Y.3446	シクロプロピル	2	4-クロロフェニル-
Y.3447	シクロプロピル	2	4-エチルフェニル-
Y.3448	シクロプロピル	2	4-フルオロ-フェニル-
Y.3449	シクロプロピル	2	4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル-
Y.3450	シクロプロピル	2	4-メトキシフェニル-
Y.3451	シクロプロピル	2	4-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3452	シクロプロピル	2	4-メチルフェニル-
Y.3453	シクロプロピル	2	4-メチルピリダ-2-イル
Y.3454	シクロプロピル	2	4-ニトロフェニル-
Y.3455	シクロプロピル	2	4-ピリジル-
Y.3456	シクロプロピル	2	5-メチル-4,5-ジヒドロチアゾール-2-イル-
Y.3457	シクロプロピル	2	5-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3458	シクロプロピル	2	6-メチルピリダ-2-イル-
Y.3459	シクロプロピル	2	アリル-
Y.3460	シクロプロピル	2	ブタ-2-イル-
Y.3461	シクロプロピル	2	ブタ-3-イル-

10

20

30

40

【表 6 6】

Y.3462	シクロプロピル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3463	シクロプロピル	2	シス-1-オキソ-チエタン-3-イルメチル-
Y.3464	シクロプロピル	2	シアノジメチルメチル-
Y.3465	シクロプロピル	2	シアノエチル-
Y.3466	シクロプロピル	2	シアノメチル-
Y.3467	シクロプロピル	2	シクロベンチル-
Y.3468	シクロプロピル	2	シクロプロピル-メチル-
Y.3469	シクロプロピル	2	メチルプロパルギル-
Y.3470	シクロプロピル	2	オキセタン-3-イル-
Y.3471	シクロプロピル	2	ペンタ-3-イル-
Y.3472	シクロプロピル	2	フェニル-メチル-メチル-
Y.3473	シクロプロピル	2	プロパルギル-
Y.3474	シクロプロピル	2	tert-ブチル-
Y.3475	シクロプロピル	2	テトラソリル-
Y.3476	シクロプロピル	2	チアゾール-2-イル-
Y.3477	シクロプロピル	2	チアゾール-4-イル-
Y.3478	シクロプロピル	2	チエタン-2-イルメチル-
Y.3479	シクロプロピル	2	チエタン-3-イルメチル-
Y.3480	シクロプロピル	2	エチル-
Y.3481	シクロプロピル	2	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
Y.3482	シクロプロピル	2	ブタ-2-イル-
Y.3483	シクロプロピル	2	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
Y.3484	シクロプロピル	2	ベンジル-
Y.3485	シクロプロピル	2	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
Y.3486	シクロプロピル	2	1-フェニル-エタ-1-イル-
Y.3487	シクロプロピル	2	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
Y.3488	シクロプロピル	2	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
Y.3489	シクロプロピル	2	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
Y.3490	シクロプロピル	2	3-フルオロ-フェニル-
Y.3491	シクロプロピル	2	n-ブチル-
Y.3492	シクロプロピル	2	(ピリダ-2-イル)-メチル-
Y.3493	シクロプロピル	2	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル-
Y.3494	シクロプロピル	2	4-メチル-チアゾール-2-イル-
Y.3495	シクロプロピル	2	3-メチル-チエタン-3-イル-
Y.3496	シクロプロピル	2	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
Y.3497	シクロプロピル	2	1-オキソ-チエタン-3-イル-
Y.3498	シクロプロピル	2	チエタン-3-イル-
Y.3499	シクロプロピル	2	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
Y.3500	シクロプロピル	2	シクロブチル-
Y.3501	シクロプロピル	2	メチル-
Y.3502	シクロプロピル	2	シクロプロピル-
Y.3503	シクロプロピル	2	n-プロピル-
Y.3504	シクロプロピル	2	2,2-ジフルオロエチル-
Y.3505	シクロプロピル	2	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
Y.3506	シクロプロピル	2	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
Y.3507	シクロプロピル	2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-

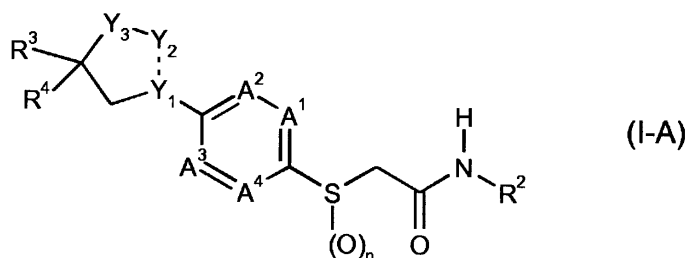
10

20

30

40

【化 18】



10

表 1

表 1 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-O-であり、A₂ が CH であり、A₃ が CH であり、A₄ が CH であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0138】

表 2

表 2 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-O-であり、A₂ が CH であり、A₃ が CH であり、A₄ が CH であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0139】

表 3

表 3 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-O-であり、A₂ が CH であり、A₃ が CH であり、A₄ が CH であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0140】

表 4

表 4 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-O-であり、A₂ が CH であり、A₃ が N であり、A₄ が CH であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0141】

表 5

表 5 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-CH₂-であり、A₂ が CH であり、A₃ が CH であり、A₄ が CH であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0142】

表 6

表 6 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R₃ がトリフルオロメチルであり、R₄ が 3, 5-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃ が、-C=N-CH₂-であり、A₂ が CH であり、A₃ が CH であり、A₄ が N であり、R_{5b}、n および R₂ が、表 Y に列挙される値を有する。

【0143】

表 7

20

30

40

50

表7は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0144】

表8

表8は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0145】

表9

表9は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0146】

表10

表10は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0147】

表11

表11は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0148】

表12

表12は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0149】

表13

表13は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0150】

表14

表14は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0151】

表15

表15は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C

50

H-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0152】

表16

表16は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=CH-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0153】

表17

表17は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0154】

表18

表18は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0155】

表19

表19は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0156】

表20

表20は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0157】

表21

表21は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0158】

表22

表22は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0159】

表23

表23は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0160】

表24

表24は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0161】

表25

表25は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0162】

表26

表26は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0163】

表27

表27は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0164】

表28

表28は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0165】

表29

表29は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0166】

表30

表30は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0167】

表31

表31は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0168】

表32

50

表 3 2 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 2, 6-ビス (トリフルオロメチル) -4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0169】

表 3 3

表 3 3 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

10

【0170】

表 3 4

表 3 4 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0171】

表 3 5

表 3 5 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

20

【0172】

表 3 6

表 3 6 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0173】

表 3 7

表 3 7 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

30

【0174】

表 3 8

表 3 8 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

40

【0175】

表 3 9

表 3 9 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-CH₂-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0176】

表 4 0

表 4 0 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3

50

が、 $-C=N-CH_2-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0177】

表41

表41は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0178】

表42

表42は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0179】

表43

表43は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0180】

表44

表44は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0181】

表45

表45は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0182】

表46

表46は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0183】

表47

表47は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0184】

表48

表48は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がトリフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0185】

表49

表49は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0186】

表50

表50は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0187】

表51

表51は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0188】

表52

表52は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0189】

表53

表53は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0190】

表54

表54は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0191】

表55

表55は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0192】

表56

表56は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0193】

表57

50

表57は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0194】

表58

表58は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0195】

表59

表59は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0196】

表60

表60は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0197】

表61

表61は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0198】

表62

表62は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0199】

表63

表63は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0200】

表64

表64は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0201】

表65

表65は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N

50

ーOーであり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0202】

表66

表66は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-ーOーであり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0203】

表67

表67は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-ーOーであり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0204】

表68

表68は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0205】

表69

表69は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0206】

表70

表70は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0207】

表71

表71は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0208】

表72

表72は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0209】

表73

表73は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がトリフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0210】

表74

表74は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0211】

表75

表75は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0212】

表76

表76は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0213】

表77

表77は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0214】

表78

表78は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0215】

表79

表79は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0216】

表80

表80は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0217】

表81

表81は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0218】

表82

50

表 8 2 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 1 9】

表 8 3

表 8 3 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

10

【0 2 2 0】

表 8 4

表 8 4 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 1】

表 8 5

表 8 5 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-CH 2-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

20

【0 2 2 2】

表 8 6

表 8 6 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-CH 2-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 3】

表 8 7

表 8 7 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-CH 2-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

30

【0 2 2 4】

表 8 8

表 8 8 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-CH 2-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

40

【0 2 2 5】

表 8 9

表 8 9 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-N-CH 2-CH 2-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 6】

表 9 0

表 9 0 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4-ジクロロフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-N-C

50

H 2 - C H 2 - であり、A 2 が C H であり、A 3 が N であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 7】

表 9 1

表 9 1 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- N - C H 2 - C H 2 - であり、A 2 が C H であり、A 3 が N であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 8】

表 9 2

表 9 2 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- N - C H 2 - C H 2 - であり、A 2 が C H であり、A 3 が C H であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 2 9】

表 9 3

表 9 3 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = C H - O - であり、A 2 が C H であり、A 3 が C H であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 3 0】

表 9 4

表 9 4 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = C H - O - であり、A 2 が C H であり、A 3 が N であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 3 1】

表 9 5

表 9 5 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = C H - O - であり、A 2 が C H であり、A 3 が C H であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 3 2】

表 9 6

表 9 6 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3, 4 - ジクロロフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = C H - O - であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 3 3】

表 9 7

表 9 7 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3 - クロロ - 5 - ブロモフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = N - O - であり、A 2 が C H であり、A 3 が C H であり、A 4 が C H であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0 2 3 4】

表 9 8

表 9 8 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルーであり、R 4 が 3 - クロロ - 5 - ブロモフェニルーであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、- C = N - O - であり、A 2 が C H であり、A 3 が C H であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0235】

表99

表99は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0236】

表100

表100は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0237】

表101

表101は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0238】

表102

表102は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0239】

表103

表103は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0240】

表104

表104は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0241】

表105

表105は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0242】

表106

表106は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0243】

表107

50

表107は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0244】

表108

表108は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0245】

表109

表109は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0246】

表110

表110は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0247】

表111

表111は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0248】

表112

表112は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0249】

表113

表113は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0250】

表114

表114は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0251】

表115

表115は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が

50

、 $-C=N-O-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0252】

表 116

表 116 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0253】

表 117

表 117 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0254】

表 118

表 118 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0255】

表 119

表 119 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0256】

表 120

表 120 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0257】

表 121

表 121 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0258】

表 122

表 122 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0259】

表 123

表 123 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がトリフルオロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0260】

表124

表124は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0261】

表125

表125は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0262】

表126

表126は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0263】

表127

表127は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0264】

表128

表128は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0265】

表129

表129は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0266】

表130

表130は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0267】

表131

表131は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0268】

表132

50

表132は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0269】

表133

表133は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0270】

表134

表134は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0271】

表135

表135は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0272】

表136

表136は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0273】

表137

表137は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0274】

表138

表138は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0275】

表139

表139は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0276】

表140

表140は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1

50

—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0277】

表141

表141は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0278】

表142

表142は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0279】

表143

表143は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0280】

表144

表144は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0281】

表145

表145は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0282】

表146

表146は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0283】

表147

表147は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0284】

表148

表148は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—O—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0285】

表149

表149は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0286】

表150

表150は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0287】

表151

表151は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0288】

表152

表152は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0289】

表153

表153は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0290】

表154

表154は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0291】

表155

表155は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0292】

表156

表156は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0293】

表157

50

表157は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0294】

表158

表158は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0295】

表159

表159は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0296】

表160

表160は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0297】

表161

表161は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0298】

表162

表162は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0299】

表163

表163は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0300】

表164

表164は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0301】

表165

表165は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、

50

—C=N—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0302】

表166

表166は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0303】

表167

10

表167は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0304】

表168

表168は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0305】

表169

表169は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0306】

表170

表170は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0307】

表171

表171は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0308】

表172

40

表172は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0309】

表173

表173は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

50

【0310】

表174

表174は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0311】

表175

表175は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0312】

表176

表176は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0313】

表177

表177は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0314】

表178

表178は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0315】

表179

表179は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0316】

表180

表180は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0317】

表181

表181は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0318】

表182

50

表182は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0319】

表183

表183は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0320】

表184

表184は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0321】

表185

表185は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0322】

表186

表186は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0323】

表187

表187は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0324】

表188

表188は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0325】

表189

表189は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0326】

表190

表190は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y

50

2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0327】

表191

表191は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0328】

表192

表192は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0329】

表193

表193は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0330】

表194

表194は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0331】

表195

表195は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0332】

表196

表196は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0333】

表197

表197は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0334】

表198

表198は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0335】

表199

表199は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0336】

表200

表200は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0337】

表201

表201は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0338】

表202

表202は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0339】

表203

表203は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0340】

表204

表204は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0341】

表205

表205は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0342】

表206

表206は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0343】

表207

50

表207は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0344】

表208

表208は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0345】

表209

表209は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0346】

表210

表210は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0347】

表211

表211は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0348】

表212

表212は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0349】

表213

表213は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0350】

表214

表214は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0351】

表215

表215は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、

50

—C=N—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0352】

表216

表216は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0353】

表217

表217は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0354】

表218

表218は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0355】

表219

表219は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0356】

表220

表220は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0357】

表221

表221は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0358】

表222

表222は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0359】

表223

表223は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がトリフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=CH—O—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0360】

表224

表224は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がトリフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0361】

表225

表225は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0362】

表226

表226は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0363】

表227

表227は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0364】

表228

表228は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0365】

表229

表229は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0366】

表230

表230は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0367】

表231

表231は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0368】

表232

50

表232は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0369】

表233

表233は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0370】

表234

表234は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0371】

表235

表235は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0372】

表236

表236は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0373】

表237

表237は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0374】

表238

表238は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0375】

表239

表239は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0376】

表240

表240は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-

50

C = CH-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0377】

表241

表241は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0378】

表242

表242は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0379】

表243

表243は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0380】

表244

表244は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0381】

表245

表245は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0382】

表246

表246は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0383】

表247

表247は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0384】

表248

表248は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0385】

表249

表249は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0386】

表250

表250は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0387】

表251

表251は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0388】

表252

表252は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0389】

表253

表253は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0390】

表254

表254は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0391】

表255

表255は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0392】

表256

表256は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0393】

表257

50

表257は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0394】

表258

表258は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0395】

表259

表259は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0396】

表260

表260は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0397】

表261

表261は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0398】

表262

表262は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0399】

表263

表263は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0400】

表264

表264は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0401】

表265

表265は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2

50

—Y 3が、—N—CH₂—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0402】

表266

表266は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—N—CH₂—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0403】

表267

表267は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—N—CH₂—CH₂—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0404】

表268

表268は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—N—CH₂—CH₂—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0405】

表269

表269は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0406】

表270

表270は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0407】

表271

表271は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0408】

表272

表272は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0409】

表273

表273は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0410】

表274

表274は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0411】

表275

表275は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0412】

表276

表276は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0413】

表277

表277は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0414】

表278

表278は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0415】

表279

表279は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0416】

表280

表280は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0417】

表281

表281は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0418】

表282

50

表282は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0419】

表283

表283は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0420】

表284

表284は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0421】

表285

表285は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0422】

表286

表286は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0423】

表287

表287は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0424】

表288

表288は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0425】

表289

表289は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0426】

表290

表290は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-

50

C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0427】

表291

表291は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0428】

表292

10

表292は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0429】

表293

表293は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0430】

表294

表294は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0431】

表295

表295は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0432】

表296

表296は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0433】

表297

40

表297は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0434】

表298

表298は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

50

【0435】

表299

表299は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0436】

表300

表300は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0437】

表301

表301は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0438】

表302

表302は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0439】

表303

表303は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0440】

表304

表304は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0441】

表305

表305は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0442】

表306

表306は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0443】

表307

50

表307は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0444】

表308

表308は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0445】

表309

表309は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0446】

表310

表310は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0447】

表311

表311は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0448】

表312

表312は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0449】

表313

表313は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0450】

表314

表314は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0451】

表315

表315は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-

50

N-CH₂-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0452】

表316

表316は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3,4-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0453】

表317

表317は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3,4-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0454】

表318

表318は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3,4-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0455】

表319

表319は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3,4-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0456】

表320

表320は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3,4-ジクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0457】

表321

表321は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0458】

表322

表322は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-O-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0459】

表323

表323は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロクロロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0460】

表324

表324は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0461】

表325

表325は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0462】

表326

表326は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0463】

表327

表327は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0464】

表328

表328は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0465】

表329

表329は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0466】

表330

表330は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0467】

表331

表331は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0468】

表332

50

表 3 3 2 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0469】

表 3 3 3

表 3 3 3 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

10

【0470】

表 3 3 4

表 3 3 4 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0471】

表 3 3 5

表 3 3 5 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

20

【0472】

表 3 3 6

表 3 3 6 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=CH-O-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0473】

表 3 3 7

表 3 3 7 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

30

【0474】

表 3 3 8

表 3 3 8 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

40

【0475】

表 3 3 9

表 3 3 9 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、-C=N-O-であり、A 2 が N であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0476】

表 3 4 0

表 3 4 0 は、式 (I-A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y

50

3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0477】

表 341

表 341 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0478】

表 342

表 342 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0479】

表 343

表 343 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0480】

表 344

表 344 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が N であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0481】

表 345

表 345 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0482】

表 346

表 346 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0483】

表 347

表 347 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が N であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0484】

表 348

表 348 は、式 (I-A) の 3507 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロクロロメチルであり、R 4 が 3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3 が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、A 2 が CH であり、A 3 が CH であり、A 4 が CH であり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0485】

表349

表349は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0486】

表350

表350は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0487】

表351

表351は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0488】

表352

表352は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0489】

表353

表353は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0490】

表354

表354は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0491】

表355

表355は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0492】

表356

表356は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0493】

表357

50

表357は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0494】

表358

表358は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0495】

表359

表359は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0496】

表360

表360は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0497】

表361

表361は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0498】

表362

表362は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0499】

表363

表363は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0500】

表364

表364は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0501】

表365

表365は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、

50

Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0502】

表366

表366は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0503】

表367

表367は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0504】

表368

表368は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0505】

表369

表369は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0506】

表370

表370は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0507】

表371

表371は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0508】

表372

表372は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0509】

表373

表373は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0510】

表374

表374は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0511】

表375

表375は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0512】

表376

表376は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0513】

表377

表377は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0514】

表378

表378は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0515】

表379

表379は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0516】

表380

表380は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0517】

表381

表381は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0518】

表382

50

表382は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0519】

表383

表383は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0520】

表384

表384は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0521】

表385

表385は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0522】

表386

表386は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0523】

表387

表387は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0524】

表388

表388は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0525】

表389

表389は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0526】

表390

表390は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3

50

が、 $-C=N-CH_2-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0527】

表391

表391は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0528】

表392

表392は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0529】

表393

表393は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0530】

表394

表394は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0531】

表395

表395は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0532】

表396

表396は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0533】

表397

表397は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0534】

表398

表398は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0535】

表399

表399は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0536】

表400

表400は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0537】

表401

表401は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0538】

表402

表402は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0539】

表403

表403は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0540】

表404

表404は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0541】

表405

表405は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0542】

表406

表406は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0543】

表407

50

表407は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0544】

表408

表408は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0545】

表409

表409は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0546】

表410

表410は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0547】

表411

表411は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0548】

表412

表412は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0549】

表413

表413は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0550】

表414

表414は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0551】

表415

表415は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1

50

—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0552】

表416

表416は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0553】

表417

表417は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0554】

表418

表418は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0555】

表419

表419は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0556】

表420

表420は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0557】

表421

表421は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0558】

表422

表422は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0559】

表423

表423は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロクロロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0560】

表424

表424は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0561】

表425

表425は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0562】

表426

表426は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0563】

表427

表427は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0564】

表428

表428は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0565】

表429

表429は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0566】

表430

表430は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0567】

表431

表431は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0568】

表432

50

表432は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0569】

表433

表433は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0570】

表434

表434は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0571】

表435

表435は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0572】

表436

表436は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0573】

表437

表437は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0574】

表438

表438は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0575】

表439

表439は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0576】

表440

表440は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロクロロメチルであり、R4が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3

50

が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0577】

表441

表441は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0578】

表442

表442は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0579】

表443

表443は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0580】

表444

表444は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0581】

表445

表445は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0582】

表446

表446は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0583】

表447

表447は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0584】

表448

表448は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロクロロメチルであり、 R_4 が2,6-ジクロロ-4-ピリジルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_5b 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0585】

表449

表449は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0586】

表450

表450は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0587】

表451

表451は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0588】

表452

表452は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0589】

表453

表453は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0590】

表454

表454は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0591】

表455

表455は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0592】

表456

表456は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0593】

表457

50

表457は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0594】

表458

表458は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0595】

表459

表459は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0596】

表460

表460は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0597】

表461

表461は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0598】

表462

表462は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0599】

表463

表463は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0600】

表464

表464は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3, 5-ジクロロフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0601】

表465

表465は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1

50

—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0602】

表466

表466は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0603】

表467

表467は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0604】

表468

表468は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0605】

表469

表469は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0606】

表470

表470は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0607】

表471

表471は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0608】

表472

表472は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0609】

表473

表473は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が2, 6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y 1—Y 2—Y 3が、—N—CH₂—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0610】

表474

表474は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0611】

表475

表475は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0612】

表476

表476は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0613】

表477

表477は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0614】

表478

表478は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0615】

表479

表479は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0616】

表480

表480は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2,6-ビス(トリフルオロメチル)-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0617】

表481

表481は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3,5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0618】

表482

50

表482は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0619】

表483

表483は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0620】

表484

表484は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0621】

表485

表485は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0622】

表486

表486は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0623】

表487

表487は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0624】

表488

表488は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0625】

表489

表489は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0626】

表490

表490は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3

50

が、 $-C=N-CH_2-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0627】

表491

表491は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0628】

表492

表492は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0629】

表493

表493は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がNであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0630】

表494

表494は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-N-CH_2-CH_2-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0631】

表495

表495は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0632】

表496

表496は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3, 5-ジクロロ-4-ブロモフェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=CH-O-$ であり、 A_2 がNであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0633】

表497

表497は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がCHであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

【0634】

表498

表498は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、 R_3 がジフルオロメチルであり、 R_4 が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $-C=N-O-$ であり、 A_2 がCHであり、 A_3 がNであり、 A_4 がCHであり、 R_{5b} 、 n および R_2 が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0635】

表499

表499は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0636】

表500

表500は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0637】

表501

表501は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0638】

表502

表502は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0639】

表503

表503は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0640】

表504

表504は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0641】

表505

表505は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0642】

表506

表506は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0643】

表507

50

表507は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0644】

表508

表508は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0645】

表509

表509は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0646】

表510

表510は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0647】

表511

表511は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0648】

表512

表512は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0649】

表513

表513は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0650】

表514

表514は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0651】

表515

表515は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3,5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N

50

ーOーであり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0652】

表516

表516は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0653】

表517

表517は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0654】

表518

表518は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0655】

表519

表519は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-CH 2-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0656】

表520

表520は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH 2-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0657】

表521

表521は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH 2-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0658】

表522

表522は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH 2-CH 2-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0659】

表523

表523は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルーであり、R 4が3, 5-ジブロモフェニルーであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-N-CH 2-CH 2-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0660】

表524

表524は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C
H-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0661】

表525

表525は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C
H-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0662】

表526

表526は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C
H-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0663】

表527

表527は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C
H-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0664】

表528

表528は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C
H-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0665】

表529

表529は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N
-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0666】

表530

表530は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N
-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0667】

表531

表531は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N
-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0668】

表532

50

表532は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0669】

表533

表533は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0670】

表534

表534は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0671】

表535

表535は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0672】

表536

表536は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0673】

表537

表537は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0674】

表538

表538は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0675】

表539

表539は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0676】

表540

表540は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=C

50

H-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0677】

表541

表541は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=CH-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0678】

表542

10

表542は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=CH-O-であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0679】

表543

表543は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=CH-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0680】

表544

表544は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3, 4-ジクロロフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=CH-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0681】

表545

表545は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0682】

表546

表546は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0683】

表547

40

表547は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0684】

表548

表548は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、-C=N-O-であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、n およびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

50

【0685】

表549

表549は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0686】

表550

表550は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0687】

表551

表551は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0688】

表552

表552は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0689】

表553

表553は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0690】

表554

表554は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0691】

表555

表555は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0692】

表556

表556は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルーであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルーであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0693】

表557

50

表557は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH₂-CH₂-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0694】

表558

表558は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0695】

表559

表559は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0696】

表560

表560は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-ブロモフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0697】

表561

表561は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0698】

表562

表562は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0699】

表563

表563は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0700】

表564

表564は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0701】

表565

表565は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、

50

—C=N—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0702】

表566

表566は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—C=N—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0703】

表567

表567は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0704】

表568

表568は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0705】

表569

表569は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0706】

表570

表570は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0707】

表571

表571は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0708】

表572

表572は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0709】

表573

表573は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y₁—Y₂—Y₃が、—N—CH₂—CH₂—であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0710】

表574

表574は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0711】

表575

表575は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0712】

表576

表576は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=CH-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0713】

表577

表577は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0714】

表578

表578は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-O-$ であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0715】

表579

表579は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0716】

表580

表580は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0717】

表581

表581は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0718】

表582

50

表582は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0719】

表583

表583は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0720】

表584

表584は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0721】

表585

表585は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0722】

表586

表586は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0723】

表587

表587は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0724】

表588

表588は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0725】

表589

表589は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0726】

表590

表590は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-

50

Y 2 - Y 3 が、 $-C=CH-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0727】

表 5 9 1

表 5 9 1 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=CH-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0728】

表 5 9 2

表 5 9 2 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=CH-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0729】

表 5 9 3

表 5 9 3 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がNであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0730】

表 5 9 4

表 5 9 4 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がNであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0731】

表 5 9 5

表 5 9 5 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がNであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0732】

表 5 9 6

表 5 9 6 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-O-$ であり、A 2 がNであり、A 3 がNであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0733】

表 5 9 7

表 5 9 7 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がNであり、A 4 がCHであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0734】

表 5 9 8

表 5 9 8 は、式 (I - A) の 3 5 0 7 種の化合物を示し、式中、R 3 がジフルオロメチルであり、R 4 が 3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニルであり、Y 1 - Y 2 - Y 3 が、 $-C=N-CH_2-$ であり、A 2 がCHであり、A 3 がCHであり、A 4 がNであり、R 5 b、n および R 2 が、表 Y に列挙される値を有する。

【0735】

表599

表599は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0736】

表600

表600は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0737】

表601

表601は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0738】

表602

表602は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0739】

表603

表603は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0740】

表604

表604は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0741】

表605

表605は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0742】

表606

表606は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0743】

表607

50

表607は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0744】

表608

表608は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ジクロロ-4-フルオロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0745】

表609

表609は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0746】

表610

表610は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0747】

表611

表611は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0748】

表612

表612は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0749】

表613

表613は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0750】

表614

表614は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0751】

表615

表615は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-

50

C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0752】

表616

表616は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0753】

表617

表617は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0754】

表618

表618は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0755】

表619

表619は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=N-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0756】

表620

表620は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0757】

表621

表621は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0758】

表622

表622は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0759】

表623

表623は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

10

20

30

40

50

【0760】

表624

表624は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 4, 5-トリクロロフェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0761】

表625

表625は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0762】

表626

表626は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0763】

表627

表627は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0764】

表628

表628は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0765】

表629

表629は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0766】

表630

表630は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0767】

表631

表631は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0768】

表632

50

表632は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0769】

表633

表633は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0770】

表634

表634は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0771】

表635

表635は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0772】

表636

表636は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0773】

表637

表637は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0774】

表638

表638は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0775】

表639

表639は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0776】

表640

表640は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2

50

—Y 3が、—C=CH—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0777】

表641

表641は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0778】

表642

表642は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0779】

表643

表643は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0780】

表644

表644は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0781】

表645

表645は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0782】

表646

表646は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—O—であり、A 2がNであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0783】

表647

表647は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がNであり、A 4がCHであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0784】

表648

表648は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R 3がジフルオロメチルであり、R 4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y 1-Y 2-Y 3が、—C=N—CH₂—であり、A 2がCHであり、A 3がCHであり、A 4がNであり、R 5 b、nおよびR 2が、表Yに列挙される値を有する。

【0785】

表649

表649は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0786】

表650

表650は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0787】

表651

表651は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0788】

表652

表652は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0789】

表653

表653は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-N-CH2-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0790】

表654

表654は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0791】

表655

表655は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0792】

表656

表656は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が3-(トリフルオロメチル)フェニルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=CH-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0793】

表657

50

表657は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0794】

表658

表658は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

10

【0795】

表659

表659は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0796】

表660

表660は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-O-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

20

【0797】

表661

表661は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0798】

表662

表662は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

30

【0799】

表663

表663は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がCHであり、A3がCHであり、A4がNであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

40

【0800】

表664

表664は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-C=N-CH2-であり、A2がNであり、A3がNであり、A4がCHであり、R5b、nおよびR2が、表Yに列挙される値を有する。

【0801】

表665

表665は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R3がジフルオロメチルであり、R4が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y1-Y2-Y3が、-

50

C = N - CH₂ - であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0802】

表666

表666は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0803】

表667

表667は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0804】

表668

表668は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0805】

表669

表669は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がNであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0806】

表670

表670は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-N-CH₂-CH₂-であり、A₂がNであり、A₃がNであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0807】

表671

表671は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0808】

表672

表672は、式(I-A)の3507種の化合物を示し、式中、R₃がジフルオロメチルであり、R₄が2, 6-ジクロロ-4-ピリジルであり、Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-であり、A₂がCHであり、A₃がCHであり、A₄がCHであり、R_{5b}、nおよびR₂が、表Yに列挙される値を有する。

【0809】

表IA~12Aには、特に興味深い化合物が開示されている。

【0810】

表1A

表1Aは、式Iaの116種の化合物を示し、式中、R²およびR^{5b}が、表Xに定義されるとおりである。

10

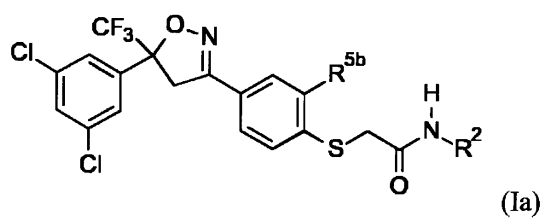
20

30

40

50

【化 1 9】



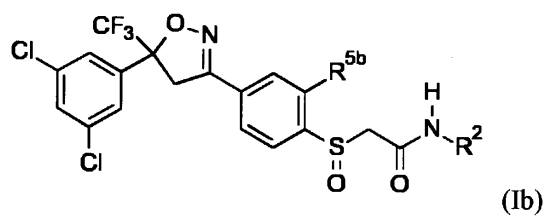
10

【 0 8 1 1 】

表 2 A

表 2 A は、式 I b の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

【化 2 0】



20

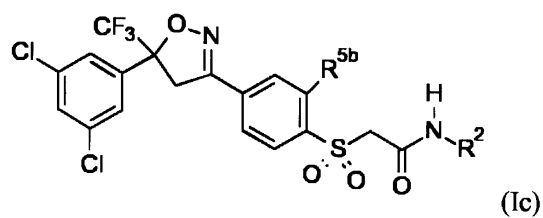
【 0 8 1 2 】

表 3 A

表 3 は、式 I c の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

30

【化 2 1】



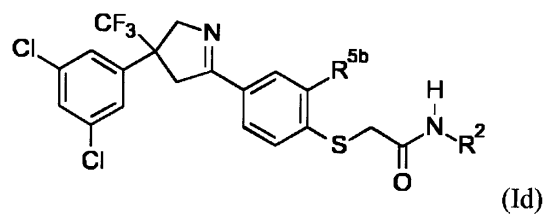
40

【 0 8 1 3 】

表 4 A

表 4 A は、式 I d の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

【化 2 2】



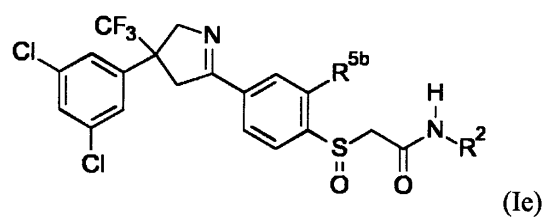
10

【0814】

表 5 A

表 5 A は、式 I e の 1 1 6 種の化合物を示し、式中、 R^2 および R^{5b} が、表 X に定義されたとおりである。

【化 2 3】



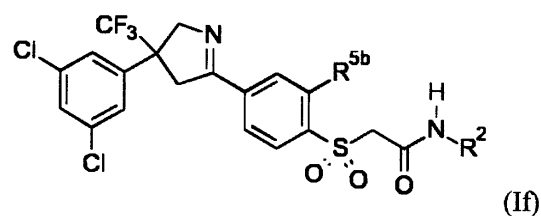
20

【0815】

表 6 A

表 6 A は、式 I f の 1 1 6 種の化合物を示し、式中、 R^2 および R^{5b} が、表 X に定義されたとおりである。

【化 2 4】



30

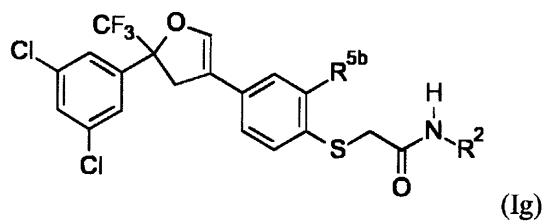
【0816】

表 7 A

表 7 A は、式 I g の 1 1 6 種の化合物を示し、式中、 R^2 および R^{5b} が、表 X に定義されたとおりである。

40

【化 2 5】



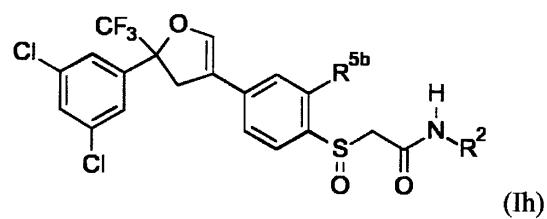
10

【 0 8 1 7 】

表 8 A

表 8 A は、式 I h の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

【化 2 6】



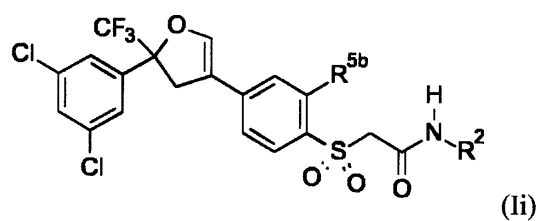
20

【 0 8 1 8 】

表 9 A

表 9 A は、式 I i の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

【化 2 7】



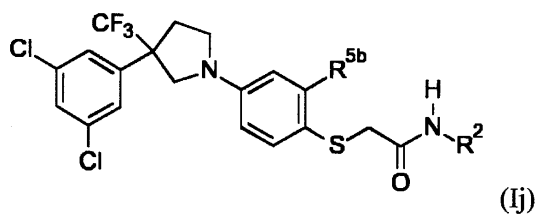
40

【 0 8 1 9 】

表 1 0 A

表 1 0 A は、式 I j の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 さ れ る と お り で あ る。

【化 2 8】



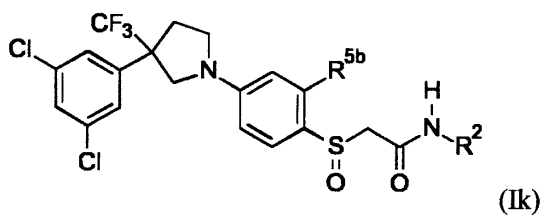
10

【 0 8 2 0】

表 1 1 A

表 1 1 A は、式 I k の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 され る と お り で あ る。

【化 2 9】



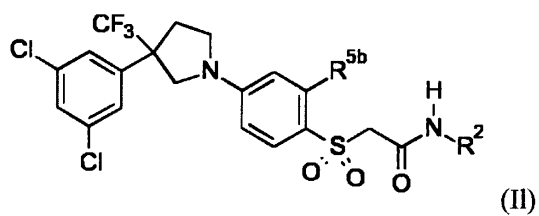
20

【 0 8 2 1】

表 1 2 A

表 1 2 A は、式 I l の 1 1 6 種 の 化 合 物 を 示 し、式 中、 R^2 お よ び R^{5b} が、表 X に 定 義 され る と お り で あ る。

【化 3 0】



40

【 0 8 2 2】

【表 6 7】

表 X

	R ^{5b}	R ²
X.1	F	エチル-
X.2	F	n-ブチル-
X.3	F	メチル-
X.4	F	シクロプロピル-
X.5	F	n-プロピル
X.6	F	2,2-ジフルオロエチル
X.7	F	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
X.8	F	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
X.9	F	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.10	F	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
X.11	F	ブタ-2-イル-
X.12	F	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-

10

【0 8 2 3】

【表 6 8】

X.13	F	フェニル-メチル-
X.14	F	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
X.15	F	1-フェニル-エタ-1-イル-
X.16	F	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
X.17	F	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
X.18	F	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
X.19	F	3-フルオロ-フェニル-
X.20	F	(ピリダ-2-イル)-メチル-
X.21	F	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
X.22	F	4-メチル-チアゾール-2-イル-
X.23	F	3-メチル-チエタン-3-イル-
X.24	F	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
X.25	F	1-オキソ-チエタン-3-イル-
X.26	F	チエタン-3-イル-
X.27	F	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
X.28	F	シクロブチル-
X.29	F	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.30	Cl	エチル-
X.31	Cl	ブチル-
X.32	Cl	メチル-
X.33	Cl	シクロプロピル-
X.34	Cl	n-プロピル
X.35	Cl	2,2-ジフルオロエチル
X.36	Cl	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
X.37	Cl	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
X.38	Cl	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.39	Cl	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
X.40	Cl	ブタ-2-イル-
X.41	Cl	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
X.42	Cl	フェニル-メチル-
X.43	Cl	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
X.44	Cl	1-フェニル-エタ-1-イル-
X.45	Cl	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
X.46	Cl	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
X.47	Cl	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
X.48	Cl	3-フルオロ-フェニル-
X.49	Cl	(ピリダ-2-イル)-メチル-
X.50	Cl	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
X.51	Cl	4-メチル-チアゾール-2-イル-
X.52	Cl	3-メチル-チエタン-3-イル-
X.53	Cl	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
X.54	Cl	1-オキソ-チエタン-3-イル-
X.55	Cl	チエタン-3-イル-
X.56	Cl	ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
X.57	Cl	シクロブチル-
X.58	Cl	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.59	Br	エチル-
X.60	Br	ブチル-
X.61	Br	メチル-
X.62	Br	シクロプロピル-
X.63	Br	n-プロピル
X.64	Br	2,2-ジフルオロエチル
X.65	Br	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
X.66	Br	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル

10

20

30

40

【表 6 9】

X.67	Br	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.68	Br	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
X.69	Br	ブタ-2-イル-
X.70	Br	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
X.71	Br	フェニル-メチル-
X.72	Br	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
X.73	Br	1-フェニル-エタ-1-イル-
X.74	Br	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
X.75	Br	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
X.76	Br	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
X.77	Br	3-フルオロ-フェニル-
X.78	Br	(ピリダ-2-イル)-メチル-
X.79	Br	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
X.80	Br	4-メチル-チアゾール-2-イル-
X.81	Br	3-メチル-チエタン-3-イル-
X.82	Br	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
X.83	Br	1-オキソ-チエタン-3-イル-
X.84	Br	チエタン-3-イル-
X.85	Br	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
X.86	Br	シクロブチル-
X.87	Br	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.88	CH ₃	エチル-
X.89	CH ₃	ブチル-
X.90	CH ₃	メチル-
X.91	CH ₃	シクロプロピル-
X.92	CH ₃	n-プロピル
X.93	CH ₃	2,2-ジフルオロエチル
X.94	CH ₃	1-メトキシ-プロパ-2-イル-
X.95	CH ₃	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アセトアミド-2-イル
X.96	CH ₃	2,2,2-トリフルオロ-エチル-
X.97	CH ₃	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-
X.98	CH ₃	ブタ-2-イル-
X.99	CH ₃	(テトラヒドロフラン-2-イル)-メチル-
X.100	CH ₃	フェニル-メチル-
X.101	CH ₃	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-
X.102	CH ₃	1-フェニル-エタ-1-イル-
X.103	CH ₃	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-
X.104	CH ₃	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-
X.105	CH ₃	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)-メチル-
X.106	CH ₃	3-フルオロ-フェニル-
X.107	CH ₃	(ピリダ-2-イル)-メチル-
X.108	CH ₃	1,3-ジメチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル-
X.109	CH ₃	4-メチル-チアゾール-2-イル-
X.110	CH ₃	3-メチル-チエタン-3-イル-
X.111	CH ₃	1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル-エチル
X.112	CH ₃	1-オキソ-チエタン-3-イル-
X.113	CH ₃	チエタン-3-イル-
X.114	CH ₃	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-
X.115	CH ₃	シクロブチル-
X.116	CH ₃	2,2,2-トリフルオロ-エチル-

10

20

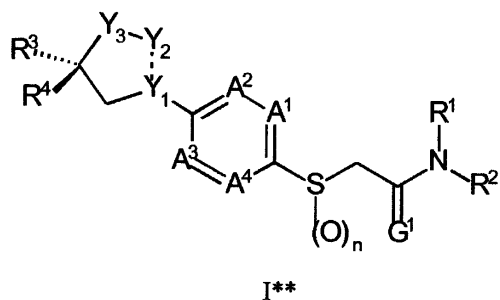
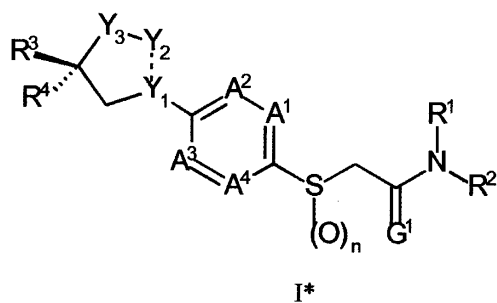
30

40

【0825】

式 I の化合物は、少なくとも 1 つのキラル中心を含み、式 I^{*} の化合物または式 I^{**} の化合物として存在し得る。

【化 3 1】



10

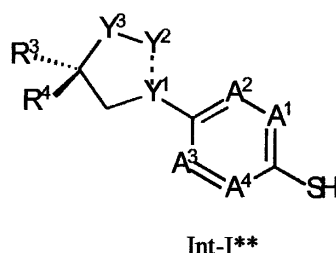
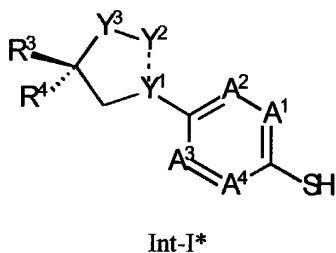
表 1 ~ 6 9 2 および表 1 A ~ 表 1 2 A に列挙される各化合物は、式 I * の化合物に対応する特定の開示および式 I I * * の化合物に対応する特定の開示を表す。式 I * * の化合物は、式 I * の化合物より生物学的に活性である。本発明は、任意の比率、例えば 1 : 9 9 ~ 9 9 : 1、例えば 1 0 : 1 ~ 1 : 1 0 のモル比、例えば実質的に 5 0 : 5 0 のモル比における化合物 I * および I * * の混合物を含む。式 I * * のエナンチオマー的に（またはエピマー的に（*epimerically*））濃縮された混合物において、両方のエナンチオマー（またはエピマー）の総量と比較した化合物 I * * のモル比は、例えば 5 0 %、例えば少なく

20

【0 8 2 6】

同様に、式 I n t - I の化合物は、式 I n t - I * および I n t - I * * の化合物として存在し得る。

【化 3 2】



30

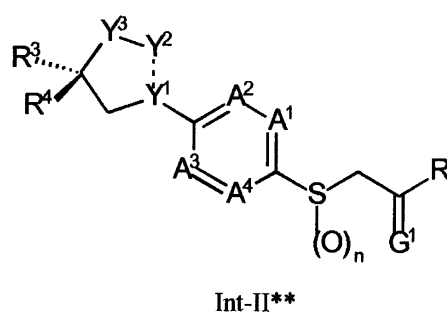
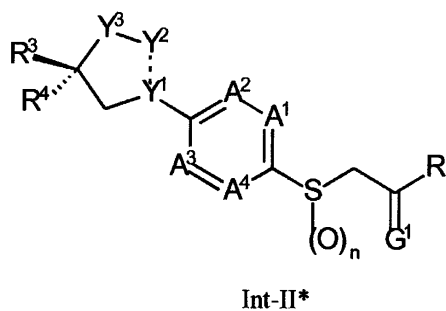
本発明は、任意の比率、例えば 1 : 9 9 ~ 9 9 : 1、例えば 1 0 : 1 ~ 1 : 1 0 のモル比、例えば実質的に 5 0 : 5 0 のモル比における化合物 I n t - I * および I n t - I * * の混合物を含む。式 I n t - I * * のエナンチオマー的に（またはエピマー的に）濃縮された混合物において、両方のエナンチオマー（またはエピマー）の総量と比較した化合物 I n t - I * * のモル比は、例えば 5 0 %、例えば少なくとも 5 5、6 0、6 5、7 0、7 5、8 0、8 5、9 0、9 5、9 6、9 7、9 8 または少なくとも 9 9 % を超える。式 I n t - I * * のエナンチオマー的に（またはエピマー的に）濃縮された混合物が好ましい。

40

【0 8 2 7】

同様に、式 I n t - I I の化合物は、式 I n t - I I * および I n t - I I * * の化合物として存在し得る。

【化 3 3】



10

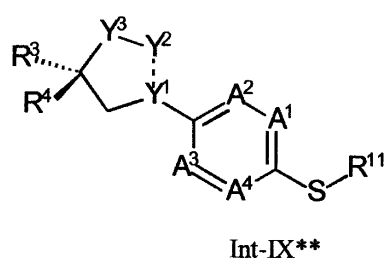
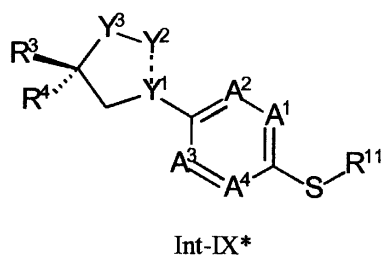
本発明は、任意の比率、例えば 1 : 99 ~ 99 : 1、例えば 10 : 1 ~ 1 : 10 のモル比、例えば、実質的に 50 : 50 のモル比における化合物 Int-I* および Int-I** の混合物を含む。式 Int-I** のエナンチオマー的に（またはエピマー的に）濃縮された混合物において、両方のエナンチオマー（またはエピマー）の総量と比較した化合物 Int-I** のモル比は、例えば 50 %、例えば少なくとも 55、60、65、70、75、80、85、90、95、96、97、98 または少なくとも 99 % を超える。

20

【0828】

同様に、式 Int-IX の化合物は、式 Int-IX* および Int-IX** の化合物として存在し得る。

【化 3 4】



30

本発明は、任意の比率、例えば 1 : 99 ~ 99 : 1、例えば 10 : 1 ~ 1 : 10 のモル比、例えば、実質的に 50 : 50 のモル比における化合物 Int-IX* および Int-IX** の混合物を含む。式 Int-IX** のエナンチオマー的に（またはエピマー的に）濃縮された混合物において、両方のエナンチオマー（またはエピマー）の総量と比較した化合物 Int-IX** のモル比は、例えば 50 %、例えば少なくとも 55、60、65、70、75、80、85、90、95、96、97、98 または少なくとも 99 % を超える。

40

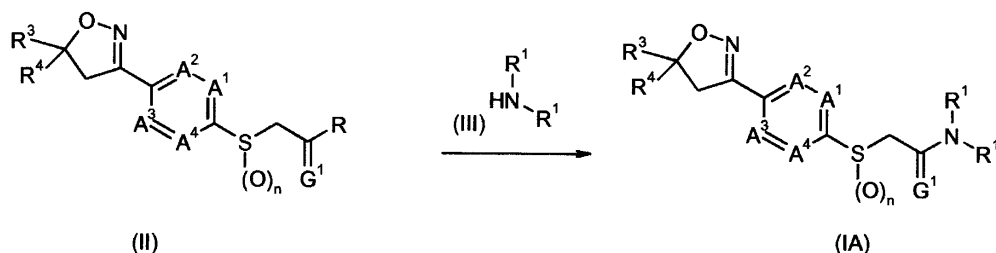
【0829】

本発明の化合物は、以下のスキームに示される様々な方法によって作製され得る。

【0830】

スキーム 1

【化 3 5】



10

1) 式 (I A) (式中、 G^1 が酸素である) の化合物は、式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシまたは Cl 、 F または Br である) の化合物を、スキーム 1 に示される式 (I I I) のアミンと反応させることによって調製することができる。 R が OH である場合、このような反応は、通常、 N 、 N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド (「 DCC 」)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (「 EDC 」) またはビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスホン酸クロリド (「 BOP-Cl 」) などのカップリング試薬の存在下で、塩基の存在下で、および場合により、ヒドロキシベンゾトリアゾール (「 HOBt 」) などの求核触媒の存在下で行われる。 R が Cl である場合、このような反応は、通常、塩基の存在下で、および場合により、求核触媒の存在下で行われる。あるいは、有機溶媒、好ましくは酢酸エチル、および水性溶媒、好ましくは炭酸水素ナトリウムの溶液を含む二相系中で反応を行うことが可能である。 R が $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシである場合、エステルおよびアミンを熱処理において一緒に加熱することによって、エステルを直接アミドに変換することができることがある。好適な塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、4-(ジメチルアミノ)-ピリジン (「 DMAp 」) またはジイソプロピルエチルアミン (ヒューニッヒ塩基) が挙げられる。好ましい溶媒は、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、酢酸エチルおよびトルエンである。反応は、 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ 、好ましくは $15^\circ\text{C} \sim 30^\circ\text{C}$ の温度、特に、周囲温度で行われる。式 (I I I) のアミンは、文献において公知であり、または当業者に公知の方法を用いて調製することができる。これらの方法のいくつかは、調製実施例に記載されている。

20

30

【0831】

2) 式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 Cl 、 F または Br である) の酸ハロゲン化物は、例えば国際公開第 2009/080250 号パンフレットに記載されるように、標準条件下で、式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が OH である) のカルボン酸から作製され得る。

【0832】

3) 式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が OH である) のカルボン酸は、例えば国際公開第 2009/080250 号パンフレットに記載されるように、式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシである) のエステルから形成され得る。

40

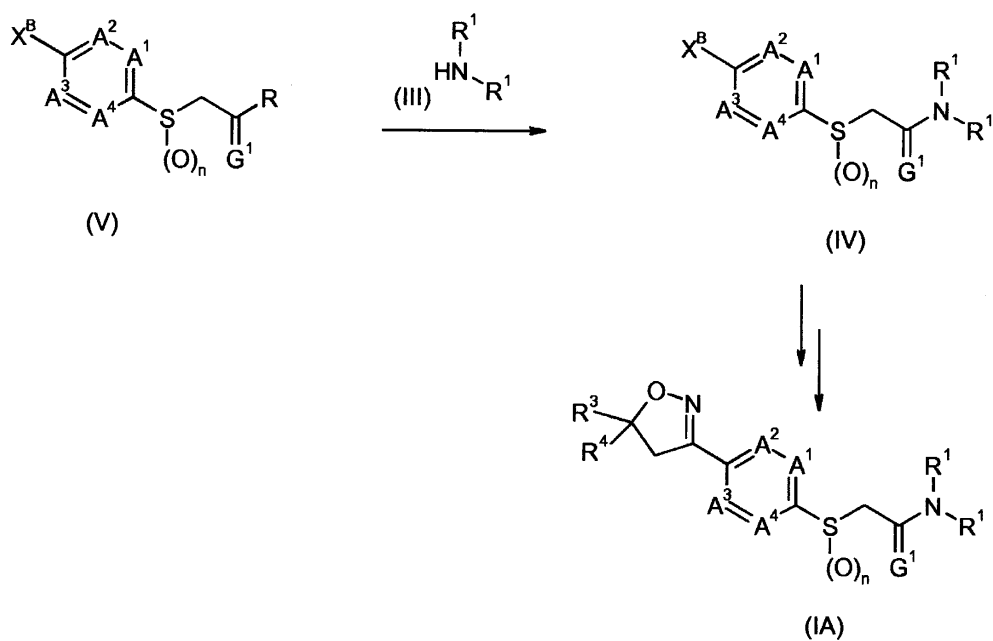
【0833】

4) 式 (I A) (式中、 G^1 が硫黄である) の化合物は、1) で記載されているように、式 (I) の化合物の生成の前に、ローソン試薬または五硫化リンなどのチオ基転移剤による、式 (I I) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシまたは Cl 、 F または Br である) の化合物の処理によって作製され得る。

【0834】

スキーム 2

【化 3 6】



5) あるいは、式 (I A) (式中、 G^1 が酸素である) の化合物は、国際公開第 2009/080250 号パンフレットに記載される方法と同様の方法にしたがって、スキーム 2 に示される式 (I V) (式中、 G^1 が酸素であり、 X^B が、脱離基、例えば、ブロモなどのハロゲンであり、または X^B が、シアノ、ホルミルまたはアセチルである) の中間体から、様々な方法によって調製することができる。式 (I V) の中間体は、スキーム 1 に記載されるように、例えば式 (V) の中間体から調製することができる。

【0835】

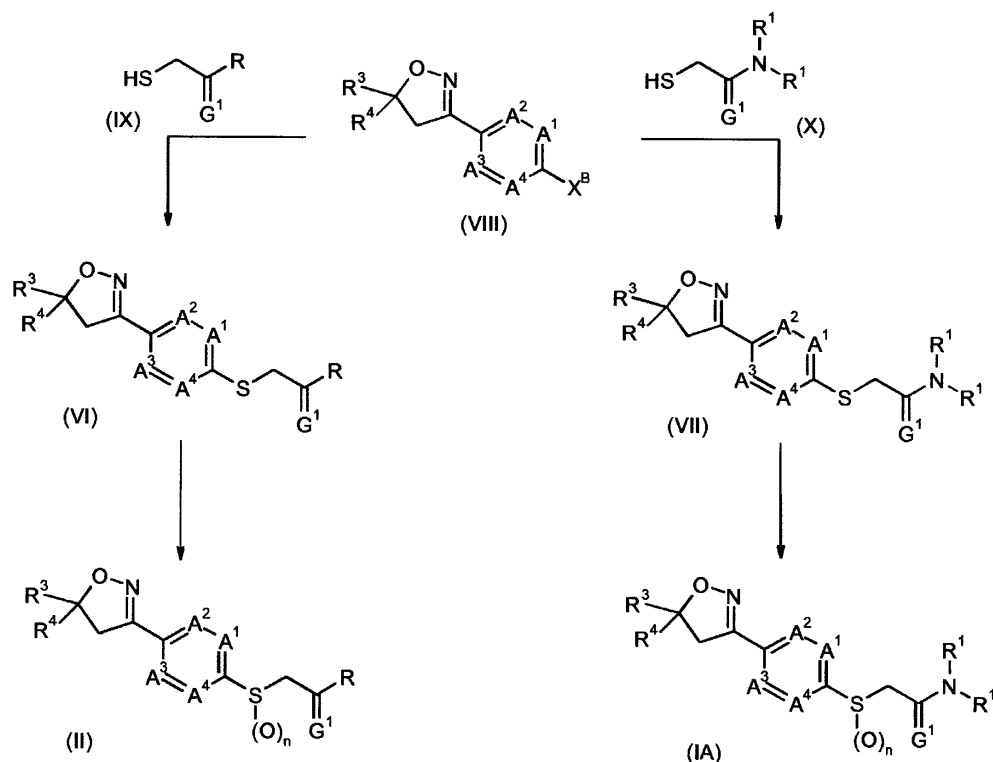
スキーム 3

10

20

30

【化 3 7】



6) 式 (I A) および (I I) (式中、G¹が酸素であり、Rが、OHまたはC₁~C₆アルコキシであり、nが1または2である)の化合物は、式 (V I) および (V I I) (式中、G¹が酸素である)の化合物の酸化によって、それぞれ調製することができる。このような反応は、過マンガン酸カリウム、3-クロロペルオキシ安息香酸(「MCPBA」)、過ヨウ素酸ナトリウム/ルテニウム (I I) オキシド、過酸化水素、オキソソおよび次亜塩素酸ナトリウムなどの酸化剤による処理によって行うことができる。硫化物をスルホキシドに、またはスルホキシドをスルホンに変換するのに、1当量の酸化剤が必要とされる。硫化物をスルホンに変換するのに、2当量の酸化剤が必要とされる。好ましい溶媒は、エタノール、メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタン、酢酸エチル、トルエン、ジクロロメタンおよび水、またはそれらの混合物である。反応は、場合により、塩基、例えば、炭酸水素ナトリウムなどの炭酸塩の存在下で行われる。反応は、0℃~100℃、好ましくは15℃~30℃の温度、特に、周囲温度で行われる。

【0836】

7) 式 (V I) (式中、G¹が酸素であり、Rが、OHまたはC₁~C₆アルコキシであり、nが1または2である)の化合物は、式 (V I I I) (式中、X^Bが、脱離基、例えば、フルオロ、クロロまたはブromoなどのハロゲンである)の中間体を、式 (I X) (式中、Rが、OHまたはC₁~C₆アルコキシ、例えばメトキシまたはtert-ブチルオキシである)のメルカプタンと反応させることによって調製することができる。このような反応は、0℃~150℃、好ましくは25℃~100℃の温度で、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセトアミドなどの溶媒中、アミンあるいは、例えば炭酸カリウムまたは炭酸セシウムなどの炭酸塩などの塩基の存在下で行うことができる。このような反応の例は、Synlett 2006, 8, 1255-1259に見られ、具体例が、実験の項に記載されている。あるいは、反応は、0℃~150℃、好ましくは80℃~130℃の温度で、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2

ージメトキシエタン、酢酸エチル、またはトルエンなどの溶媒中、触媒、例えばパラジウム触媒、およびリガンド、例えばホスフィンリガンドの存在下で行うことができる。この反応は、例えば国際公開第2007102059号パンフレットに記載されるように、マイクロ波照射下で行うことができ、具体例が、実験の項に記載されている。

【0837】

8) 同様に、式(VII) (式中、 G^1 が酸素であり、 n が1または2である)の化合物は、式(VIII) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、フルオロ、クロロまたはブロモなどのハロゲンである)の中間体を、式(X)のメルカプタンと反応させることによって調製することができる。

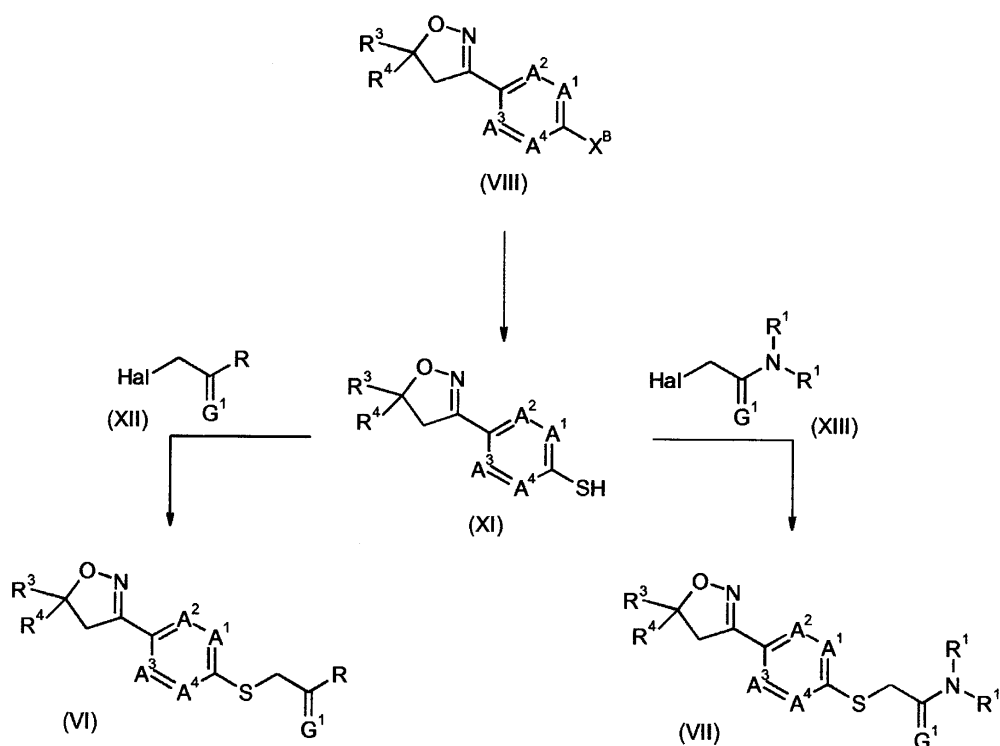
【0838】

9) 式(IX)および(X)の化合物は、チオグリコール酸メチルなどの公知の化合物であるか、または当業者に公知の方法によって調製することができる。

【0839】

スキーム4

【化38】



10) あるいは、式(VI) (式中、 G^1 が酸素であり、 R が、OHまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシである)の化合物は、式(XII) (式中、 Hal が、クロロまたはブロモである)の試薬による、式(XI)の中間体のアルキル化によって調製することができる。このような反応は、例えばJournal of Organic Chemistry, 45(24), 4961-5; 1980に記載されるよく確立された方法で行うことができる。

【0840】

11) 同様に、式(VII) (式中、 G^1 が酸素である)の化合物は、式(XIII) (式中、 Hal が、クロロまたはブロモである)の試薬による、式(XI)の中間体のアルキル化によって調製することができる。

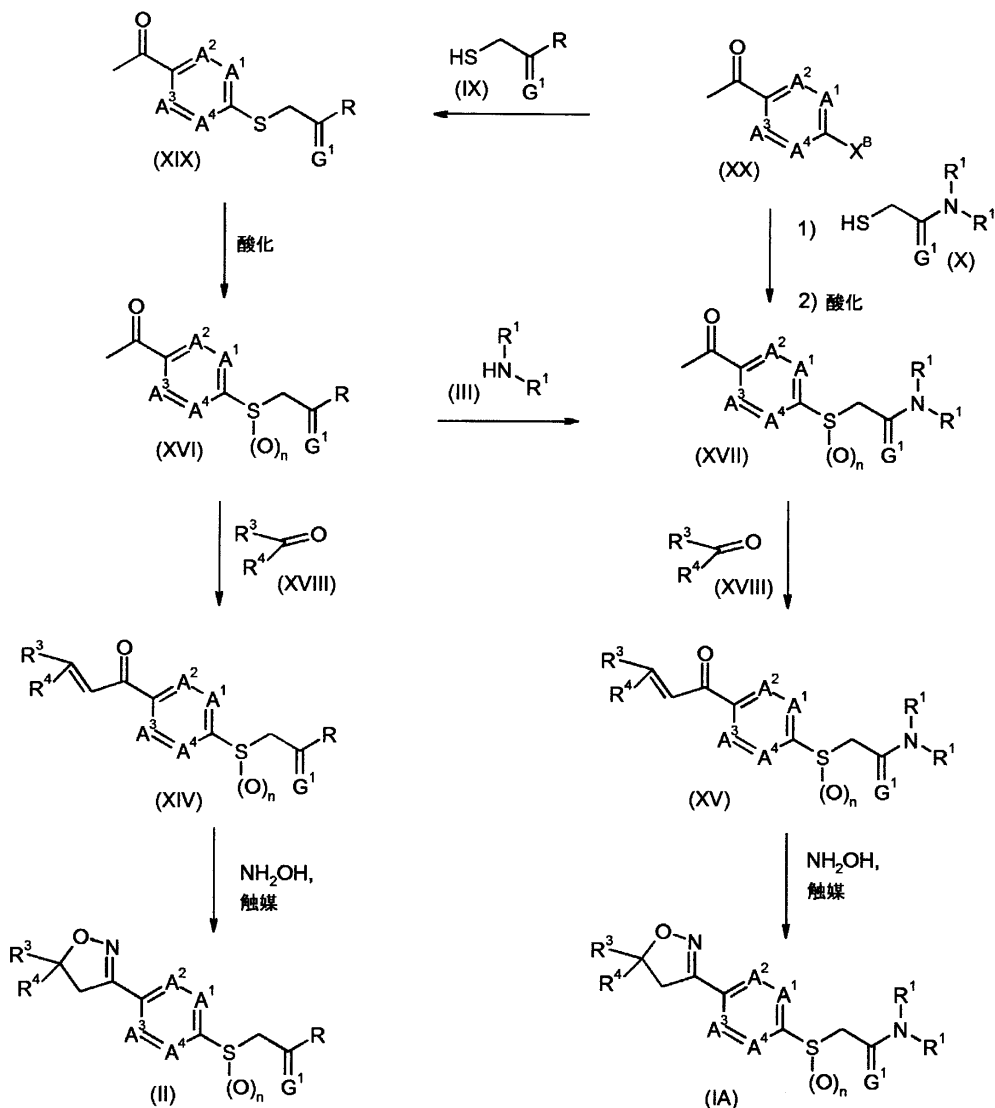
【0841】

12) 式(XI)の化合物は、式(VIII) (式中、 X^B が、クロロ、ブロモ、ヨードなどのハロゲンである)の中間体と、銅、ニッケルおよびパラジウムなどの遷移金属触媒と、硫黄、チオ尿素、およびチオ硫酸アルカリなどの硫黄源との反応によって調製することができる。このような反応は、例えば米国特許第5338886号明細書(Niおよびチオ尿素)、Tetrahedron Letters (2011), 52, 205-208 (パラジウムおよびチオ尿素) および Chinese Journal of Chemistry (2010), 28, 1441-1443 (銅およびチオ尿素)に記載されるよく確立された方法で行うことができる。あるいは、式(XI)の化合物は、50℃~180℃の温度における、式(VIII) (式中、 X^B が、フルオロおよびクロロなどのハロゲンである)の中間体と、過剰なナトリウムチオレートなどのアルカリアルキルチオレートとの反応によって調製することができる。この反応は、例えば Synthesis (1983), (9), 751-5に記載されるように行うことができる。

【0842】

スキーム5

【化39】



13) スキーム1~4に記載される方法にしたがって調製され得る式(XVI) (式中

10

20

30

40

50

、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである）の化合物は、例えば国際公開第2009/080250号パンフレットに記載される方法にしたがって、式（XVII）のケトンとの反応によって、式（XIV）（式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである）の化合物に変換され得る。

【0843】

14）同様に、式（XV）（式中、 G^1 が酸素である）の化合物は、スキーム1～4に記載される方法にしたがって得られる式（XVII）（式中、 G^1 が酸素である）の化合物から得られる。

【0844】

15）続いて、式（XIV）（式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである）の化合物は、例えば国際公開第09080250号パンフレットに記載されるように、ヒドロキシルアミン、塩基および相間移動触媒による処理によって、式（II）（式中、 G^1 が酸素であり、 R が、 OH または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである）の化合物へと変換され得る。

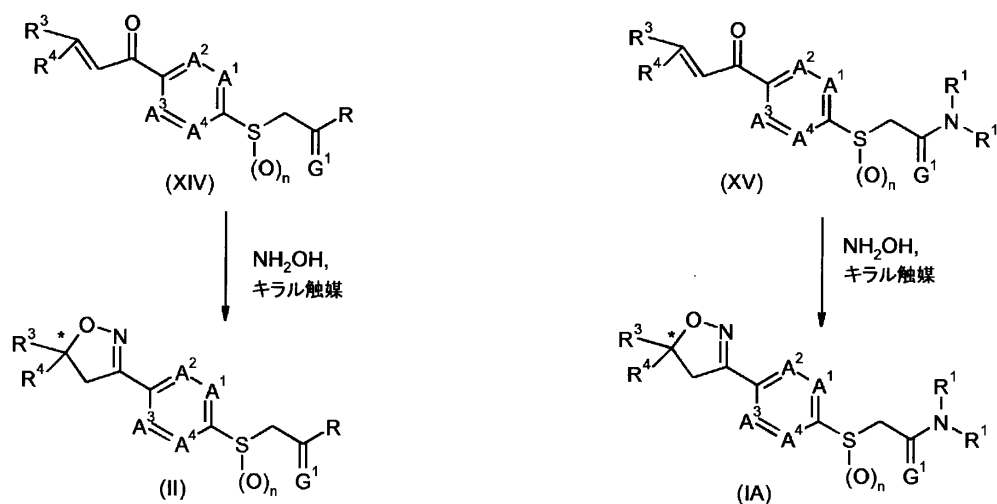
【0845】

16）同様に、式（XV）（式中、 G^1 が酸素である）の化合物は、式（IA）（式中、 G^1 が酸素である）の化合物へと変換され得る。

【0846】

スキーム6

【化40】



17）式（IA）および（II）の化合物は、ラセミ化合物のキラル分離またはスキーム6に示されるキラル触媒の使用によって、エナンチオマー的に濃縮された混合物として得られる。このような触媒は、例えばキラル相間移動触媒、好ましくはキニーネ誘導体、例えば式XXI

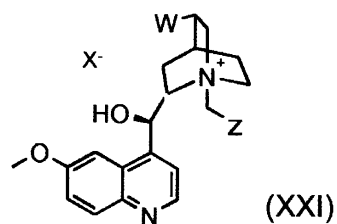
10

20

30

40

【化 4 1】



10

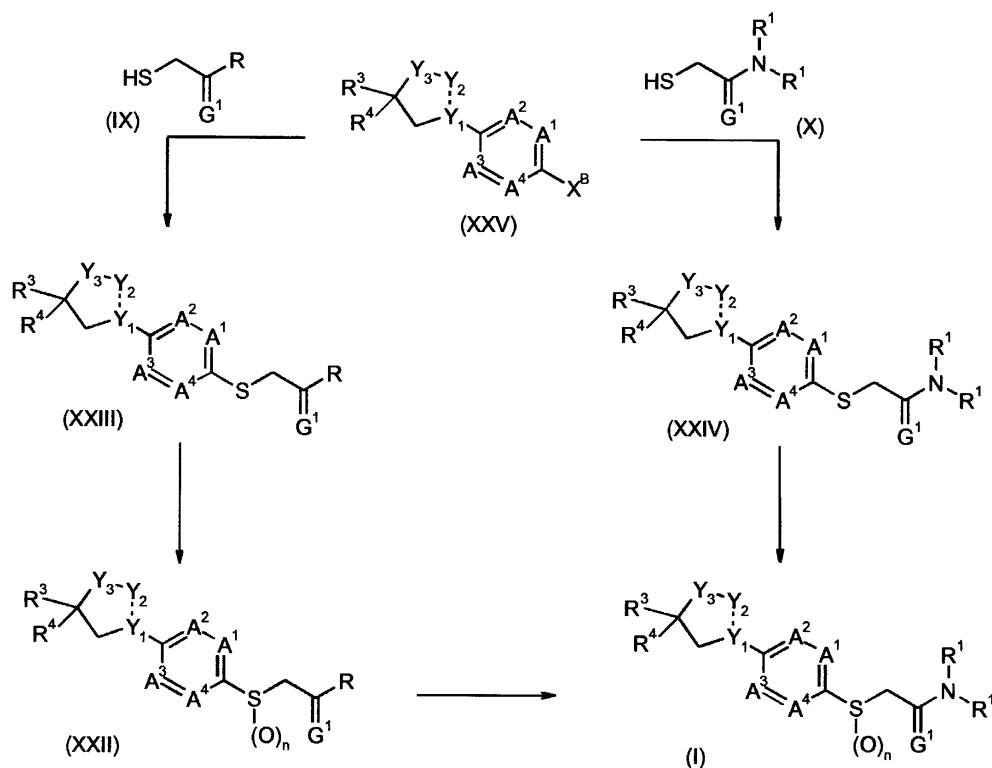
(式中、Zが、場合により置換されるアリールまたは場合により置換されるヘテロアリールであり、Wが、エチルまたはビニルであり、Xが、アニオン、好ましくはハロゲンアニオン、より好ましくは塩化物または臭化物である)の化合物であり得る。例えば国際公開第2011/104089号パンフレットを参照されたい。

【0847】

スキーム7

【化 4 2】

20



30

40

18) 式 (I) (式中、 G^1 がOであり、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $C=N-CH_2$ 、 $C=CH-O$ 、または $N-CH_2-CH_2$ である)の化合物は、スキーム1および3に記載される方法と同じ方法を用いて、スキーム7に記載されるのと同様に得られる。国際公開第2011/154555号パンフレットも参照されたい。式 (XXV) (式中、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が、 $C=N-CH_2$ である)の化合物が、例えば国際公開第2009/072621号パンフレットといった文献において公知である。式 (XXV) (式中、 $Y_1-Y_2-Y_3$ が

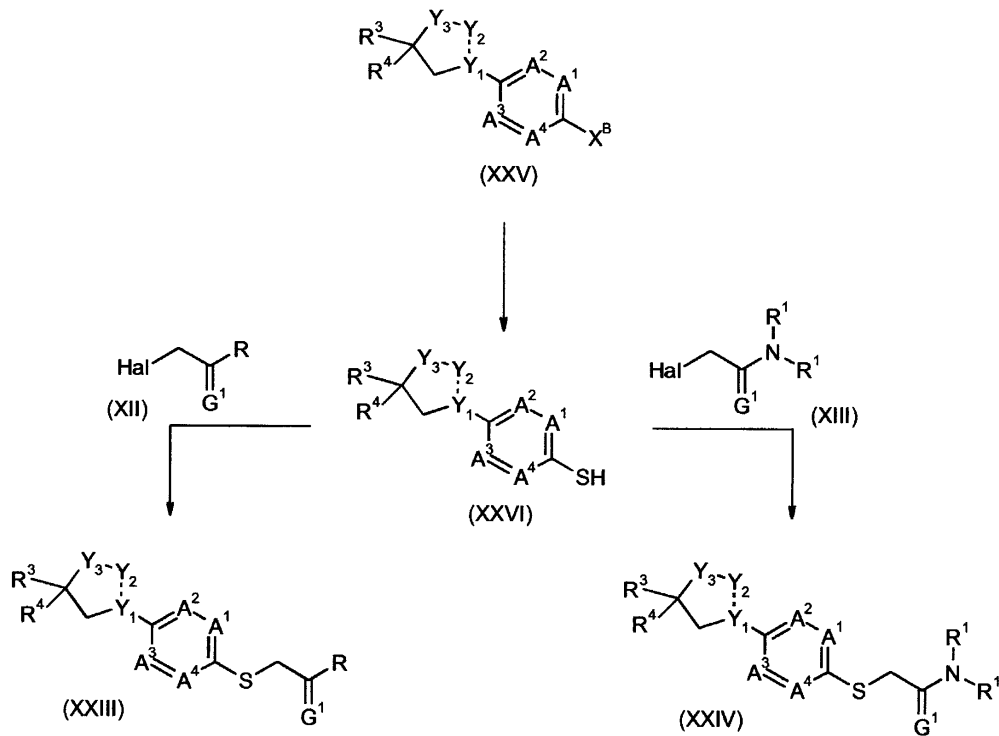
50

、 $\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ である)の化合物が、例えば国際公開第2008/128711号パンフレットといった文献において公知である。

【0848】

スキーム8

【化43】



10

20

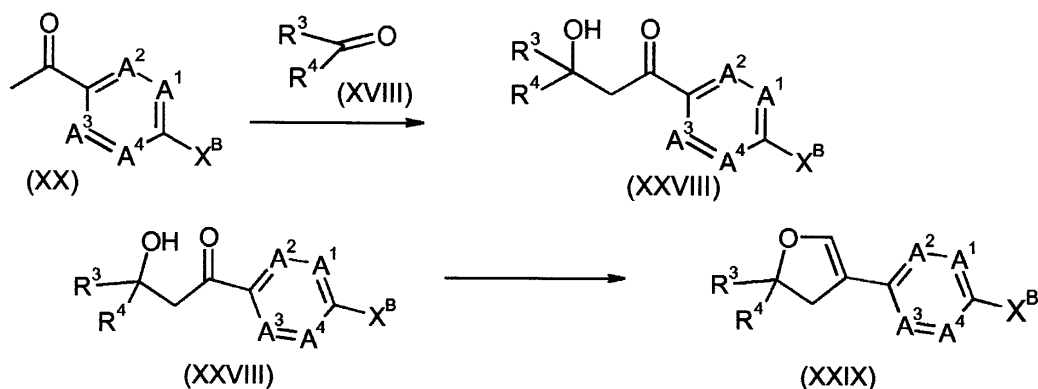
19) 式 (XXV) (式中、 G^1 がOであり、 $\text{Y}_1-\text{Y}_2-\text{Y}_3$ が、 $\text{C}=\text{N}-\text{CH}_2$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{O}$ 、または $\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ である)の化合物もまた、スキーム4に記載される方法と同じ方法を用いて、スキーム8に記載されるように、式 (XXIII) および (XXIV) の化合物へと変換され得る。

【0849】

スキーム9

30

【化 4 4】



10

20) 式 (XXIX) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、ブロモなどのハロゲン、または $C(O)R^x$ (ここで、 R^x が、OH または $C_1 \sim C_{15}$ アルコキシである) である) の化合物は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N, N-ジメチルホルムアミドまたはジメトキシエタンなどの好適な溶媒中、メチルリチウムなどの有機金属試薬の存在下で、式 (XXVIII) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、ブロモなどのハロゲン、または $C(O)R^x$ (ここで、 R^x がOH または $C_1 \sim C_{15}$ アルコキシである) である) の化合物を、トリメチルシリルジアゾメタンと反応させることによって調製することができる。反応は、 $-78^\circ C \sim 100^\circ C$ の温度、好ましくは $-78^\circ C$ から周囲温度で行われる。式 (XXVIII) の化合物は、公知の化合物であるか、または好ましくは式 (XX) の化合物を、式 (XVIII) のケトンと反応させることによって、例えば国際公開第2007/074789号パンフレットに記載される方法を用いて調製することができる。

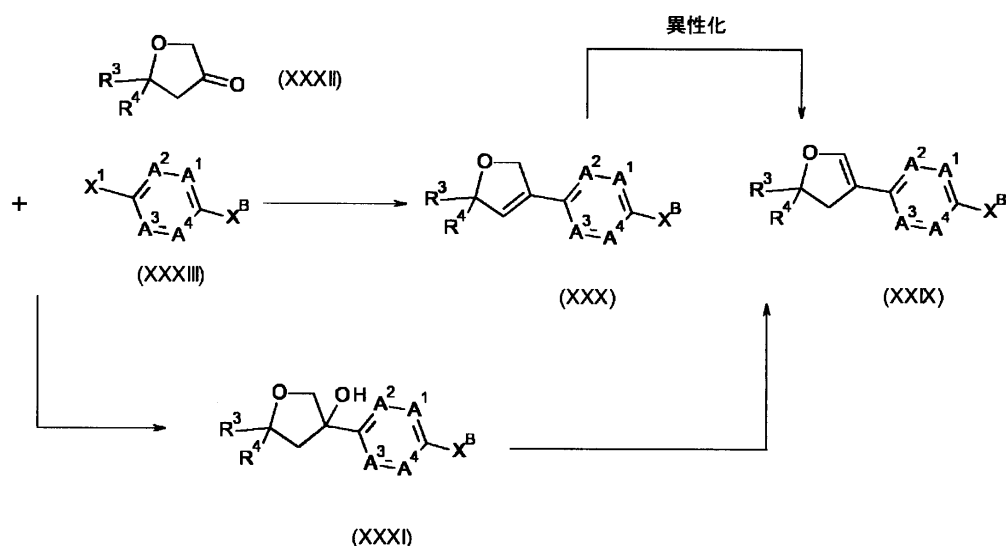
20

【0850】

スキーム 10

【化 4 5】

30



40

21) あるいは、式 (XXIX) (式中、 X^B が、脱離基、例えばハロゲンである) の 2, 3-ジヒドロフラン化合物は、室温と $150^\circ C$ との間の温度、好ましくは $80^\circ C \sim 1$

50

20℃の温度における、トルエンなどの溶媒またはエタノールなどのアルコール溶媒中、 $\text{RhCl}(\text{PPh}_3)_3$ 、 $\text{RhH}(\text{PPh}_3)_4$ 、 $\text{H}_2\text{Ru}(\text{CO})(\text{PPh}_3)_3$ 、 RuCl_3 、 $\text{HClRu}(\text{CO})(\text{PPh}_3)_3$ または $\text{H}_2\text{Ru}(\text{PPh}_3)_4$ などの金属触媒を用いた、式(XXX)(式中、 X^{B} が、脱離基、例えばハロゲンである)の2, 5-ジヒドロフランの異性化によって調製することができる。2, 5-ジヒドロフラン化合物の異性化のこのような条件は、J. Org. Chem. 2000, 65, 3966-3970においてM. Mori et al.によってまたはJ. Organomet. Chem. 1985, 297, C37~C40においてM. Bartok et al.によって記載される一般的な接触異性化を用いたChem. Eur. J. 2003, 9, 4442-4451に記載されている。あるいは、2, 5-ジヒドロフランの異性化についてChem. Lett. 1981, 341-342においてK. Tanabeによって記載される MgO 、 CaO 、 SrO 、または La_2O_3 などの塩基性金属酸化物触媒の存在下で異性化を行ってもよい。

10

【0851】

22) 式(XXIX)および(XXX)(式中、 X^{B} が、脱離基、例えばハロゲンである)の化合物は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、マグネシウム、リチウム、インジウム、セリウムまたは亜鉛などの触媒などの金属の存在下で、式(XXXXII)(式中、 X^{I} が、脱離基、例えば、ヨードまたはブロモなどのハロゲンであり、 X^{B} が、脱離基、例えばハロゲンである)の化合物を、式(XXXII)の化合物と反応させることによって調製することができる。反応は、 $-78^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度、好ましくは -78°C から周囲温度で行われる。

20

【0852】

23) 式(XXXI)の化合物は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、マグネシウム、インジウム、セリウム、亜鉛などの金属、またはn-ブチルリチウムなどの有機リチウム試薬の存在下で、式(XXXIII)(式中、 X_{B} が脱離基である)の化合物を、式(XXXII)の化合物と反応させることによって調製することができる。反応は、 $-100^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度、好ましくは -100°C から周囲温度で行われる。

【0853】

24) 式(XXIX)および(XXX)(式中、 X_{B} が脱離基である)の化合物は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはジクロロメタンなどの好適な溶媒中、p-トルエンスルホン酸または硫酸などの酸の存在下で、あるいは POCl_3 などの脱水剤の存在下で、式(XXXI)(式中、 X_{B} が脱離基である)の化合物を反応させることによって調製することができる。反応は、 $-78^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度、好ましくは -40°C から周囲温度で行われる。

30

【0854】

25) あるいは、式(XXIX)および(XXX)(式中、 X^{B} が脱離基である)の化合物は、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはジクロロメタンなどの好適な溶媒中、トリエチルアミン、炭酸カリウムまたはピリジンなどの塩基の存在下で、塩化チオニルまたは塩化オキサリルなどの塩素化剤、あるいは無水酢酸などのアセチル化剤の存在下で、式(XXXI)(式中、 X_{B} が脱離基である)の化合物を反応させることによって得られる。反応は、 $-78^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度、好ましくは -40°C から周囲温度で行われる。

40

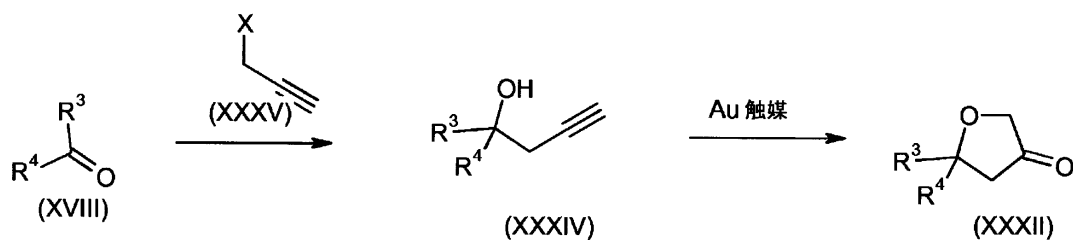
【0855】

26) 式(XXXIII)の化合物は、公知の化合物であり、または当業者に公知の方法によって調製することができる。式(XXXII)の化合物は、スキーム11に記載されるように調製することができる：

【0856】

スキーム11

【化 4 6】



10

27) 式 (XXXI) の化合物は、式 (XXXIV) の化合物の水和的環化によって調製することができる。これらの反応は、通常、J. Am. Chem. Soc., 2010, 132 (10), pp 3258-3259に記載されるように、金触媒などの好適なルイス酸の存在下で行われる。この反応は、通常、1, 2-ジクロロエタンなどの非プロトン性溶媒中、5-ブロモ-1-オキシニコチン酸メチルエステルなどのピリジンN-オキシドおよびメタンスルホン酸などの酸の存在下で、(トリフェニルホスフィン)金(I)ビス(トリフルオロメタンスルホニル)イミデートを用いて行われる。この反応は、0℃～100℃、好ましくは0℃～40℃の温度で行われる。

20

【0857】

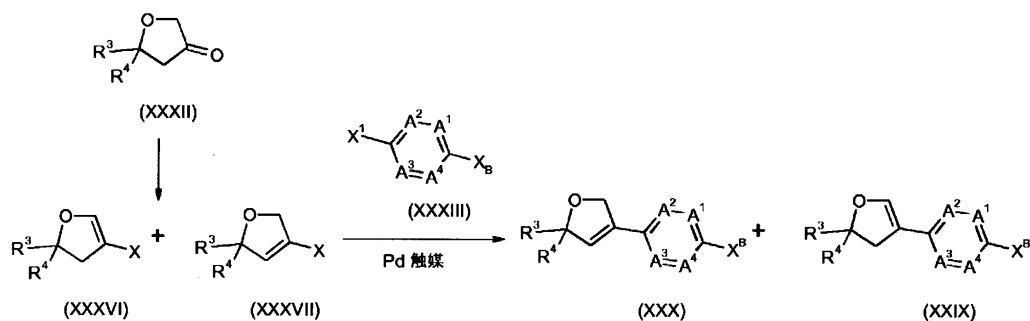
28) 式 (XXXIV) の化合物は、式 (XVII) の化合物を式 (XXXV) (式中、Xがハロゲンである) の化合物と反応させることによって調製することができる。これらの反応は、通常、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、マグネシウム、リチウム、インジウム、セリウムまたは亜鉛などの金属の存在下で行われる。この反応は、-78℃～100℃の温度、好ましくは-78℃から周囲温度で行われる。あるいは、式 (XXXIV) の化合物は、式 (XVII) の化合物を式 (XXXV) (式中、Xがトリアルキルシリル基である) の化合物と反応させることによって調製することができる。これらの反応は、通常、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、リチウムジイソプロピルアミドなどの強塩基の存在下で行われる。この反応は、-78℃～100℃の温度、好ましくは-78℃から周囲温度で行われる。

30

【0858】

スキーム 12

【化 4 7】



40

29) 式 (XXIX) の化合物 (および式 (XXX) の化合物) (式中、X_Bが脱離基である) は、1, 4-ジオキサン、トルエン、アセトニトリルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、酢酸パラジウムまたはテトラキス(トリフェニルホスフ

50

ィン) パラジウムなどのパラジウム触媒の存在下で、鈴木カップリング反応において、式 (XXXVI) の化合物 (または式 (XXXVII) の化合物) (式中、Xが、脱離基、例えばブロモなどのハロゲン、またはトリフレートである) を、式 (XXXIII) (式中、X_Bが脱離基であり、X¹が、ボロン酸、ボロン酸ピナコール、またはトリフルオロホウ酸塩などのホウ素誘導体である) の化合物と反応させることによって調製することができる。反応は、-20℃~150℃の温度、好ましくは周囲温度から100℃で行われる。あるいは、式 (XXIX) の化合物 (および式 (XXX) の化合物) (式中、X_Bが脱離基である) は、1, 4-ジオキサン、トルエン、アセトニトリルまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの好適な溶媒中、酢酸パラジウムまたはテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウムなどのパラジウム触媒の存在下で、Stilleまたは根岸カップリング反応において、式 (XXXVI) の化合物 (または式 (XXXVII) の化合物) (式中、Xが、脱離基、例えばブロモなどのハロゲン、またはトリフレートである) を、式 (XXXIII) (式中、X¹が、トリブチルスズなどのトリアルキルスタンナン誘導体、またはそれぞれ有機亜鉛誘導体である) の化合物と反応させることによって調製することができる。

10

【0859】

30) 式 (XXXVI) の化合物 (および式 (XXXVII) の化合物) (式中、Xが、ブロモなどのハロゲンである) は、テトラヒドロフラン、またはクロロホルム、ジクロロメタンなどの好適な溶媒中、三臭化リン (phosphoric tribromide) などの臭素化剤と式 (XXXII) の化合物を反応させることによって調製することができる。この反応は、-40℃~100℃の温度、好ましくは-40℃から周囲温度で行われる。あるいは、式 (XXXVI) の化合物 (および式 (XXXVII) の化合物) (式中、Xがトリフレートである) は、テトラヒドロフラン、クロロホルムまたはジクロロメタンなどの好適な溶媒中、4-ピコリン、ナトリウムまたはカリウムヘキサメチルジシルアミド、リチウムジイソプロピルアミド、トリエチルアミンまたは2, 6-ルチジンなどの塩基の存在下で、式 (XXXII) の化合物を、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (triflic anhydride) またはN, N-ビス (トリフルオロメタンスルホニル) アニリンなどのトリフレート化剤 (triflating agent) と反応させることによって調製することができる。この反応は、-100℃~150℃、好ましくは-40℃~100℃の温度で行われる。

20

30

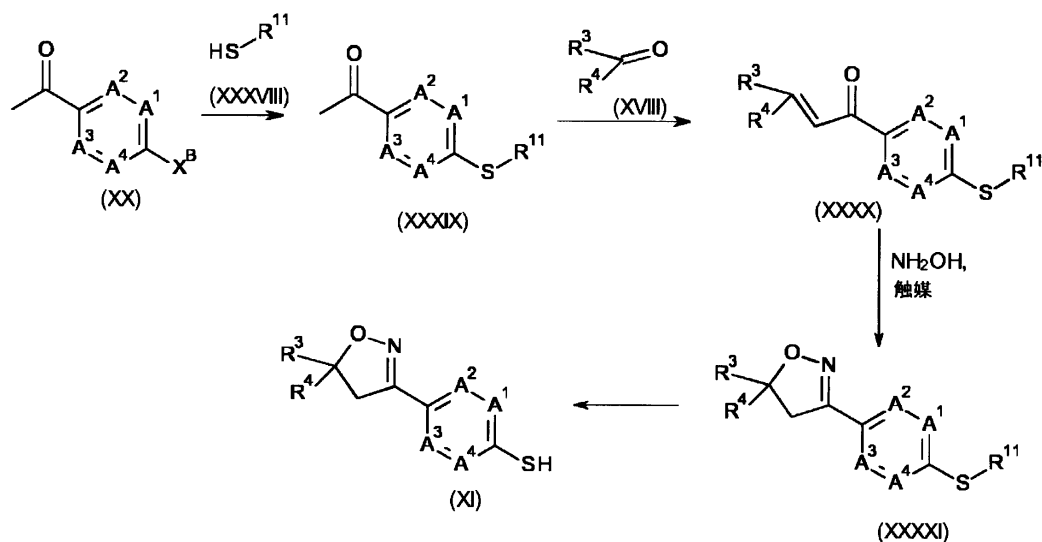
【0860】

Y₁-Y₂-Y₃が、-C=CH-O-である化合物の調製に関連するさらなる情報については、国際公開第2011/101229号パンフレットも参照されたい。

【0861】

スキーム13

【化 4 8】



10

31) 式 (XXXXIX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物は、式 (XX) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、フルオロ、クロロまたはブロモなどのハロゲンである)の中間体を、式 (XXXVIII) (式中、 R^{11} が $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキル、例えばtert-ブチルである)のメルカプタンと反応させることによって調製することができる。このような反応は、 $0^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは $25^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度で、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセトアミドなどの溶媒中、アミンまたは炭酸塩、例えば炭酸カリウムまたは炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことができる。このような反応の例は、Synlett 2006, 8, 1255-1259に見られ、具体例が、実験の項に記載されている。あるいは、反応は、 $0^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは $80^\circ\text{C} \sim 130^\circ\text{C}$ の温度で、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、酢酸エチル、またはトルエンなどの溶媒中、触媒、例えばパラジウム触媒、およびリガンド、例えばホスフィンリガンドの存在下で行うことができる。この反応は、例えば国際公開第2007/102059号パンフレットに記載されるように、マイクロ波照射下で行うことができ、具体例が、実験の項に記載されている。

20

30

【0862】

32) 式 (XXXXIX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物は、例えば国際公開第2009/080250号パンフレットに記載される方法にしたがって、式 (XVIII)のケトンとの反応によって、式 (XXXX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物へと変換され得る。

40

【0863】

33) 続いて、式 (XXXX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物は、例えば国際公開第2009/080250号パンフレットに記載されるように、ヒドロキシルアミン、塩基および相間移動触媒による処理によって、式 (XXXXIX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物へと変換され得る。

【0864】

34) 続いて、式 (XXXXIX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで

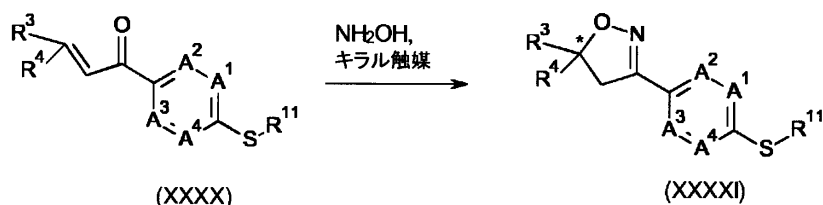
50

場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物は、式(XI)の化合物へと変換され得る。このような反応は、 $-78^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは $0^\circ\text{C} \sim 110^\circ\text{C}$ の温度で、酢酸、トリフルオロ酢酸、トルエン、ジクロロメタン、水などの溶媒中、スルホン酸、カルボン酸、例えば、メチルスルホン酸、パラトルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、三塩化アルミニウムまたは酢酸水銀(II)などの、酸またはルイス酸の存在下で行うことができる。このような反応の例は、Organometallics, 2007, 26, 897-909およびChemical Communications 2009, 5236-5238に見られ、具体例が、実験の項に記載されている。

【0865】

スキーム14

【化49】

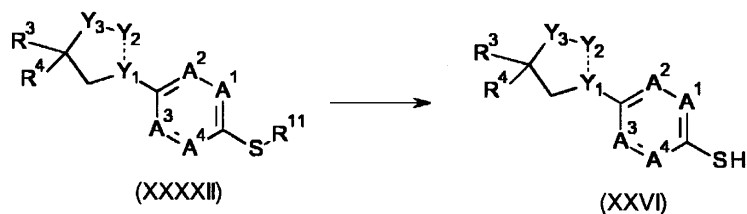


35) 式(XXXX) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物は、例えば国際公開第2009/080250号パンフレットに記載されるように、ヒドロキシルアミン、塩基および相間移動触媒による処理によって、式(XXXXI) (式中、 R^{11} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリールで場合により置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の化合物へと変換され得る。

【0866】

スキーム15

【化50】



36) 式(XXXXII) (式中、 $GY_1-Y_2-Y_3$ が、 $C=N-CH_2$ 、 $C=CH-O$ 、または $N-CH_2-CH_2$ である)の化合物はまた、スキーム4に記載される方法と同じ方法を用いて、スキーム8に記載されるように、式(XXVI)の化合物へと同様に変換され得る。

【0867】

スキーム16

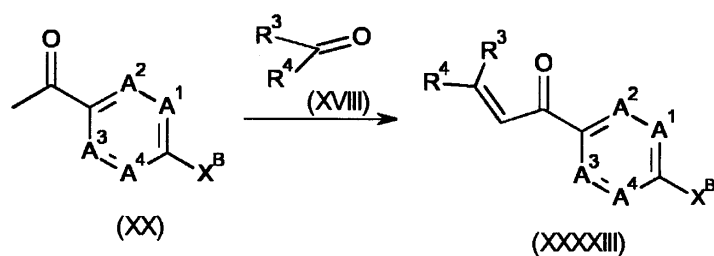
10

20

30

40

【化 5 1】



10

37) 式 (XX) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、フルオロ、クロロまたはブロモなどのハロゲンである) の化合物は、例えば国際公開第 2009/080250 号パンフレットに記載される方法にしたがって、式 (XVII I) のケトンとの反応によって、式 (XXXX I I I) の化合物に変換され得る。

【0868】

スキーム 17

【化 5 2】

20



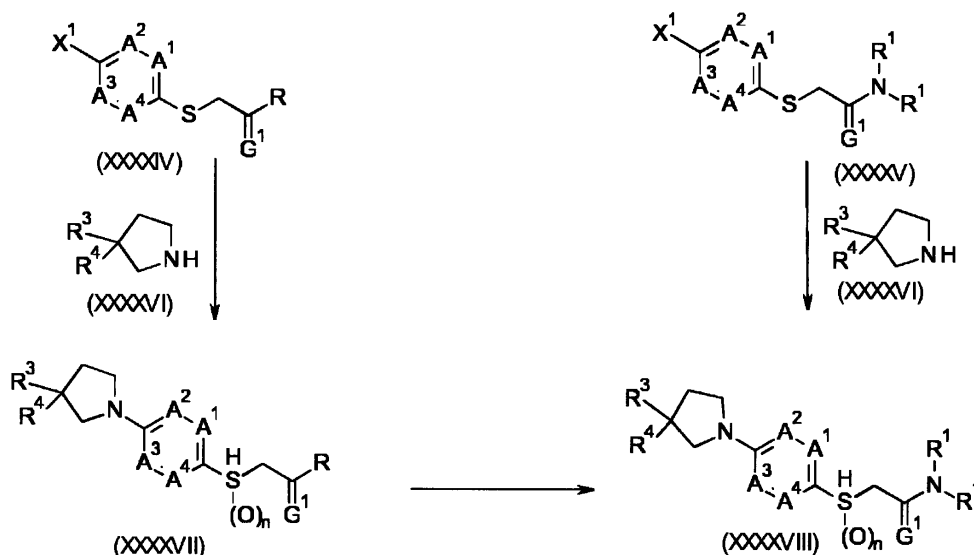
30

38) 式 (XXXX I I I) (式中、 X^B が、脱離基、例えば、フルオロ、クロロまたはブロモなどのハロゲンである) の化合物は、例えば国際公開第 2009/080250 号パンフレットに記載されるように、ヒドロキシルアミン、塩基および相間移動触媒による処理によって、式 (V I I I) の化合物へと変換され得る。

【0869】

スキーム 18 :

【化 5 3】



10

20

39) 式 (XXXXIV) (式中、G¹がOである) の化合物はまた、アルカリ金属アルコキシド、アルカリリン酸塩またはアルカリ炭酸塩などの塩基、およびパラジウムまたは銅触媒の存在下における、式 (XXXXVI) のピロリジンの反応によって、スキーム 18 に記載されるように、式 (XXXXVII) (式中、X¹が、クロロ、ブromo、またはヨードなどのハロゲン、あるいはトリフレートまたはメシレートなどのスルホン酸エステルである) の化合物へと同様に変換され得る。反応は、0℃～2000℃、好ましくは 20℃～160℃の温度で行われる。使用される塩基の当量は、0.1～10当量、好ましくは 1～4 当量で変化し得る。

【0870】

40) 式 (XXXXIV) (式中、G¹がOである) の化合物はまた、アルカリ金属アルコキシド、アルカリリン酸塩またはアルカリ炭酸塩などの塩基、およびパラジウムまたは銅触媒の存在下における、式 (XXXXVI) のピロリジンの反応によって、スキーム 20 に記載されるように、式 (XXXXVII) (式中、X¹が、クロロ、ブromo、またはヨードなどのハロゲン、あるいはトリフレートまたはメシレートなどのスルホン酸エステルである) の化合物へと同様に変換され得る。反応は、0℃～2000℃、好ましくは 20℃～160℃の温度で行われる。使用される塩基の当量は、0.1～10当量、好ましくは 1～4 当量で変化し得る。

30

【0871】

式 (I) の化合物は、鱗翅目 (Lepidoptera)、双翅目 (Diptera)、半翅目 (Hemiptera)、総翅目 (Thysanoptera)、直翅目 (Orthoptera)、網翅目 (Dictyoptera)、鞘翅目 (Coleoptera)、ノミ目 (Siphonaptera)、膜翅目 (Hymenoptera)、およびシロアリ目 (Isoptera) などの昆虫有害生物、ならびにさらに他の無脊椎有害生物、例えば、ダニ、線虫および軟体動物有害生物の蔓延を食い止めかつ防除するために使用され得る。昆虫、ダニ、線虫、および軟体動物は、以後、まとめて有害生物と呼ばれる。本発明の化合物の使用によって食い止められかつ防除され得る有害生物としては、農業 (この用語は、食品及び繊維製品のための作物の栽培を含む)、園芸および畜産、コンパニオンアニマル、林業および植物由来の製品 (果実、穀類および材木など) の貯蔵に関連する有害生物；人工建造物の損傷ならびにヒトおよび動物の疾患の伝播に関連する有害生物；ならびにさらに不快な有害生物 (ハエなど) が挙げられる。本発明の化合物は、例

40

50

えば芝生、花、低木、広葉樹または常緑樹、例えば針葉樹などの観賞植物、ならびに樹幹注入、有害生物管理などに使用され得る。式 I の化合物を含む組成物は、例えば、アブラムシ、コナジラミ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、甲虫および毛虫を防除するために、観賞用園芸植物（例えば花、低木、広葉樹または常緑樹）に使用され得る。式 I の化合物を含む組成物は、例えば、アブラムシ、コナジラミ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、甲虫および毛虫を防除するために、園芸植物（例えば、花、低木、広葉樹または常緑樹）において、屋内植物（例えば、花および低木）においておよび屋内有害生物において使用され得る。

【0872】

さらに、本発明の化合物は、栽培植物に何らかの有害な副作用をそれほど与えることなく、有害な昆虫に対して有効であり得る。本発明の化合物の施用により、収穫高が増加され、収穫物の品質が向上され得る。本発明の化合物は、施用される量、残渣形成、選択性、毒性、生成方法、高い活性、広い防除範囲、安全性、耐性生物、例えば有機リン薬剤および／またはカルバメート薬剤に耐性がある有害生物の防除に関して有利な特性を有し得る。

【0873】

式 (I) の化合物によって防除され得る有害生物種の例としては：鞘翅目虫、例えば、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、オオニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*)、トビイロムナボソコメツキ (*Agriotes fuscicollis*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、ディアブロティカ属 (*Diabrotica* spp.)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptus oryzaophilus*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)；鱗翅目虫、例えば、マイマイガ (*Lymantria dispar*)、ウメケムシ (*Malacosoma neustria*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ヨトウ (*Mamestra brassicae*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、アワノメイガ (*Pyrausta nubilalis*)、コナマダラメイガ (*Ephestia cautella*)、コカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*)、コドリリング (*Carpocapsa pomonella*)、カブラヤガ (*Agrotis fucosa*)、ハチミツガ (*Galleria mellonella*)、コナガ (*Plutella maculipennis*)、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)；半翅目虫、例えば、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicas*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ニセダイコンアブラムシ (*Rhopalosiphum pseudobrassicas*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、アオカメムシ属 (*Nezara* spp.)、オンシツコナジラミ (*Trialeturodes vaporariorum*)、キジラミ属 (*Psylla* spp.)；総翅目虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)；直翅目虫、例えば、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*)、バッタ (*Locusta*

10

20

30

40

50

sta migratoria migratoriodes) ; シロアリ目虫、例えば、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*) ; 双翅目虫、例えば、イエバエ (*Musca domestica*)、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、タネバエ (*Hylemia platura*)、アカイエカ (*Culex pipiens*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*) ; コナダニ、例えば、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、ホコリダニ属 (*Tarsonemus* spp.) ; 線虫、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara)、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus* spp.) が挙げられる。

【0874】

式 (I) の化合物によって防除され得るさらなる有害生物種の例としては、以下のものが挙げられる：シラミ目 (*Anoplura*) (*Phthiraptera*) から、例えば、ダマリニア属 (*Damalinia* spp.)、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.)、トリコデクテス属 (*Trichodectes* spp.) ; クモ綱 (*Arachnida*) から、例えば、コナダニ (*Acarus siro*)、イシイハダニ (*Aceria sheldoni*)、サビダニ属 (*Aculops* spp.)、チュウシコギセル属 (*Aculus* spp.)、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.)、ヒメハダニ属 (*Brevipalpus* spp.)、クローバーピラハダニ (*Bryobia praetiosa*)、コリオプテス属 (*Choriopetes* spp.)、デルマニスス・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、エオテトラニクス属 (*Eotetranychus* spp.)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、トウヨウハダニ属 (*Eutetranychus* spp.)、サビダニ属 (*Eriophyes* spp.)、ヘミタルソレムス属 (*Hemitarsonemus* spp.)、ダニ属 (*Hyalomma* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、セアカコケグモ (*Latrodectus mactans*)、リンゴハダニ属 (*Metatetranychus* spp.)、オリゴニクス属 (*Oligonychus* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、パノニシュス属 (*Panonychus* spp.)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta oleivora*)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属 (*Psoroptes* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、ネダニ属 (*Rhizoglyphus* spp.)、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステノタルソネムス属 (*Stenotarsonemus* spp.)、ホコリダニ属 (*Tarsonemus* spp.)、テトラニクス属 (*Tetranychus* spp.)、ヴァサテス・リコペルシキ (*Vasates lycopersici*) ; 二枚貝綱 (*Bivalva*) から、例えば、ドレイセナ属 (*Dreissena* spp.) ; 唇脚目 (*Chilopoda*) から、例えば、ムカデ属 (*Geophilus* spp.)、スクティゲラ属 (*Scutigera* spp.) ; 鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscehdes ob*

10

20

30

40

50

tectus)、コガネムシ属 (*Adoretus* spp.)、ハムシ (*Agelastica alni*)、コメツキ属 (*Agriotes* spp.)、アンフィマロン・ソルスティティアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、ゴマダラカミキリ属 (*Anoplophora* spp.)、アンソノムス属 (*Anthonomus* spp.)、カツオブシムシ属 (*Anthrenus* spp.)、カンショコガネ属 (*Apogonia* spp.)、クイムシ属 (*Atomaria* spp.)、アタゲヌス属 (*Attagenus* spp.)、マメゾウムシ (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属 (*Bruchus* spp.)、ケウトリンクス属 (*Ceuthorhynchus* spp.)、クレオヌス・メンディクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属 (*Cosmopolites* spp.)、コステリトラ・ジーランディカ (*Costelytra zealandica*)、クルクリオ属 (*Curculio* spp.)、ヤナギシリジロゾウムシ (*Cryptorhynchus lapathi*)、カツオブシムシ属 (*Dermestes* spp.)、ディアブロティカ属 (*Diabrotica* spp.)、ホシテントウ属 (*Epilachna* spp.)、ファウスティヌス・クバエ (*Faustinus cubae*)、ヒョウホンムシ (*Gibbium psylloides*)、ヘテロニクス・アラター (*Heteronychus arator*)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バユルス (*Hylotrupes bajulus*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、クイムシ属 (*Hypothenemus* spp.)、ラクノステルナ・コンサングイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)、カツオゾウムシ属 (*Lixus* spp.)、ヒラタクイムシ属 (*Lyctus* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、ヨーロッパコフキコガネ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属 (*Migdolus* spp.)、ヒゲナガカミキリ属 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・キサントグラフィス (*Naupactus xanthographus*)、ニプトゥス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、タイワンカブトムシ (*Oryctes rhinoceros*)、ノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、オティオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリエ (*Phaedon cochleariae*)、コガネムシ属 (*Phyllophaga* spp.)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属 (*Premnotrypes* spp.)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、ヒョウホンムシ属 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ヴェントラリス (*Rhizobius ventralis*)、コナナガシンクイ (*Rhizopertha dominica*)、コクゾウムシ属 (*Sitophilus* spp.)、オサゾウムシ属 (*Sphenophorus* spp.)、ステルネクス属 (*Sternechus* spp.)、シンフィレテス属 (*Symphyletes* spp.)、チャイロコメノゴミムシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ属 (*Tribolium* spp.)、トロゴデルマ属 (*Trogoderma* spp.)、ゾウムシ属 (*Tychius* spp.)、カミキリ属 (*Xylotrechus* spp.)、ゴミムシ属 (*Zabrus* spp.)；トビムシ目 (*Collembola*) から、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)；革翅目 (*Dermaptera*) から、例えば、クギヌキハサミムシ (*Forficula auricularia*)；倍脚目 (*Diplopoda*) から、例えば、ブラニルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)；双翅目 (*Diptera*) から、例えば

、ヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、
 、ビビオ・ホルチュラス (*Bibio hortulanus*)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、ミバエ (*Ceratitis capitata*)、クリソミア属 (*Chrysomyia* spp.)、コクミリア属 (*Cochliomyia* spp.)、ヒトクイバエ (*Cordylobia anthropophaga*)、イエカ属 (*Culex* spp.)、ウサギヒフバエ属 (*Cuterebra* spp.)、オリーブミバエ (*Dacus oleae*)、ヒトヒフバエ (*Dermatobia hominis*)、ショウジョウバエ属 (*Drosophila* spp.)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ウマバエ属 (*Gastrophilus* spp.)、ヒレミア属 (*Hylemyia* spp.)、シラミバエ属 (*Hyppobosca* spp.)、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ハモグリバエ属 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、カメムシ属 (*Nezara* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ハナバエ属 (*Phorbia* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タンニア属 (*Tannia* spp.)、ガガンボ (*Tipula paludosa*)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp.)；腹足綱 (*Gastropoda*) から、例えば、アリオン属 (*Arión* spp.)、ヒラマキガイ属 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属 (*Bulinus* spp.)、ナメクジ属 (*Deroceras* spp.)、ガルバ属 (*Galba* spp.)、コシダカヒメモノアラガイ属 (*Lymnaea* spp.)、ヨナクイカタアマガイ属 (*Oncomelania* spp.)、オカモノアラガイ属 (*Succinea* spp.)；寄生蠕虫から、例えば、アンシロストーマ・ドゥオデナレ (*Ancylostoma duodenale*)、セイロン鉤虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、アシロストマ・ブラジリエンシス (*Ancylostoma braziliensis*)、カギムシ属 (*Ancylostoma* spp.)、ヒト回虫 (*Ascaris lumbricoides*)、アスカリス属 (*Ascaris* spp.)、マレー糸状虫 (*Brugia malayi*)、ブルギア・ティモリ (*Brugia timori*)、ブノストマム属 (*Bunostomum* spp.)、チャベルチア属 (*Chabertia* spp.)、肝吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、クーペリア属 (*Cooperia* spp.)、槍形吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、ディクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、広筋裂頭条虫 (*Diphyllobothrium latum*)、エジナ虫 (*Dracunculus medinensis*)、単胞状虫 (*Echinococcus granulosus*)、多胞状虫 (*Echinococcus multilocularis*)、ヒト蟯虫 (*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属 (*Faciola* spp.)、ヘモンクス属 (*Haemonchus* spp.)、ヘテラキス属 (*Heterakis* spp.)、矮小条虫 (*Hymenolepis nana*)、ヒョストロングルス属 (*Hyostrogylus* spp.)、ロア糸状虫 (*Loa Loa*)、ネマトジルス属 (*Nematodirus* spp.)、エソファゴストマム属 (*Oesophagostomum* spp.)、オピストルキス属 (*Opisthorchis* spp.)、回旋線糸条虫 (*Oncocerca volvulus*)、オステルタギア属 (*Ostertagia* spp.)、パラゴニムス属 (*Paragonimus* spp.)、スキスオソメン属 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロニロイデス属 (*Stroynyloides* spp.)、無鉤条虫 (*Taenia saginata*)、有鉤条

10

20

30

40

50

虫 (*Taenia solium*)、絨毛虫 (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナティバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトヴィ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソーニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シュードプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属 (*Trichostongulus* spp.)、ヒト鞭虫 (*Trichuris trichuria*)、バンクロフト糸状虫 (*Wuchereria bancrofti*)；さらに、アイメリア属 (*Eimeria*) などの原虫を防除することが可能であり得；異翅目 (*Heteroptera*) から、例えば、アナサ・トリステイス (*Anasa tristis*)、カメムシ属 (*Antestiopsis* spp.)、ナガカメムシ属 (*Blissus* spp.)、カスミカメムシ属 (*Calocoris* spp.)、カスミカメムシ (*Campylomma livida*)、カンシャコバネカメムシ属 (*Cavelerius* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クレオンティアデス・ディルーツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ディケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ディコノコリス・ヘウエッティ (*Diconocoris hewetti*)、ホシカメムシ属 (*Dysdercus* spp.)、カメムシ属 (*Euschistus* spp.)、エウリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、ヘリオペルティス属 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、クモヘリカメムシ属 (*Leptocorisa* spp.)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、カスミカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マクロペス・エクスヴァツス (*Macropes excavatus*)、メクラカメムシ (*Miridae*)、アオカメムシ属 (*Nezara* spp.)、オイバルス属 (*Oebalus* spp.)、カメムシ科 (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、サルス・セリアツス (*Psallus seriatus*)、シューダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロードニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シンギュラリス (*Sahlbergella singularis*)、スコチノフフォラ属 (*Scotinophora* spp.)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ティリブラカ属 (*Tibraca* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)；同翅目 (*Homoptera*) から、例えば、アキルトシポン属 (*Acyrtosipon* spp.)、アエネオラミア属 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノスケナ属 (*Agonosцена* spp.)、アレウローデス属 (*Aleurodes* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス属 (*Aleurothrixus* spp.)、アムラスカ属 (*Amrasca* spp.)、アヌラフィス・カルドゥイ (*Anuraphis cardui*)、マルカイガラムシ属 (*Aonidiella* spp.)、アフアノスティグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属 (*Aphis* spp.)、フタテンヒメヨコバ (*Arboridia apicalis*)、アスピディエラ属 (*Aspidiella* spp.)、アスピディオトゥス属 (*Aspidiotus* spp.)、アタヌス属 (*Atanus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア属 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウドゥス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カリギボナ・マルギナータ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギーダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、アワフキムシ科 (*Cercopidae*)、セロプラステス属 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシ

10

20

30

40

50

フォン・フラガエフォリ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオ
 ナスピシス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ
 ・オヌキ (*Chlorita onukii*)、クロマフィス・ジュグランディコラ (*C
 hromaphis juglandicola*)、トビイロマルカイガラムシ (*Chr
 ysomphalus ficus*)、シカルデュリナ・ムビラ (*Cicadulina
 mbila*)、ココミティルス・ハリ (*Coccomytilus halli*)、コ
 クス属 (*Coccus spp.*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus
 ribis*)、ダルブルス属 (*Dalbulus spp.*)、ディアロイローデス属
 (*Dialeurodes spp.*)、ディアフォリーナ属 (*Diaphorina
 spp.*)、ディアスピス属 (*Diaspis spp.*)、ドラリス属 (*Doralis
 spp.*)、ドロシカ属 (*Drosicha spp.*)、ディサフィス属 (*Dys
 aphis spp.*)、デイスミコッカス属 (*Dysmicoccus spp.*)、
 エンポアスカ属 (*Empoasca spp.*)、エリオソマ属 (*Eriosoma s
 pp.*)、エリスロニューラ属 (*Erythroneura spp.*)、ユーセリス・
 ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、ゲオコッカス・コフェアエ (*G
 eococcus coffeae*)、ホマロディスカ・コアグラータ (*Homalod
 isca coagulata*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus a
 rundinis*)、イセリア属 (*Icerya spp.*)、イディオケルス属 (*Id
 iocerus spp.*)、イディオスコプス属 (*Idioscopus spp.*)、
 ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属 (*20
 Lecanium spp.*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes spp
 .*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、マクロシフム属
 (*Macrosiphum spp.*)、マハナルヴァ・フィムブリオラタ (*Mahan
 arva fimbriolata*)、ヒエノアブラムシ (*Melanaphis sa
 cchari*)、メトカルフィエラ属 (*Metcalfiella spp.*)、ムギウ
 スイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コス
 タリス (*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス (*Mone
 lliopsis pecanisi*)、ミズス属 (*Myzus spp.*)、ナソノビア
 ・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネホテティクス属 (*N
 ephotettix spp.*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lug
 ens*)、オンコメトピア属 (*Oncometopia spp.*)、オルテジア・ブラ
 エロンガ (*Orthezia praelonga*)、ヤマモモコナジラミ (*Parab
 emisia myricae*)、パラトリオーザ属 (*Paratrioza spp.
 .*)、パルトリオリア属 (*Parlatoria spp.*)、ペンフィグス属 (*Pemph
 igus spp.*)、ペレグリヌス・マイデイス (*Peregrinus maidi
 s*)、フェナコッカス属 (*Phenacoccus spp.*)、プロエオミズス・パセ
 リニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、フォロドン・フミリ (*Ph
 orodon humuli*)、フィロクセラ属 (*Phylloxera spp.*)、
 ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコッ
 カス属 (*Planococcus spp.*)、プロトプルビナリア・ピリフォルミス (*40
 Protopulvinaria pyriformis*)、クワシロカイガラムシ (*P
 seudaulacaspis pentagona*)、シュードコッカス属 (*Pseu
 dococcus spp.*)、キジラミ属 (*Psylla spp.*)、プテロマルス
 属 (*Pteromalus spp.*)、ピリラ属 (*Pyrilla spp.*)、クア
 ドラスピディオツス属 (*Quadraspidiotus spp.*)、ケサーダ・ギガ
 ス (*Quesada gigas*)、ラストロコッカス属 (*Rastrococcus
 spp.*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum spp.*)、サイセティア
 属 (*Saissetia spp.*)、スカホイデス・ティタヌス (*Scaphoide
 s titanus*)、スキザフィス・グラミヌム (*Schizaphis grami
 num*)、セレナスピヅス・アルティキュラツス (*Selenaspidus arti
 50*

culatus)、ソガータ属 (*Sogata* spp.)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属 (*Sogatodes* spp.)、スティクトセファラ・フェスティナ (*Stictocephala festina*)、テナラファラ・マレイエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、チノカリス・カリアエフォリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属 (*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属 (*Toxoptera* spp.)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオーザ属 (*Trioza* spp.)、チフロシバ属 (*Typhlocyba* spp.)、ユナプシス属 (*Unaspis* spp.)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)；膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えば、マツバチ属 (*Diprion* spp.)、ハバチ属 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス属 (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ (*Mono-morium pharaonis*)、スズメバチ属 (*Vespa* spp.)；等脚目 (*Isopoda*) から、例えば、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*)、ホンワラジムシ (*Oniscus asellus*)、ワラジムシ (*Porcellio scaber*)；シロアリ目 (*Isoptera*) から、例えば、ヤマトシロアリ属 (*Reticulitermes* spp.)、タイワンシロアリ属 (*Odontotermes* spp.)；鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えば、オオケンモン (*Acronicta major*)、ナカジロシタバ (*Aedia leucomelas*)、アグロティス属 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アンティカルシア属 (*Anticarsia* spp.)、ヨトウガ (*Barathra brassicae*)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ハマキガ (*Cacoecia podana*)、カプア・レティクラーナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、ケイマトビア・ブルマータ (*Chematomia brumata*)、ツドガ属 (*Chilo* spp.)、トウヒノシントメハマキ (*Choristoneura fumiferana*)、クリシア・アンビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属 (*Cnaphalocerus* spp.)、ミスジアオリング (*Earias insulana*)、スジコナマダラメイガ (*Ephestia kuehniella*)、モンシロドクガ (*Euproctis chrysorrhoea*)、ヤガ属 (*Euxoa* spp.)、フェルティア属 (*Feltia* spp.)、ハチノスツツリガ (*Galleria mellonella*)、ヘリコベルパ属 (*Helicoverpa* spp.)、タバコガ属 (*Heliothis* spp.)、ホフマノフィラ・シュードスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、チャハマキ (*Homonamagnanima*)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、ラフィグマ属 (*Laphygma* spp.)、リソコレティス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファン・アンテナータ (*Lithophane antennata*)、ロクサグロティス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、マイマイ属 (*Lymantria* spp.)、オビカレハ (*Malacosoma neustria*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、モキス・レパンダ (*Mocis repanda*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、オリア属 (*Oria* spp.)、イネクビボリムシ (*Oulema oryzae*)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ミカンハモクリガ (*Phyllocnistis citrella*)、モンシロチョウ属 (*Pieris* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、プロデニア属 (*Prodenia* spp.)、シュードレティ

10

20

30

40

50

ア属 (*Pseudaletia* spp.)、シュードプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、アワノメイガ (*Pyrausta nubilalis*)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、テルメシア・ゲマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、ティネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、ティネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス・ビリダーナ (*Tortrix viridana*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)；直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、コオロギ (*Acheta domesticus*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ケラ属 (*Gryllotalpa* spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、バッタ属 (*Locusta* spp.)、コバネイナゴ属 (*Melanoplus* spp.)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、サバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria*)；ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)。コムカデ目 (*Symphyla*) から、例えば、スクティゲレラ・イマキュラータ (*Scutigera immaculata*)；総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、バリオトリプス・ビフォルミス (*Baliotrips biformis*)、エネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオスリプス属 (*Heliothrips* spp.)、クリバネアザミウマ (*Hercinothrips femoralis*)、カコスリプス属 (*Kakothrips* spp.)、リピフォロスリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* spp.)、タエニオスリプス・カルダモニ (*Taeniothrips cardamoni*)、アザミウマ属 (*Thrips* spp.)；シミ目 (*Thysanura*) から、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)。植物寄生性線虫としては、例えば、葉枯線虫属 (*Anguina* spp.)、土壌線虫属 (*Aphelenchoides* spp.)、ナミクキセンチュウ属 (*Belonoaimus* spp.)、ブルサフェレンクス属 (*Bursaphelenchus* spp.)、ディチレンカス・ディプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、グロボデラ属 (*Globodera* spp.)、ヘリオコチレンクス属 (*Heliocotylenchus* spp.)、ヘテロデラ属 (*Heterodera* spp.)、土壌線虫属 (*Longidorus* spp.)、ネコブセンチュウ属 (*Meloidogyne* spp.)、ネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus* spp.)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*)、ロチレンカス属 (*Rotylenchus* spp.)、ハリセンチュウ属 (*Trichodorus* spp.)、ティレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus* spp.)、ティレンキュラス属 (*Tylenchulus* spp.)、ミカンエセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、キフィネマ属 (*Xiphinema* spp.) が挙げられる。

【0875】

特に、本発明の化合物は、以下の有害生物種を防除するのに使用され得る：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (アブラムシ)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) (アブラムシ)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae*) (アブラムシ)、カスミカメムシ属 (*Lygus* spp.) (カブシド)、ホシカメムシ属 (*Dysdercus* spp.) (カブシド)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) (ウンカ)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) (ヨコバイ)、アオカメムシ属 (*Nezara* spp.) (カメムシ)、カメムシ属 (*Euschistus* spp.) (カメムシ)、クモヘリカメ

ムシ属 (*Leptocorisa* spp.) (カメムシ)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (アザミウマ)、アザミウマ属 (*Thrips* spp.) (アザミウマ)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) (コロラドハムシ)、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*) (ワタミゾウムシ)、マルカイガラムシ属 (*Aonidiella* spp.) (カイガラムシ)、コナジラミ属 (*Trialeurodes* spp.) (コナジラミ)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) (コナジラミ)、ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*) (アワノメイガ)、スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ)、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*) (オオタバコガ)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) (オオタバコガ)、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) (オオタバコガ)、ワタノメイガ (*Sylepta derogata*) (ワタノメイガ)、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*) (モンシロチョウ)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (コナガ)、アグロティス属 (*Agrotis* spp.) (ヨトウムシ)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニカメイチュウ)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*) (バッタ)、オーストラリアトビバッタ (*Chortiocetes terminifera*) (バッタ)、ディアブロティカ属 (*Diabrotica* spp.) (ネキリムシ)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) (ヨーロッパアカダニ)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*) (ミカンアカダニ)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*) (ニセナミハダニ)、ミカンサビダニ (*Phyllocopttruta oleivora*) (ミカンサビダニ)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) (チャノホコリダニ)、ヒメハダニ属 (*Brevipalpus* spp.) (ヒメハダニ)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*) (ウシダニ)、アメリカイヌカクダニ (*Dermacentor variabilis*) (アメリカイヌダニ)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) (ネコノミ)、ハモグリバエ属 (*Liomyza* spp.) (ハモグリムシ)、イエバエ (*Musca domestica*) (イエバエ)、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*) (蚊)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.) (蚊)、イエカ属 (*Culex* spp.) (蚊)、キンバエ属 (*Lucillia* spp.) (クロバエ)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) (ゴキブリ)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*) (ゴキブリ)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*) (ゴキブリ)、ムカシシロアリ科 (*Mastotermitidae*) (例えばマストテルメス属 (*Mastotermes* spp.))、レイビシロアリ科 (*Kalotermitidae*) (例えばネオテルメス属 (*Neotermes* spp.))、ミゾガシラシロアリ科 (*Rhinotermitidae*) (例えばイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*))、ミゾガシラシロアリ (*Reticulitermes flavipes*)、ヤマトシロアリ (*R. speratus*)、*R. ビルギニクス* (*R. virginicus*)、*R. ヘスペルス* (*R. hesperus*)、および *R. サントネンシス* (*R. santonensis*)) ならびにシロアリ科 (*Termitidae*) (例えばキイロマルガシラシロアリ (*Globitermes sulfureus*)) のシロアリ、アカカミアリ (*Solenopsis geminata*) (ヒアリ)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*) (ファラオアリ)、ダラミニア属 (*Damalinia* spp.) およびホソジラミ属 (*Linognathus* spp.) (ハジラミおよびシラミ)、ネコブセンチュウ属 (*Meloidogyne* spp.) (根こぶ線虫)、グロボデラ属 (*Globodera* spp.) およびヘテロデラ属 (*Heterodera* spp.) (シスト線

10

20

30

40

50

虫)、ネグサレセンチュウ属(*Pratylenchus* spp.) (根ぐされ線虫)、ロドフォラス属(*Rhodopholus* spp.) (バナナモグリ線虫)、ティレンキュラス属(*Tylenchulus* spp.) (ミカン線虫)、ヘモンカス・コントリウス(*Haemonchus contortus*) (捻転胃虫)、カエノラブディティス・エレガンス(*Caenorhabditis elegans*) (酢線虫)、トリコストロンギラス属(*Trichostrongylus* spp.) (胃腸蛔虫) およびノハラナメクジ(*Deroceras reticulatum*) (ナメクジ) が挙げられる。

【0876】

本発明の化合物は、ダイズ(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、トウモロコシ(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、サトウキビ(例えば、場合により20~200g/ヘクタール)、アルファルファ(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、アブラナ(例えば、場合により10~50g/ヘクタール)、ナタネ(例えばキャノーラ)(例えば、場合により20~70g/ヘクタール)、ジャガイモ(サツマイモを含む)(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、ワタ(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、コメ(例えば、場合により10~70g/ヘクタール)、コーヒー(例えば、場合により30~150g/ヘクタール)、柑橘類(例えば、場合により60~200g/ヘクタール)、アーモンド(例えば、場合により40~180g/ヘクタール)、果菜類(例えば、トマト、コショウ、トウガラシ、ナス、キュウリ、カボチャなど)(例えば、場合により10~80g/ヘクタール)、茶(例えば、場合により20~150g/ヘクタール)、鱗茎菜類(例えば、タマネギ、ポロネギなど)(例えば、場合により30~90g/ヘクタール)、ブドウ(例えば、場合により30~180g/ヘクタール)、仁果類(例えば、リンゴ、西洋ナシなど)(例えば、場合により30~180g/ヘクタール)、および核果類(例えば、西洋ナシ、プラムなど)(例えば、場合により30~180g/ヘクタール)を含む様々な植物において、有害生物防除のために使用され得る。

【0877】

本発明の化合物は、例えば、モロコシマダラメイガ(*Elasmopalpus lignosellus*)、アブデルスツノカブトムシ(*Diloboderus abderus*)、ディアブロティカ・スペシオサ(*Diabrotica speciosa*)、ステルネクス・スブシグナツス(*Sternechus subsignatus*)、アリ科(*Formicidae*)、タマナヤガ(*Agrotis ypsilon*)、ジュラス属の亜種(*Julus* ssp.)、アンチカルシア・ゲンマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、メガスセリス属の亜種(*Megascelis* ssp.)、プロコルニテルメス属の亜種(*Procornitermes* ssp.)、ケラ科(*Gryllotalpidae*)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*)、ピエゾドルス属(*Piezodorus* spp.)、アクロステルヌム属(*Acrosternum* spp.)、ネオメガロトムス属(*Neomegalotomus* spp.)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、エデッサ属(*Edessa* spp.)、リオゲニス・フスクス(*Liogenys fuscus*)、エウキスツス・ヘロス(*Euchistus heros*)、テッポウムシ(*stink bug*)、スカプトコリス・カスタネア(*Scaptocoris castanea*)、コガネムシ属(*Phyllorhiza* spp.)、シュードプルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、スポドプテラ属(*Spodoptera* spp.)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、コメツキ属(*Agriotes* spp.)を防除するために、ダイズにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、アブデルスツノカブトムシ(*Diloboderus abderus*)、ディアブロティカ・スペシオサ(*Diabrotica speciosa*)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*)、ピエゾドルス属(

10

20

30

40

50

Piezodorus spp.)、アクロステルヌム属 (*Acrosternum* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、エウキスツス・ヘロス (*Euchistus heros*)、コガネムシ属 (*Phyllophaga* spp.)、コメツキ属 (*Agriotes* spp.) を防除するために、ダイズにおいて使用される。

【0878】

本発明の化合物は、例えば、エウキスツス・ヘロス (*Euchistus heros*)、ディケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、アブデルスツノカブトムシ (*Diloboderus abderus*)、モロコシマダラメイガ (*Elasmopalpus lignosellus*)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、タマナヤガ (*Agrotis ypsilon*)、ディアブロティカ・スペシオサ (*Diabrotica speciosa*)、異翅目 (*Heteroptera*)、プロコルニテルメス属の亜種 (*Proconitermes* ssp.)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、アリ科 (*Formicidae*)、ジュラス属の亜種 (*Julus* ssp.)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ディアブロティカ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifer*)、モシス・ラチペス (*Mocis latipes*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ヘリオティス属 (*heliothis* spp.)、テトラニクス属 (*Tetranychus* spp.)、アザミウマ属 (*thrips* spp.)、コガネムシ属 (*phyllophaga* spp.)、スカプトコリス属 (*scaptocoris* spp.)、リオゲニス・フスクス (*Liogenys fuscus*)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、オストリニア属 (*Ostrinia* spp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、コメツキ属 (*Agriotes* spp.) を防除するために、トウモロコシにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、エウキスツス・ヘロス (*Euchistus heros*)、ディケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、アブデルスツノカブトムシ (*Diloboderus abderus*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ディアブロティカ・スペシオサ (*Diabrotica speciosa*)、ディアブロティカ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifer*)、テトラニクス属 (*Tetranychus* spp.)、アザミウマ属 (*thrips* spp.)、コガネムシ属 (*phyllophaga* spp.)、スカプトコリス属 (*scaptocoris* spp.)、コメツキ属 (*Agriotes* spp.) を防除するために、トウモロコシにおいて使用される。

【0879】

本発明の化合物は、例えば、オサゾウムシ属 (*Sphenophorus* spp.)、シロアリ、マハナルバ属 (*Mahanarva* spp.) を防除するために、サトウキビにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、シロアリ、マハナルバ属 (*Mahanarva* spp.) を防除するために、サトウキビにおいて使用される。

【0880】

本発明の化合物は、例えば、ヒペラ・ブルンネイペンニス (*Hypera brunneipennis*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、コリアス・エウリテメ (*Colias eurytheme*)、コロプス属 (*Collops* spp.)、エンポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エピトリクス (*Epitrix*)、ゲオコリス属 (*Geocoris* spp.)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、スピシスチルス属 (*Spissistilus* spp) 、スポド

10

20

30

40

50

プテラ属 (*Spodoptera* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*) を防除するために、アルファルファにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、ヒペラ・ブルンネイペンニス (*Hypera brunneipennis*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、エンポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エピトリクス (*Epitrix*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*) を防除するために、アルファルファにおいて使用される。

【0881】

本発明の化合物は、例えば、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、モンシロチョウ属 (*Pieris* spp.)、マメストラ属 (*Mamestra* spp.)、プルシア属 (*Plusia* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、フィロトレタ属 (*Phyllotreta* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、エンポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、アザミウマ属 (*thrips* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.) を防除するために、アブラナにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、モンシロチョウ属 (*Pieris* spp.)、プルシア属 (*Plusia* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、フィロトレタ属 (*Phyllotreta* spp.)、アザミウマ属 (*thrips* spp.) を防除するために、アブラナにおいて使用される。

【0882】

本発明の化合物は、例えば、メリゲテス属 (*Meligethes* sp)、シュートリンクス・ナピ (*Ceutorhynchus napi*)、プシロイデス属 (*Psyllioides* sp) を防除するために、ナタネ、例えばキャノーラにおいて使用される。

【0883】

本発明の化合物は、例えば、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、レプティノタルサ属 (*Leptinotarsa* sp)、ディアブロティカ・スペシオサ (*Diabrotica speciosa*)、フトリマエア属 (*Phthorimaea* sp)、パラトリオーザ属 (*Paratrioza* sp)、マラデラ・マトリダ (*Maladera matrıda*)、コメツキ属 (*Agriotes* sp) を防除するために、ジャガイモ (サツマイモを含む) において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、レプティノタルサ属 (*Leptinotarsa* sp)、ディアブロティカ・スペシオサ (*Diabrotica speciosa*)、フトリマエア属 (*Phthorimaea* sp)、パラトリオーザ属 (*Paratrioza* sp)、コメツキ属 (*Agriotes* sp) を防除するために、ジャガイモ (サツマイモを含む) において使用される。

【0884】

本発明の化合物は、例えば、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、ペクチノフォラ属 (*Pectinophora* sp)、ヘリオティス属 (*Heliothis* sp)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、メクラガメ属 (*Lygus* sp)、コガネムシ属 (*phyllophaga* sp)、スカプトコリス属 (*Scaptocoris* sp) を防除するために、ワタにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、メク

ラガメ属 (*Lygus* sp)、コガネムシ属 (*phyllophaga* sp)、スカプトコリス属 (*Scaptocoris* sp) を防除するために、ワタにおいて使用される。

【0885】

本発明の化合物は、例えば、レプトコリス属 (*Leptocorisa* sp)、クナファクロシス属 (*Cnaphalocrosis* sp)、ツドガ属 (*Chilo* sp)、スシルポファガ属 (*Scirpophaga* sp)、リッソロプトルス属 (*Lissorhopterus* sp)、オエバルス・プグナクス (*Oebalus pugnax*) を防除するために、コメにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、レプトコリス属 (*Leptocorisa* sp)、リッソロプトルス属 (*Lissorhopterus* sp)、オエバルス・プグナクス (*Oebalus pugnax*) を防除するために、コメにおいて使用される。

10

【0886】

本発明の化合物は、例えば、コーヒーノミクイムシ (*Hypothenemus Hampei*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera Coffeella*)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp) を防除するために、コーヒーにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、コーヒーノミクイムシ (*Hypothenemus Hampei*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera Coffeella*) を防除するために、コーヒーにおいて使用される。

【0887】

20

本発明の化合物は、例えば、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta oleivora*)、ヒメハダニ属 (*Brevipalpus* sp)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、ユナプシス属 (*Unaspis* sp)、ミバエ (*Ceratitis capitata*)、フィロクニスティス属 (*Phyllocnistis* sp) を防除するために、柑橘類において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta oleivora*)、ヒメハダニ属 (*Brevipalpus* sp)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、フィロクニスティス属 (*Phyllocnistis* sp) を防除するために、柑橘類において使用される。

30

【0888】

本発明の化合物は、例えば、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp) を防除するために、アーモンドにおいて使用され得る。

【0889】

本発明の化合物は、アザミウマ属 (*thrips* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、ポリファゴタルソネムス属 (*Polyphagotarsonemus* sp)、サビダニ属 (*Aculops* sp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* sp)、ヘリオティス属 (*Heliothis* sp)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ハモグリバエ属 (*Liriomyza* sp)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、コナジラミ属 (*Trialeurodes* sp)、パラトリオーザ属 (*Paratrioza* sp)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、アンソノムス属 (*Anthonomus* sp)、フィロトレタ属 (*Phyllotreta* sp)、アムラスカ属 (*Amrasca* sp)、ホシテントウ属 (*Epilachna* sp)、ハリオモルファ属 (*Halyomorpha* sp)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp)、レウシノデス属 (*Leucinodes* sp)

40

50

)、ネオレウシノデス属 (*Neoleucinodes* sp.) を防除するために、トマト、コショウ、トウガラシ、ナス、キュウリ、カボチャなどを含む果菜類において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、例えば、アザミウマ属 (*thrips* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、ポリファゴタルソネムス属 (*Polyphagotarsonemus* sp)、サビダニ属 (*Aculops* sp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* sp)、ヘリオティス属 (*heliothis* sp)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ハモグリバエ属 (*Liriomyza* sp)、パラトリオーザ属 (*Paratrioza* sp)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、アムラスカ属 (*Amrasca* sp)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp)、レウシノデス属 (*Leucinodes* sp)、ネオレウシノデス属 (*Neoleucinodes* sp) を防除するために、トマト、コショウ、トウガラシ、ナス、キュウリ、カボチャなどを含む果菜類において使用される。

10

【0890】

本発明の化合物は、例えば、シューダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis* sp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp)、チャノハマキホソガ (*Caloptilia theivora*) を防除するために、茶において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、スキルトスリプス属 (*Scirtothrips* sp) を防除するために、茶において使用される。

20

【0891】

本発明の化合物は、例えば、アザミウマ属 (*thrips* sp)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* sp)、ヘリオティス属 (*heliothis* sp) を防除するために、タマネギ、ポロネギなどを含む鱗茎菜類において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、アザミウマ属 (*thrips* sp) を防除するために、タマネギ、ポロネギなどを含む鱗茎菜類において使用される。

【0892】

本発明の化合物は、例えば、エンポアスカ属 (*Empoasca* sp)、ロベシア属 (*Lobesia* sp)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、リピフォロスリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips Cruentatus*)、エオテトラニクス・ウィラメッテイ (*Eotetranychus Willamettei*)、エリトロネウラ・エレガンツラ (*Erythroneura Elegantula*)、スカフォイデス属 (*Scaphoides* sp.) を防除するために、ブドウにおいて使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp)、リピフォロスリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips Cruentatus*)、スカフォイデス属 (*Scaphoides* sp) を防除するために、ブドウにおいて使用される。

30

40

【0893】

本発明の化合物は、例えば、カコプシラ属 (*Cacopsylla* sp)、キジラミ属 (*Psylla* sp)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*) を防除するために、リンゴ、西洋ナシなどを含む仁果類において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、カコプシラ属 (*Cacopsylla* sp)、キジラミ属 (*Psylla* sp)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) を防除するために、リンゴ、西洋ナシなどを含む仁果類において使用される。

【0894】

本発明の化合物は、例えば、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*

50

a)、スキルトスリップス属 (*Scirtothrips* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp) を防除するために、核果類において使用され得る。本発明の化合物は、好ましくは、スキルトスリップス属 (*Scirtothrips* sp)、アザミウマ属 (*thrips* sp)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* sp)、テトラニクス属 (*Tetranychus* sp) を防除するために、核果類において使用される。

【0895】

本発明の化合物は、アリ、トコジラミ (成虫)、ハチ、甲虫、ボックスエルダーバグ (*Boxelder Bug*)、クマバチ、ヒメマルカツオブシムシ、ムカデ、タバコ、甲虫、クローバービラハダニ、ゴキブリ、ヒラタコクヌストモドキ、コオロギ、ハサミムシ、マダラシミ、ノミ、ハエ、コナナガシנקイ、ヤスデ、蚊、コクヌストモドキ、ココクゾウムシ、ノコギリヒラタムシ、セイヨウシミ、ワラジムシ、クモ、シロアリ、マダニ、カリバチ、ゴキブリ、コオロギ、ハエ、ゴミムシ (*Litter Beetle*) (ゴミムシダマシ、ハラジロカツオブシムシ、およびシデムシなど)、蚊、ダンゴムシ、サソリ、クモ、ハダニ (ナミハダニ、トドマツノハダニ)、マダニを含む、動物施設の有害生物 (*animal housing pest*) を防除するのに使用され得る。

【0896】

本発明の化合物は、アリ (アカヒアリを含む)、ヨトウムシ、アザレアキャタピラー (*Azalea caterpillar*)、アブラムシ、ミノムシ、キンケクチフトゾウムシ (成虫)、ボックスエルダーバグ、ハマキガ、カリフォルニアオークワーム (*California oakworm*)、エダシャクトリ、ゴキブリ、コオロギ、ネキリムシ、オビカレハ、ニレハムシ、ヨーロッパハバチ (*European sawfly*)、アメリカシロヒトリ、ノミトビヨロイムシ、テンマクケムシ (*Forest tent caterpillar*)、マイマイガの幼虫、マメコガネ (成虫)、コガネムシ (*June beetle*) (成虫)、グンバイムシ、菜虫 (*Leaf-feeding caterpillar*)、ヨコバイ、ハモグリムシ (成虫)、ハマキムシ、ハマキモドキ (*Leaf skeletonizer*)、ミジ、蚊、オレアンダーモスの幼虫 (*Oleander moth larvae*)、ダンゴムシ、マツハバチ、マツノキクイムシ、マツノシンマダラメイガ、カスミカメムシ、ルートゾウムシ (*Root weevil*)、ハバチ、カイガラムシ (幼虫)、クモ、アワフキムシ、縞のあるハムシ (*Striped beetle*)、縞のあるオークワーム (*Striped oakworm*)、アザミウマ、メイガ (*Tip moth*)、ドクガの幼虫、カリバチ、チャノホコリダニ、ヒラタカタカイガラムシ、アカマルカイガラムシ (幼虫)、クローバービラハダニ、コナカイガラムシ、マツノハマルカイガラムシ (*Pineneedlescale*) (幼虫)、ハダニ、コナジラミを含む、観賞植物の有害生物 (*ornamental pest*) を防除するのに使用され得る。

【0897】

本発明の化合物は、アリ (アカヒアリを含む)、ヨトウムシ、ムカデ、コオロギ、ネキリムシ、ハサミムシ、ノミ (成虫)、バッタ、マメコガネ (成虫)、ヤスデ、ダニ、蚊 (成虫)、ダンゴムシ、ツトガ、ワラジムシ、マダニ (ライム病を伝播する種を含む)、ブルーグラスゾウムシ (*Bluegrass billbug*) (成虫)、ブラックターフグラスアテニウス (*Black turfgrass ataenius*) (成虫)、ツツガムシの幼虫、ノミ (成虫)、カブトムシの幼虫 (サプレッション (*suppression*))、スズメノカタビラゾウムシ (成虫)、ケラ (幼虫および若成虫)、ケラ (成虫)、ナンキンムシを含む、芝生の有害生物 (*turf pest*) を防除するのに使用され得る。

【0898】

したがって、本発明は、動物有害生物、例えば無脊椎動物有害生物に対処および／またはそれを防除する方法を提供し、この方法は、殺虫的に有効な量の式 (I) の化合物を、

10

20

30

40

50

有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含む。特に、本発明は、昆虫、ダニ、線虫または軟体動物に対処および／またはそれを防除する方法を提供し、この方法は、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物に有効な量の式（I）の化合物、または式（I）の化合物を含有する組成物を、有害生物、有害生物の場所、好ましくは、植物、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含み、式（I）の化合物は、好ましくは、昆虫、ダニまたは線虫に対して使用される。

【0899】

本明細書において使用される「植物」という用語は、苗、低木および高木を含む。作物は、従来の品種改良方法または遺伝子組み換えによって除草剤または除草剤の種類（例えばALS-、GS-、EPSPS-、PPO-およびHPPD阻害剤）に対する耐性を与えられた作物も含むことが理解されるべきである。従来の品種改良方法によってイミダゾリノン、例えばイマザモックス（imazamox）に対する耐性を与えられた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（キャノーラ）である。遺伝子組み換え方法によって除草剤に対する耐性を与えられた作物の例としては、例えば、Roundup Ready（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）の商標名で市販されているグリホサート耐性およびグルホシネート耐性トウモロコシ種が挙げられる。

【0900】

本発明の化合物は、植物部位に施用され得る。植物部位は、シュート、葉、花および根などの、地上および地下の植物の全ての部位および器官を意味することが理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、柄、茎、花、子実体、果実、種子、根、塊茎および根茎である。植物部位には、収穫物、ならびに栄養成長および生殖繁殖材料、例えば挿し木、塊茎、根茎、分枝および種子も含まれる。活性化合物による、植物および植物部位の、本発明に係る処置は、慣例的な処置方法、例えば、浸漬、噴霧、蒸発、霧化（fogging）、散布、塗布（painting on）、注入（injecting）によって、また、繁殖材料の場合、特に、種子の場合、1回以上のコーティングを適用することによって、直接、あるいは植物の周囲環境、生息環境または収納場所に対して化合物を作用させることによって行われる。

【0901】

式Iの化合物は、遺伝子組み換え方法によっておよび／または従来の方法によって得られるトランスジェニック植物（栽培品種を含む）において使用され得る。これらは、従来の育種、突然変異または組み換えDNA技術によって得られた新規な特性（「形質」）を有する植物を意味することが理解される。植物種または植物栽培品種、それらの場所および成長条件（土壌、気候、生育期間、栄養（diet））に応じて、本発明に係る処置は、超相加的な（superadditive）「相乗」効果ももたらし得る。

【0902】

このため、例えば、減少した施用量および／または活性スペクトルの拡大および／または本発明にしたがって使用され得る物質および組成物の活性の増加、より良好な植物成長、高温または低温に対する向上した耐性、乾燥または含水量もしくは土壌塩含量に対する向上した耐性、向上した開花性能（flowering performance）、より容易な収穫、加速した成熟、より高い収穫高、収穫産物のより高い品質および／またはより高い栄養価、収穫産物のより良好な貯蔵安定性および／または加工性が可能であり、これは、実際に予測された効果を上回る。

【0903】

本発明にしたがって処置される好ましいトランスジェニック植物または植物栽培品種は、遺伝子組み換えによって、これらの植物に特に有利で有用な形質を与える遺伝物質を与えられた全ての植物を含む。このような形質の例は、より良好な植物成長、高温または低温に対する向上した耐性、乾燥または含水量もしくは土壌塩含量に対する向上した耐性、向上した開花性能、より容易な収穫、加速した成熟、より高い収穫高、収穫産物のより高い品質および／またはより高い栄養価、収穫産物のより良好な貯蔵安定性および／または加工性である。

【0904】

このような形質のさらなる特に強調される例は、昆虫、ダニ、植物病害真菌の菌・カビ、細菌および／またはウイルスなど、動物および微生物有害生物に対する植物のより良好な防護、また、特定の除草活性化化合物に対する植物の向上した耐性である。

【0905】

挙げられるトランスジェニック植物の例は、穀物（コムギ、コメ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、サトウダイコン、トマト、エンドウマメおよび他の野菜類、ワタ、タバコ、ナタネ、さらにまた果物植物（リンゴ、西洋ナシ、柑橘類およびブドウの果物を含む）などの重要な作物である。

【0906】

式Iの化合物は、トランスジェニック植物に、有害生物、例えば昆虫有害生物、線虫有害生物などに対する耐性または抵抗性を与える1つ以上の殺虫性タンパク質を産生することが可能なトランスジェニック植物において使用され得る。このような殺虫性タンパク質としては、限定はされないが、バチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry2Ae、Cry3A、Cry3Bb、またはCry9Cに由来するCryタンパク質；改変されたCry3A（米国特許第7,030,295号明細書）またはCry1A.105などの遺伝子組み換えタンパク質；またはVip1、Vip2またはVip3などの植物性殺虫性タンパク質が挙げられる。本発明に有用なBt Cryタンパク質およびVIPの詳細な一覧は、インターネット上で、サセックス大学 (*University of Sussex*) によって管理されている *Bacillus thuringiensis Toxin Nomenclature Database* において見ることができる (*Crickmore et al. (1998) Microbiol. Mol. Biol. Rev. 62:807-813* も参照のこと)。本発明に有用な他の殺虫性タンパク質としては、線虫、例えばフォトラブダス属の亜種 (*Photorhabdus spp.*) またはゼノラブダス属の亜種 (*Xenorhabdus spp.*) のコロニーを作る細菌のタンパク質；サソリ毒、クモ毒、ハチ毒、または他の昆虫特有の神経毒などの、動物によって生成される毒；放線菌 (*Streptomyces*) 毒などの菌・カビによって生成される毒、エンドウレクチンまたはオオムギ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 (*patatin*)、シスタチンまたはパバイン阻害剤などのプロテイナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン (*luffin*)、サポリンまたはブリオジン (*bryodin*) などのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP)；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-IDP-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、エクジソン阻害剤またはHMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素；ナトリウムまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体 (ヘリコキニン (*helicokinin*) 受容体)；スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼまたはグルカナーゼが挙げられる。このような殺虫性タンパク質またはこのようなタンパク質を合成することが可能なトランスジェニック植物のさらなる例が、例えば、欧州特許出願公開第374753号明細書、国際公開第93/007278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書、国際公開第03/18810号パンフレットおよび国際公開第03/52073号パンフレットに開示されている。このようなトランスジェニック植物を生産するための方法は、当業者に公知であり、*AgriSure* (登録商標) CB(P1) (Cry1Abを生成するトウモロコシ)、*AgriSure* (登録商標) RW(P2) (mCry3Aを生成するトウモロコシ)、*AgriSure* (登録商標) *Viptera* (P3) (Vip3Aaを生成するトウモロコシ雑種)；*AgriSure* 300GT (P4) (Cry1AbおよびmCry3Aを生成するトウモロコシ雑種)；*YieldGard* (登録商標) (P5) (Cry1Abタンパク質を生成するトウモ

10

20

30

40

50

ロコシ雑種)、YieldGard (登録商標) Plus (P6) (Cry1AbおよびCry3Bb1を生成するトウモロコシ雑種)、Genuity (登録商標) Smart Stax (登録商標) (P7) (Cry1A. 105、Cry2Ab2、Cry1F、Cry34/35、Cry3Bbを含むトウモロコシ雑種); Herculex (登録商標) I (P8) (Cry1Faを生成するトウモロコシ雑種) および Herculex (登録商標) RW (P9) (Cry34Ab1、Cry35Ab1および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] を生成するトウモロコシ雑種); NuCOTN (登録商標) 33B (P10) (Cry1Acを生成するワタ栽培品種)、 Bollgard (登録商標) I (P11) (Cry1Acを生成するワタ栽培品種)、 Bollgard (登録商標) II (P12) (Cry1AcおよびCry2Ab2を生成するワタ栽培品種) および VIPCOT (登録商標) (P13) (Vip3Aaを生成するワタ栽培品種) など、そのうちのいくつかが市販されている。ダイズシストセンチュウ耐性ダイズ (SCN (登録商標) - Syngenta (P14)) およびアブラムシ耐性形質を有するダイズ (AMT (登録商標) (P15)) も興味深い。

10

【0907】

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：

【0908】

1. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt11 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10 (P16)。切断型 CryIA (b) 毒素の遺伝子導入による発現によってアワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*) およびセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による攻撃に対して耐性にされた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11 トウモロコシはまた、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 を遺伝子導入により発現させる。

20

【0909】

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt176 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10 (P17)。CryIA (b) 毒素の遺伝子導入による発現によってアワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*) およびセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による攻撃に対して耐性にされた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176 トウモロコシはまた、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 を遺伝子導入により発現させる。

30

【0910】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の MIR604 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10 (P18)。改変された CryIIIA 毒素の遺伝子導入による発現によって耐虫性を与えられたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-D-プロテアーゼ認識配列の挿入によって改変された Cry3A055 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作製が、国際公開第 03/018810 号パンフレットに記載されている。

40

【0911】

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 (P19)。MON 863 は、CryIIIB (b1) 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。

【0912】

5. Monsanto Europe S. A. (270-272 Avenue d

50

e Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02 (P20)。

【0913】

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 (P21)。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためのタンパク質Cry1Fの発現およ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。

【0914】

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 (P22)。遺伝子組み換え種NK603およびMON 810を交配することによる従来法で育種された雑種トウモロコシ種からなる。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.) 株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS、および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し、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CryIA (b) 毒素も遺伝子導入により発現させる。

【0915】

非常に興味深いトランスジェニック植物のさらなる例は、2. 4D (例えばEnlist (登録商標)) (例えば国際公開第2011066384号パンフレット) (P23)、グリホサート (例えばRoundup Ready (登録商標) (P24)、Roundup Ready 2 Yield (登録商標) (P25))、スルホニル尿素 (例えばSTS (登録商標)) (P26)、グルホシネート (例えばLiberty Link (登録商標) (P27)、Ignite (登録商標) (P28))、ジカンバ (P29) (Monsanto)、HPPD耐性 (P30) (例えばイソキサフルトール除草剤) (Bayer CropScience、Syngenta) に対する抵抗性を与える形質を有するものである。グリホサートおよびスルホニル尿素耐性 (例えばOptimum GAT (登録商標)) (P31)、STS (登録商標) およびRoundup Ready (登録商標) (P32) がスタックされた (stacked) 植物またはSTS (登録商標) およびRoundup Ready 2 Yield (登録商標) (P33) がスタックされた植物)、ジカンバおよびグリホサート耐性 (P34) (Monsanto) を含め、本明細書に記載される形質のいずれかの二重または三重スタックも興味深い。特に興味深いのは、2. 4D (例えばEnlist (登録商標))、グリホサート (例えばRoundup Ready (登録商標)、Roundup Ready 2 Yield (登録商標))、スルホニル尿素 (例えばSTS (登録商標))、グルホシネート (例えばLiberty Link (登録商標)、Ignite (登録商標))、ジカンバ (Monsanto)、HPPD耐性 (例えばイソキサフルトール除草剤) (Bayer CropScience、Syngenta) に対する抵抗性を与える形質を有するダイズ植物である。グリホサートおよびスルホニル尿素耐性 (例えばOptimum GAT (登録商標)、STS (登録商標) およびRoundup Ready (登録商標) またはRoundup Ready 2 Yield (登録商標) がスタックされた植物)、ジカンバおよびグリホサート耐性 (Monsanto) を含め、本明細書に記載される形質のいずれかのダイズ植物における二重または三重スタックも興味深い。耐虫性植物のトランスジェニック作物も、BATS (Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Re

10

20

30

40

50

port 2003, (<http://bats.ch>)に記載されている。

【0916】

殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺軟体動物剤としての式(I)の化合物を、有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用するために、式(I)の化合物は、通常、式(I)の化合物に加えて、好適な不活性希釈剤または担体および、場合により、表面活性剤(SFA)を含む組成物へと製剤化される。SFAは、界面張力を低下させ、それによって他の特性(例えば分散、乳化および湿潤)を変化させることによって、界面(例えば、液/固、液/気または液/液界面)の特性を変更することができる化学薬品である。全ての組成物(固体製剤および液体製剤の両方)が、式(I)の化合物の0.0001~95重量%、より好ましくは1~85重量%、例えば5~60重量%を占めることが好ましい。この組成物は、一般に、式(I)の化合物が0.1g~10kg/ヘクタール、好ましくは1g~6kg/ヘクタール、より好ましくは1g~1kg/ヘクタールの割合で施用されるように、有害生物の防除に使用される。

10

【0917】

種子粉衣に使用される場合、式(I)の化合物は、種子1キログラム当たり0.0001g~10g(例えば0.001gまたは0.05g)、好ましくは0.005g~10g、より好ましくは0.005g~4gの割合で一般に使用される。

【0918】

別の態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の式(I)の化合物を含む組成物、特に、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物に有効な量の式(I)の化合物と、それに適した担体または希釈剤とを含む殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物組成物を提供する。組成物は、好ましくは、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物組成物である。

20

【0919】

この組成物は、粉剤(DP)、水溶剤(SP)、水溶顆粒(SG)、水和性顆粒(WG)、水和剤(WP)、粒剤(GR)(徐放性又は即放性)、可溶濃縮剤(SL)、油混和性液剤(OL)、超低量液剤(UL)、乳化性濃縮物(EC)、分散性濃縮物(DC)、乳剤(水中油(EW)および油中水(EO)の両方)、マイクロエマルジョン(ME)、懸濁濃縮物(SC)、エアゾール、薫蒸/燻煙剤(fogging/smoke formulation)、カプセル懸濁剤(CS)および種子処理製剤を含む多くの剤型から選択することができる。いずれの場合も、選択される剤型は、想定される具体的な目的ならびに式(I)の化合物の物理的、化学的及び生物学的特性に応じて決まるであろう。

30

【0920】

粉剤(DP)は、式(I)の化合物を、1種以上の固体希釈剤(例えば天然粘土、カオリン、葉ろう石、ペントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、キーゼルグール、チョーク、珪藻土、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよび炭酸マグネシウム、硫黄、石灰、小麦粉、タルクならびに他の有機および無機固体担体)と混合し、この混合物を微粉末へと機械的に粉砕することによって調製され得る。

【0921】

水溶剤(SP)は、水への分散性/溶解性を改善するために、式(I)の化合物を、1種以上の水溶性無機塩(炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウムまたは硫酸マグネシウムなど)または1種以上の水溶性有機固体(多糖など)および、場合により、1種以上の湿潤剤、1種以上の分散剤または前記物質の混合物と混合することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水溶顆粒(SG)を形成してもよい。

40

【0922】

水和剤(WP)は、式(I)の化合物を、1種以上の固体希釈剤または担体、1種以上の湿潤剤ならびに、好ましくは、1種以上の分散剤および、場合により、1種以上の懸濁化剤と混合して、液体中の分散を促進することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水和性顆粒(WG)を形成してもよい。

50

【0923】

粒剤 (GR) は、式 (I) の化合物と 1 種以上の粉末化された固体希釈剤または担体との混合物を造粒することによるか、あるいは式 (I) の化合物 (または好適な物質中のその溶液) を、多孔質の顆粒物質 (軽石、アタパルジャイト粘土、フラー土、キーズルグール、珪藻土または粉碎されたトウモロコシの穂軸など) 中に吸収することによるか、または式 (I) の化合物 (または好適な物質中のその溶液) を、硬質のコア材 (砂、ケイ酸塩、無機の炭酸塩、硫酸塩またはリン酸塩など) 上に吸着し、必要に応じて乾燥させることによって、予め形成されたブランク顆粒 (blank granule) から造粒することによるかのいずれかによって形成され得る。吸収または吸着を補助するのに一般的に使用される物質としては、溶媒 (例えば脂肪族および芳香族石油系溶媒、アルコール、エーテル、ケトンおよびエステルなど) および固着剤 (ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖類および植物油など) が挙げられる。また、1 種以上の他の添加剤が、粒剤に含まれてもよい (例えば乳化剤、湿潤剤または分散剤)。

10

【0924】

分散性濃縮物 (DC) は、式 (I) の化合物を、水あるいはケトン、アルコールまたはグリコールエーテルなどの有機溶媒に溶解させることによって調製され得る。これらの溶液は、(例えば水希釈性を改善し、または噴霧タンク中の結晶化を防止するために) 表面活性剤を含有してもよい。

【0925】

乳化性濃縮物 (EC) または水中油乳剤 (EW) は、式 (I) の化合物を、有機溶媒 (場合により、1 種以上の湿潤剤、1 種以上の乳化剤または前記物質の混合物を含有する) に溶解させることによって調製され得る。EC に使用するのに適した有機溶媒としては、芳香族炭化水素 (SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 および SOLVESSO 200 によって例示されるアルキルベンゼンまたはアルキルナフタレンなど; SOLVESSO は登録商標である)、ケトン (シクロヘキサノンまたはメチルシクロヘキサノンなど) およびアルコール (ベンジルアルコール、フルフリルアルコールまたはブタノールなど)、N-アルキルピロリドン (N-メチルピロリドンまたは N-オクチルピロリドンなど)、脂肪酸のジメチルアミド ($C_8 \sim C_{10}$ 脂肪酸のジメチルアミドなど) および塩素化炭化水素が挙げられる。EC 製品は、水に加えると自然に乳化して、適切な装置によって噴霧施用可能なほど十分な安定性を有する乳剤を生成し得る。EW の調製は、式 (I) の化合物を液体として (それが室温で液体でない場合、適当な温度、典型的に 70°C 未満で溶融させてもよい) または溶液中で (それを適切な溶媒に溶解させることによって) 得る工程と、次に、得られた液体または溶液を高せん断下で、1 種以上の SFA を含有する水へ乳化して、乳剤を生成する工程とを含む。EW に使用するのに適した溶媒としては、植物油、塩素化炭化水素 (クロロベンゼンなど)、芳香族溶媒 (アルキルベンゼンまたはアルキルナフタレンなど) および水溶性の低い他の適切な有機溶媒が挙げられる。

20

30

【0926】

マイクロエマルジョン (ME) は、水を、1 種以上の SFA と 1 種以上の溶媒とのブレンドと混合して、熱力学的に安定した等方性 (isotropic) 液体製剤を自然に生じさせることによって調製され得る。式 (I) の化合物は、最初、水または溶媒 / SFA ブレンドのいずれかの中に存在する。ME に使用するのに適した溶媒としては、EC または EW への使用に関して上述したものが挙げられる。ME は、水中油または油中水系のいずれかであり得 (どちらの系が存在するかは、伝導度測定によって決定され得る)、水溶性および油溶性有害生物防除剤を同じ製剤中で混合することに適し得る。ME は、水へ希釈するのに適しており、マイクロエマルジョンのまま残るかまたは従来の水中油乳剤を形成する。

40

【0927】

懸濁濃縮物 (SC) は、式 (I) の化合物の微粉化された不溶性固体粒子の水性または非水性懸濁液を含み得る。SC は、好適な媒体中で、式 (I) の固体化合物を、場合によ

50

り1種以上の分散剤とともにボールミル粉碎またはビーズミル粉碎して、この化合物の微粒子懸濁液を生成することによって調製され得る。1種以上の湿潤剤が、組成物に含まれてもよく、懸濁化剤が、粒子の沈降速度を低下させるために含まれてもよい。あるいは、式(I)の化合物は、乾式ミル粉碎され、上述した物質を含有する水に加えられて、所望の最終生成物を生成してもよい。

【0928】

エアゾール製剤は、式(I)の化合物および好適な噴射剤(例えばn-ブタン)を含む。式(I)の化合物はまた、好適な媒体(例えば水またはn-プロパノールなどの水混和性液体)に溶解または分散されて、非加圧式の、手動噴霧ポンプにおいて使用するための組成物が得られる。

10

【0929】

式(I)の化合物は、閉鎖された空間において、この化合物を含有する煙を生成するのに適した組成物を形成するために、火工品(pyrotechnic)混合物と乾燥状態で混合されてもよい。

【0930】

カプセル懸濁剤(CS)は、各油滴がポリマーシェールによって封入され、かつ式(I)の化合物および、場合により、そのための担体または希釈剤を含有する油滴の水性分散液が得られる追加の重合段階を伴う以外は、EW製剤の調製と同様の方法で調製され得る。ポリマーシェールは、界面重縮合反応またはコアセルベーション手順のいずれかによって生成され得る。この組成物は、式(I)の化合物の制御放出を提供し、種子処理に使用されてもよい。式(I)の化合物はまた、生分解性ポリマーマトリックス中で製剤化されて、この化合物の遅延制御放出を提供することができる。

20

【0931】

組成物は、組成物の生物学的性能を改善するために(例えば表面上の湿潤、保持または分散;処理された表面における耐雨性;あるいは式(I)の化合物の取り込みまたは移動性を改善することによる)、1種以上の添加剤を含んでいてもよい。このような添加剤としては、表面活性剤、油系噴霧添加剤、例えば特定の鉱油または天然植物油(ダイズ油およびナタネ油など)、およびこれらと、他の生物学的強化(bio-enhancing)助剤(式(I)の化合物の作用を補助し、または調整し得る成分)とのブレンドが挙げられる。

30

【0932】

式(I)の化合物はまた、種子処理、例えば乾燥種子処理用の粉剤(DS)、水溶性粉剤(SS)またはスラリー処理用の水和性粉剤(WS)を含む粉末組成物として、あるいはフロアブル剤(FS)、液剤(LS)またはカプセル懸濁剤(CS)を含む液体組成物として使用するために製剤化され得る。DS、SS、WS、FSおよびLS組成物の調製は、それぞれ、上述したDP、SP、WP、SCおよびDC組成物の調製と非常に類似している。種子を処理するための組成物は、組成物の種子への付着を補助する物質(例えば鉱油または塗膜形成バリア)を含んでいてもよい。

【0933】

湿潤剤、分散剤および乳化剤は、カチオン型、アニオン型、両性イオン型または非イオン型の表面SFAであってもよい。

40

【0934】

好適なカチオン型のSFAとしては、第四級アンモニウム化合物(例えば臭化セチルトリメチルアンモニウム)、イミダゾリンおよびアミン塩が挙げられる。

【0935】

好適なアニオン型SFAとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩(例えばラウリル硫酸ナトリウム)、スルホン化された芳香族化合物の塩(例えばドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、スルホン酸ブチルナフタレンならびにジ-イソプロピル-およびトリ-イソプロピル-ナフタレンスルホン酸ナトリウムの混合物)、硫酸エーテル、硫酸アルコールエーテル(例えば

50

ラウレスー３－硫酸ナトリウム）、カルボン酸エーテル（例えばラウレスー３－カルボン酸ナトリウム）、リン酸エステル（１種以上の脂肪族アルコールとリン酸との反応からの生成物（主にモノ－エステル）または五酸化リン（主に、ジ－エステル）、例えばラウリルアルコールとテトラリン酸との反応物；さらにこれらの生成物は、エトキシ化されていてもよい）、スルホスクシナメート（*sulfosuccinamate*）、パラフィンまたはオレフィンスルホネート、タウレートおよびグリグノスルホネートが挙げられる。

【０９３６】

好適な両性型のＳＦＡとしては、ベタイン、プロピオネートおよびグリシネートが挙げられる。

【０９３７】

好適な非イオン型のＳＦＡとしては、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドなどのアルキレンオキシドまたはそれらの混合物の、脂肪族アルコール（オレイルアルコールまたはセチルアルコールなど）またはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノールまたはオクチルクレゾールなど）との縮合生成物；長鎖脂肪酸または無水ヘキシトールから誘導される部分エステル；前記部分エステルのエチレンオキシドとの縮合生成物；ブロックポリマー（エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドを含む）；アルカノールアミド；単純なエステル（例えば脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミノオキシド（例えばラウリルジメチルアミノオキシド）；およびレシチンが挙げられる。

【０９３８】

好適な懸濁化剤としては、親水コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドンまたはナトリウムカルボキシメチルセルロースなど）および膨潤粘土（ベントナイトまたはアタパルジャイトなど）が挙げられる。

【０９３９】

式（Ｉ）の化合物は、殺虫化合物の公知の施用手段のいずれかによって施用され得る。例えば、式（Ｉ）の化合物は、製剤化された状態または製剤化されていない状態で、有害生物または有害生物の場所（有害生物の生息場所、または有害生物が蔓延しやすい栽培植物など）または葉、茎、枝または根を含む植物のいずれかの部分に、植えられる前の種子にまたは植物が生育し、または植えられる他の媒体（根の周囲の土壌、土壌一般、水田の水または水耕栽培系など）に、直接施用されてもよく、あるいは噴霧、粉衣、浸漬による施用、クリームまたはペースト製剤としての施用、蒸気としての施用あるいは土壌または水性環境への組成物（顆粒組成物または水溶性バッグに充填された組成物など）の散布または導入による施用を行ってもよい。

【０９４０】

式（Ｉ）の化合物はまた、動電型の噴霧技術または他の低容量の方法を用いて、植物に注入されるかまたは植生に噴霧されてもよく、あるいは地上または空中灌漑システム（*land or aerial irrigation system*）によって施用されてもよい。

【０９４１】

水性調製物（水溶液または分散液）として使用される組成物は、一般に高い割合の活性成分を含有する濃縮物の形態で供給され、この濃縮物は、使用前に水に加えられる。これらの濃縮物としては、ＤＣ、ＳＣ、ＥＣ、ＥＷ、ＭＥ、ＳＧ、ＳＰ、ＷＰ、ＷＧおよびＣＳが挙げられ、これらは、多くの場合、長期間の貯蔵に耐え、このような貯蔵の後、水に加えると、従来の噴霧装置によって施用できるほど十分な時間にわたって均質なままである水性調製物を形成可能であることが必要である。このような水性調製物は、使用される目的に応じて様々な量の式（Ｉ）の化合物（例えば０．０００１～１０重量％）を含有してもよい。

【０９４２】

式（Ｉ）の化合物は、肥料（例えば窒素－、カリウム－またはリン含有肥料）との混合物中で使用され得る。好適な剤型としては、肥料の顆粒が挙げられる。この混合物は、好

10

20

30

40

50

ましくは最大で25重量%の式(I)の化合物を含有する。

【0943】

したがって、本発明は、肥料と式(I)の化合物とを含む肥料組成物も提供する。

【0944】

本発明の組成物は、生物学的活性を有する他の化合物、例えば微量栄養素あるいは殺菌・殺カビ活性を有する化合物または植物成長の調節、除草、殺虫、殺線虫または殺ダニの活性を有する化合物を含有してもよい。

【0945】

式(I)の化合物は、組成物の単独の活性成分であってもよく、または必要に応じて有害生物防除剤、例えば、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤もしくは除草剤、または共力剤もしくは植物成長調節剤などの1種以上の追加の活性成分と混合されてもよい。追加の活性成分は：より広い活性スペクトルまたは施用場所におけるより増大された残留性を有する組成物を提供し；式(I)の化合物の活性を相乗し、または活性を補完し（例えば作用の速度を速め、または撥性(repellency)を克服することによって）；あるいは個々の成分に対する耐性の発生を克服または防止するのを補助し得る。特定の追加の活性成分は、組成物の意図される用途に応じて決まる。好適な有害生物防除剤の例としては、以下のものが挙げられる：

a) ペルメトリン、シペルメトリン、フェンバレート、エスフェンバレート、デルタメトリン、シハロトリン（特に入-シハロトリンおよびγ-シハロトリン）、ピフェントリン、フェンプロパトリン、シフルトリン、テフルトリン、魚に安全なピレスロイド（例えばエトフェンプロクス）、天然ピレトリン、テトラメトリン、S-ビオアレトリン、フェンフルトリン、プラレトリンまたは5-ベンジル-3-フリルメチル-(E)-(1R, 3S)-2, 2-ジメチル-3-(2-オキシチオラン-3-イリデンメチル)シクロプロパンカルボキシレートなどのピレスロイド；

b) プロフェノホス、スルプロオス、アセフェート、メチルパラチオン、アジンホス-メチル、デメトン-s-メチル、ヘプテノホス、チオメトン、フェナミホス、モノクロトホス、プロフェノホス、トリアゾホス、メタミドホス、ジメトエート、ホスファミドン、マラチオン、クロルピリホス、ホサロン、テルブホス、フェンスルホチオン、ホノホス、ホレート、ホキシム、ピリミホス-メチル、ピリミホス-エチル、フェニトロチオン、ホスチアゼートまたはジアジノンなどの有機ホスフェート；

c) ピリミカルブ、トリアザメート、クロエトカルブ、カルボフラン、フラチオカルブ、エチオフェンカルブ、アルジカルブ、チオフロックス、カルボスルファン、ベンジオカルブ、フェノブカルブ、プロボクサー、メトミルまたはオキサミルなどのカルバメート（アリールカルバメートを含む）；

d) ジフルベンズロン、トリフルムロン、ヘキサフルムロン、フルフェノクスロン、ジアフェンチウロン、ルフェネロンまたはクロルフルアズロンなどのベンゾイル尿素；

e) シヘキサチン、酸化フェンブタスズまたはアゾシクロチンなどの有機スズ化合物；

f) テブフェンピラドおよびフェンピロキシメートなどのピラゾール；

g) アベルメクチンまたはミルベマイシン、例えばアバメクチン、エマメクチンベンゾエート、イベルメクチン、ミルベマイシン、スピノサド、アザジラクチンまたはスピネトラムなどのマクロライド；

h) ホルモンまたはフェロモン；

i) エンドスルファン（特にα-エンドスルファン）、ベンゼンヘキサクロリド、DDT、クロルダンまたはジェルドリンなどの有機塩素化合物；

j) クロルジメホルムまたはアミトラズなどのアミジン；

k) クロロピクリン、ジクロロプロパン、臭化メチルまたはメタムなどの燻蒸剤；

l) イミダクロプリド、チアクロプリド、アセタミプリド、ニテンピラム、ジノテフラン、チアメトキサム、クロチアニジン、ニチアジンまたはフロニカミドなどのネオニコチノイド化合物；

m) テブフェノジド、クロマフェノジドまたはメトキシフェノジドなどのジアシルヒド

10

20

30

40

50

ラジン；

n) ジオフェノランまたはピリプロキシフェンなどのジフェニルエーテル；

o) インドキサカルブ；

p) クロルフエナピル；

q) ピメトロジン；

r) スピロテトラマト、スピロジクロフェンまたはスピロメシフェン；

s) フルベンジアミド、クロラントラニリプロール (R y n a x y p y r (登録商標))
) またはシアントラニリプロールなどのジアミド；

t) スルホキサフロール；または

u) メタフルミゾン；

v) フィプロニルおよびエチプロール；

w) ピリフルキナゾン；

x) ブプロフェジン；または

y) 4-[(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-(2,2-ジフルオロエチル)-アミノ]-5H-フラン-2-オン (DE 102006015467号明細書)

。

z) フルピラジフロン

aa) CAS: 915972-17-7 (国際公開第2006129714号パンフレット；国際公開第2011/147953号パンフレット；国際公開第2011/147952号パンフレット)

ab) CAS: 26914-55-8 (国際公開第2007020986号パンフレット)

【0946】

組成物の意図される用途に適している場合、上に列挙した有害生物防除剤の主な化学薬品の種類に加えて、特定の標的を有する他の有害生物防除剤が、組成物に用いられてもよい。例えば、特定の作物に対する選択的殺虫剤、例えばコメに使用されるメイガ特異的殺虫剤 (カルタップなど) またはウンカ特異的殺虫剤 (ブプロフェジンなど) が用いられてもよい。あるいは特定の昆虫の種/段階に特異的な殺虫剤または殺ダニ剤 (例えば、クロフェンテジン、フルベンジミン、ヘキシチアゾックスまたはテトラジホンなどの殺ダニ性卵-幼虫駆除剤；ジコホールまたはプロパルギットなどの殺ダニ性運動阻害剤 (a c a r i c i d a l m o t i l i c i d e)；ブロモプロピレートまたはクロルベンジレートなどの殺ダニ剤；あるいはヒドラメチルノン、シロマジン、メトプレン、クロルフルアズロンまたはジフルベンズロンなどの成長調節剤) も組成物に含まれてもよい。

【0947】

本発明の組成物に含まれ得る殺菌・殺カビ化合物の例は、(E)-N-メチル-2-[2-(2,5-ジメチルフェノキシメチル)フェニル]-2-メトキシイミノアセトアミド (SSF-129)、4-ブromo-2-シアノ-N, N-ジメチル-6-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-1-スルホンアミド、α-[N-(3-クロロ-2,6-キシリル)-2-メトキシアセトアミド]-γ-ブチロラクトン、4-クロロ-2-シアノ-N, N-ジメチル-5-p-トリルイミダゾール-1-スルホンアミド (IKF-916、シアミダゾスルファミド (c y a m i d a z o s u l f a m i d))、3-5-ジクロロ-N-(3-クロロ-1-エチル-1-メチル-2-オキソプロピル)-4-メチルベンズアミド (RH-7281、ゾキサミド)、N-アリル-4,5-ジメチル-2-トリメチルシリルチオフェン-3-カルボキサミド (MON65500)、N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)-2-(2,4-ジクロロフェノキシ)-プロピオンアミド (AC382042)、N-(2-メトキシ-5-ピリジル)-シクロプロパンカルボキサミド、アシベンゾラル (CGA245704) (例えばアシベンゾラル-S-メチル)、アラニカルブ、アルジモルフ、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル、ベノミル、ベンチアバリカルブ、ピロキサゾール、ピテルタノール、ピキサフェン、ブラストサイジンS、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブピリメート、

10

20

30

40

50

カプタホール、カプタン、カルベンダジム、カルベンダジム塩酸塩、カルボキシ、カル
プロバミド、カルボン、C G A 4 1 3 9 6、C G A 4 1 3 9 7、キノメチオネート、クロ
ロタロニル、クロロゾリネート、クロジラコン、オキシ塩化銅、オキシキノール酸銅 (c
o p p e r o x y q u i n o l a t e)、硫酸銅、トール油酸銅 (c o p p e r t a
l l a t e) およびボルドー液などの銅含有化合物、シフルフェナミド、シモキサニル、
シプロコナゾール、シプロジニル、デバカルブ、ジ-2-ピリジルジスルフィド1, 1'
-ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジ
フェノコナゾール、ジフェンゾコート、ジフルメトリム、O, O-ジ-イソ-プロピル-
S-ベンジルチオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、
ジメチリモール、ジニコナゾール、ジノカップ、ジチアノン、塩化ドデシルジメチルアン
モニウム、ドデモルフ、ドジン、ドグアジン、エジフェンホス、エポキシコナゾール、エ
チリモル、エチルー (Z)-N-ベンジル-N- ([メチル (メチルーチオエチリデンア
ミノオキシカルボニル) アミノ] チオ) -β-アラニネート、エトリジアゾール、ファモ
キサドン、フェナミドン (R P A 4 0 7 2 1 3)、フェナリモル、フェンブコナゾール、
フェンフラム、フェンヘキサミド (K B R 2 7 3 8)、フェンピクロニル、フェンプロピ
ジン、フェンプロピモルフ、酢酸トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ、フェルバ
ム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルメトバー、フルオピラム、フ
ルオキサストロビン、フルオロイミド、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトラ
ニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、フベリダゾール、フララキ
シル、フラメトピル、グアザチン、ヘキサコナゾール、ヒドロキシイソオキサゾール、ヒ
メキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジン三酢
酸塩、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ (S Z X 0 7
2 2)、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム、カスガ
マイシン、クレソキシム-メチル、L Y 1 8 6 0 5 4、L Y 2 1 1 7 9 5、L Y 2 4 8 9
0 8、マンコゼブ、マンジプロバミド、マネブ、メフェノキサム、メタラキシル、メパニ
ピリム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メチラム、メチラム亜鉛、メトミ
ノストロビン、ミクロブタニル、ネオアソジン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、
ニトロタールーイソプロピル、ヌアリモル、オフレース、有機水銀化合物、オキサジキシ
ル、オキサスルフロニル、オキシリン酸、オキシポコナゾール、オキシカルボキシ、ペフ
ラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、フェナ
ジンオキシド、ホセチルー A 1、リン酸、フタリド、ピコキシストロビン (Z A 1 9 6 3
)、ポリオキシ D、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパ
モカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロチオコナゾール、ピラゾ
ホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピラクロストロビン、ピロキロン、ピロキシフ
ル、ピロールニトリン、第四級アンモニウム化合物、キノメチオネート、キノキシフェン
、キントゼン、セダキサン、シブコナゾール (F-155)、五塩化石炭酸ナトリウム、
スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テクロフタラム、テクナ
ゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、2- (チオシアノメチルチ
オ) ベンゾチアゾール、チオファネート-メチル、チラム、チミベンコナゾール、トルク
ロホス-メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアズブチ
ル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン (C G
A 2 7 9 2 0 2)、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、バリダマイシン
A、ババム、ピンクロゾリン、ジネブおよびジラム、N- [9- (ジクロロメチレン) -
1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル] -3- (ジフル
オロメチル) -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド [1072957-
71-1]、1-メチル-3-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (2-ジクロロメチレン-3-エチル-1-メチル-インダン-4-イル) -アミド、およ
び1-メチル-3-ジフルオロメチル-4H-ピラゾール-4-カルボン酸 [2- (2,
4-ジクロロフェニル) -2-メトキシ-1-メチル-エチル] -アミドである。

【0948】

10

20

30

40

50

式（I）の化合物は、種子伝染病、土壌伝染病または葉の真菌疾患から植物を保護するために土壌、泥炭または他の発根媒体と混合されてもよい。

【0949】

この組成物に使用するのに適した共力剤の例としては、ピペロニルブトキシド、セサメックス、サフロキサンおよびドデシルイミダゾールが挙げられる。

【0950】

この組成物に含めるのに適した除草剤および植物成長調節剤は、意図される標的および必要な作用に応じて決まる。

【0951】

含まれ得るコメ選択的除草剤の一例は、プロパニルである。ワタに使用するための植物成長調節剤の一例はPIX（商標）である。

10

【0952】

混合物によっては、著しく異なる物理的、化学的または生物学的特性を有する活性成分を含み得るため、従来の同じ剤型に容易に加えられないものもある。こうした場合、他の剤型を調製してもよい。例えば、1種の活性成分が水不溶性固体であり、他の活性成分が水不溶性液体である場合でも、固体活性成分を（SCの調製と同様の調製を用いて）懸濁液として分散させる一方、液体活性成分を（EWの調製と同様の調製を用いて）乳剤として分散させることによって、各活性成分を同じ連続水相中に分散させることが可能であり得る。得られる組成物は、サスポエマルジョン（SE）製剤である。

【0953】

20

本発明の化合物は、動物衛生の分野でも有用であり、例えば、動物の体内または体表の寄生性の無脊椎有害生物に対して、より好ましくは寄生性の無脊椎有害生物に対して使用され得る。有害生物の例としては、線虫、吸虫、条虫、ハエ、ダニ、マダニ、シラミ、ノミ、半翅類の昆虫およびウジが挙げられる。動物は、非ヒト動物、例えば農業に関連する動物、例えばウシ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、またはロバ、あるいはコンパニオンアニマル、例えばイヌまたはネコであり得る。

【0954】

さらなる態様において、本発明は、治療処置の方法に使用するための本発明の化合物を提供する。

【0955】

30

さらなる態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の本発明の化合物を投与する工程を含む、動物の体内または体表の寄生性の無脊椎有害生物を防除する方法に関する。投与は、例えば経口投与、非経口投与すなわち外用投与、例えば動物の体表への投与であり得る。さらなる態様において、本発明は、動物の体内または体表の寄生性の無脊椎有害生物を防除するための本発明の化合物に関する。さらなる態様において、本発明は、動物の体内または体表の寄生性の無脊椎有害生物を防除するための薬剤の製造への本発明の化合物の使用に関する。

【0956】

さらなる態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の本発明の化合物を動物が生息する環境に投与する工程を含む、寄生性の無脊椎有害生物を防除する方法に関する。

40

【0957】

さらなる態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の本発明の化合物を動物に投与する工程を含む、寄生性の無脊椎有害生物から動物を保護する方法に関する。さらなる態様において、本発明は、寄生性の無脊椎有害生物から動物を保護するのに使用するための本発明の化合物に関する。さらなる態様において、本発明は、寄生性の無脊椎有害生物から動物を保護するための薬剤の製造への本発明の化合物の使用に関する。

【0958】

さらなる態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の本発明の化合物を動物に投与する工程を含む、寄生性の無脊椎有害生物に苦しむ動物を治療する方法を提供する。さらなる態様において、本発明は、寄生性の無脊椎有害生物に苦しむ動物を治療するのに使用す

50

るための本発明の化合物に関する。さらなる態様において、本発明は、寄生性の無脊椎有害生物に苦しむ動物を治療するための薬剤の製造への本発明の化合物の使用に関する。

【0959】

さらなる態様において、本発明は、本発明の化合物と薬学的に好適な賦形剤とを含む医薬組成物を提供する。

【0960】

本発明の化合物は、単独でまたは1種以上の他の生物学的に活性な成分と組み合わせて使用されてもよい。

【0961】

一態様において、本発明は、殺虫的に有効な量の成分Aと殺虫的に有効な量の成分Bとを含む組合せ生成物を提供し、ここで、成分Aは本発明の化合物であり、成分Bは後述される化合物である。

【0962】

本発明の化合物は、駆虫剤と組み合わせて使用されてもよい。このような駆虫剤としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書および欧州特許第594291号明細書に記載されるような、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよびミルベマイシン誘導体などの化合物の大環状ラクトン種から選択される化合物が挙げられる。さらなる駆虫剤としては、米国特許第5015630号明細書、国際公開第9415944号パンフレットおよび国際公開第9522552号パンフレットに記載されるものなどの半合成および生合成アベルメクチン／ミルベマイシン誘導体が挙げられる。さらなる駆虫剤としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、オキシベンダゾール、パーベンダゾール、およびこの種の他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。さらなる駆虫剤としては、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル、オキササンテルまたはモランテルなどのイミダゾチアゾールおよびテトラヒドロピリミジンが挙げられる。さらなる駆虫剤としては、トリクラベンダゾールおよびクロルスロンなどの吸虫駆除剤 (flukicide) ならびにプラジカンテルおよびエブシプランテルなどの条虫駆除剤 (cestocide) が挙げられる。

【0963】

本発明の化合物は、駆虫剤のパラヘルクアミド／マルクホルチン種の誘導体および類似体、ならびに米国特許第5478855号明細書、米国特許第4639771号明細書および独国特許発明第19520936号明細書に開示されるものなどの駆虫剤オキサゾリンと組み合わせて使用されてもよい。

【0964】

本発明の化合物は、国際公開第9615121号パンフレットに記載されるジオキソモルホリン駆虫剤の一般的な種類と、また、国際公開第9611945号パンフレット、国際公開第9319053号パンフレット、国際公開第9325543号パンフレット、欧州特許第626375号明細書、欧州特許第382173号明細書、国際公開第9419334号パンフレット、欧州特許第382173号明細書、および欧州特許第503538号明細書に記載されるものなどの駆虫活性環状デブシペプチドと組み合わせて使用されてもよい。

【0965】

本発明の化合物は、他の外部寄生生物撲滅剤；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機ホスフェート；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジドなどのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリドなどのネオニコチノイドと組み合わせて使用されてもよい。

【0966】

本発明の化合物は、テルペンアルカロイド、例えば国際特許出願公開第95／19363号パンフレットまたは同第04／72086号パンフレットに記載されるもの、特にそ

10

20

30

40

50

れらに開示される化合物と組み合わせて使用されてもよい。

【0967】

本発明の化合物と組み合わせて使用されてもよいこのような生物学的に活性な化合物の他の例としては以下のものが挙げられるが、これらに限定されない：

【0968】

有機ホスフェート：アセフェート、アザメチホス、アジンホス－エチル、アジンホス－メチル、プロモホス、プロモホス－エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン－S－メチル、デメトン－S－メチルスルホン、ジアリホス、ジアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェントロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル－パラチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン－メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン－メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス－メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタンホス (proetaphos)、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルプロホス、テメホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルビンホス、チメトン (thimeton)、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン。

【0969】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2-sec-ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ (fenthio carb)、フラチオカルブ、HCN-801、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メトミル、5-メチル-m-クメニルブチル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクサー、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC-51717。

【0970】

ピレスロイド：アクリナチン (acrinathin)、アレトリン、アルファメトリン、5-ベンジル-3-フリルメチル (E)-(1R)-cis-2,2-ジメチル-3-(2-オキシチオラン-3-イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ビフェントリン、β-シフルトリン、シフルトリン、α-シペルメトリン、β-シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S)-シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ビフェントリン、NCI-85193、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン (cythithrin)、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート (D異性体)、イミプロトリン、シハロトリン、λ-シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン (天然物)、レスメトリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、θ-シペルメトリン、シラフルオフエン、t-フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、ζ-シペルメトリン。

【0971】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成阻害剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロロフェンタジン；b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c) ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトプレン (S-メトプレンを含む)、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン。

【0972】

他の駆虫剤：アセキノシル、アミトラズ、AKD-1022、ANS-118、アザジラクチン、バチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ベンスルトップ、ピフェナゼート、ピナパクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロル、カルトップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノブトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト (*flumite*)、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート (*flubrocyclothrinate*)、フルフェンジン、フルフェンプロックス、フルプロキシフェン (*fluproxyfen*)、ハロフェンプロックス (*halofenprox*)、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン (*nidinatorfuran*)、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロパルギット、プロトリフェンビュート、ピメトロジン、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン (*triethoxyspinosyn*)、トリアクチン、ベルブチン、バータレック、YI-5301。

10

20

【0973】

殺菌・殺カビ剤：アシベンゾラー、アルジモルフ、アムプロピルホス、アンドプリム、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル、ベノミル、ピアラホス、ブラストサイジン-S、ボルドー液、ブロムコナゾール、ブピリメート、カルプロパミド、カプタホール、カプタン、カルベンダジム、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロゾリネート、オキシ塩化銅、銅塩、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、シプロフラム、RH-7281、ジクロシメット、ジクロブトラゾール、ジクロメジン、ジクロラン、ジフェノコナゾール、RP-407213、ジメトモルフ、ドモキシストロビン (*domoxystrobin*)、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ドジン、エジフェンホス、エポキシコナゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンカルアミド、フェンピクロニル、フェンプロビジン、フェンプロビモルフ、酢酸トリフェニルスズ、フルアジナム、フルジオキサニル、フルメトバー、フルモルフ／フルモルリン (*flumorf/flumorlin*)、水酸化トリフェニルスズ、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルトリアホール、ホルベット、ホセチルアルミニウム、フララキシル、フラメタピル、ヘキサコナゾール、イブコナゾール、イブロベンホス、イブプロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン、クレソキシム-メチル、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メトミノストロビン／フェノミノストロビン、メトラフェノン、ミクロブタニル、ネオアソジン、ニコビフェン、オリザストロビン、オキサジキシル、ペンコナゾール、ペンシクロン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロパモカルブ、プロピオコナゾール、プロキンアジド、プロチオコナゾール、ピリフェノックス、ピラクロストロビン、ピリメタニル、ピロキロン、キノキシフェン、スピロキサミン、硫黄、テブコナゾール、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネート-メチル、チラム、チアジニル、トリアジメホン、トリアジメノール、トリシクラゾール、トリフロキシストロビン、トリチコナゾール、バリダマイシン、ビンクロジン (*vinclozin*)。

30

40

【0974】

生物剤：バチルス・チューリンゲンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis ssp aizawai*)、クルスターキ (*kurstaki*)、

50

バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性細菌、ウイルスおよび菌・カビ。

【0975】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

【0976】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタマート (*penethamate*)、メロキシカム、セファレキシム、カナマイシン、ピモベンダン、クレブテロール、オメプラゾール、チアムリン、ベナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォキシム、ツラスロマイシン、セフチオフル、カルプロフェン、メタフルミゾン、プラジカンテル、トリクラベンダゾール。

10

【0977】

他の活性成分と組み合わせて使用される場合、本発明の化合物は、好ましくは、以下：イミダクロプリド、エンロフロキサシン、プラジカンテル、エンボン酸ピランテル、フェバンテル、ペネタマート、メロキシカム、セファレキシム、カナマイシン、ピモベンダン、クレブテロール、フィプロニル、イベルメクチン、オメプラゾール、チアムリン、ベナゼプリル、ミルベマイシン、シロマジン、チアメトキサム、ピリプロール、デルタメトリン、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォキシム、ツラスロマイシン、セフチオフル、セラメクチン、カルプロフェン、メタフルミゾン、モキシデクチン、メトプレン (S-メトプレンを含む)、クロルスロン、ピランテル、アミトラズ、トリクラベンダゾール、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、ドラ
メクチン、セラメクチン、ネマデクチン、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、オキシベン
ダゾール、パーベンダゾール、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル、オキ
サンテル、モランテル、トリクラベンダゾール、エプシプランテル、フィプロニル、ルフ
ェヌロン、エクジソンまたはテブフェノジド；より好ましくは、エンロフロキサシン、プ
ラジカンテル、エンボン酸ピランテル、フェバンテル、ペネタマート、メロキシカム、セ
ファレキシム、カナマイシン、ピモベンダン、クレブテロール、オメプラゾール、チア
ムリン、ベナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、
セフォキシム、ツラスロマイシン、セフチオフル、セラメクチン、カルプロフェン、モキ
シデクチン、クロルスロン、ピランテル、エプリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチ
ン、ネマデクチン、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベ
ンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、オキシベンダゾール、パーベン
ダゾール、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル、オキサンテル、モラン
テル、トリクラベンダゾール、エプシプランテル、ルフェヌロンまたはエクジソン；さら
により好ましくは、エンロフロキサシン、プラジカンテル、エンボン酸ピランテル、フェ
バンテル、ペネタマート、メロキシカム、セファレキシム、カナマイシン、ピモベン
ダン、クレブテロール、オメプラゾール、チアムリン、ベナゼプリル、ピリプロール、セ
フキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォキシム、ツラスロマイシン、セフ
チオフル、セラメクチン、カルプロフェン、モキシデクチン、クロルスロンまたはピ
ランテルと組み合わせて使用される。

20

30

40

【0978】

比率の例としては、100：1～1：6000、50：1～1：50、20：1～1：20、さらにより特定の、10：1～1：10、5：1～1：5、2：1～1：2、4：1～2：1、1：1、または5：1、または5：2、または5：3、または5：4、または4：1、または4：2、または4：3、または3：1、または3：2、または2：1、または1：5、または2：5、または3：5、または4：5、または1：4、または2：4、または3：4、または1：3、または2：3、または1：2、または1：600、または1：300、または1：150、または1：35、または2：35、または4：35、または1：75、または2：75、または4：75、または1：6000、または1：3000、または1：1500、または1：350、または2：350、または4：3

50

50、または1：750、または2：750、または4：750が挙げられる。それらの混合比は、一方では、重量比を含み、他方ではモル比も含むことが理解される。

【0979】

特に注目すべきは、追加の活性成分が、式Iの化合物からの異なる作用部位を有する組合せである。場合によっては、類似の防除スペクトルを有するが作用部位の異なる少なくとも1種の他の寄生性の無脊椎有害生物防除活性成分との組合せは、抵抗性管理に特に有利であろう。したがって、本発明の組合せ生成物は、殺虫的に有効な量の式Iの化合物と、殺虫的に有効な量の、類似の防除スペクトルを有するが作用部位の異なる少なくとも1種の追加の寄生性の無脊椎有害生物防除活性成分とを含み得る。

【0980】

当業者は、化合物の塩がその対応する非塩形態と平衡状態にある環境および生理的条件下で、塩が、非塩形態の生物学的有用性を共有することを認識する。

【0981】

したがって、本発明の化合物の多種多様な塩（および本発明の活性成分と組み合わせて使用される活性成分）は、無脊椎有害生物および動物寄生生物の防除に有用であり得る。塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸などの無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。

【0982】

本発明の化合物にはN-オキシドも含まれる。したがって、本発明は、本発明の化合物（そのN-オキシドおよび塩を含む）と、追加の活性成分（そのN-オキシドおよび塩を含む）との組合せを含む。

【0983】

動物衛生に使用するための組成物は、製剤助剤として当業者に公知の製剤助剤および添加剤（そのうちのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能するものとみなされ得る）も含有し得る。このような製剤助剤および添加剤は、以下を制御し得る：pH（緩衝液）、処理の際の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、活性成分の沈降（懸濁化剤）、粘度（チキソトロピー増粘剤）、容器内の（in-container）微生物増殖（抗菌剤）、生成物の凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散液）、ウォッシュオフ性（wash-off）（塗膜形成剤または固着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）、および他の製剤助剤。塗膜形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。製剤助剤および添加剤の例としては、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.によって発行されたMcCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions; およびPCT公報の国際公開第03/024222号パンフレットに列挙されるものが挙げられる。

【0984】

本発明の化合物は、他の補助剤なしで施用され得るが、ほとんどの場合、施用は、好適な担体、希釈剤、および界面活性剤とともに、ならびに場合により想定される最終用途に応じて食物と組み合わせて、1種以上の活性成分を含む製剤の施用になる。1つの施用方法は、組合せ生成物の水分散液または精製油溶液を噴霧する工程を含む。スプレー油、スプレー油濃縮物、展着剤固着剤、補助剤、他の溶媒、およびピペロニルブトキシドなどの共力剤を含む組成物は、化合物の有効性を強化することが多い。このようなスプレーは、缶、瓶または他の容器などのスプレー容器から、ポンプによってまたは加圧された容器、例えば、加圧されたエアゾールスプレー缶からそれを放出することによって施用され得る。このようなスプレー組成物は、例えば、スプレー、ミスト、発泡体、煙または霧といった様々な形態を取り得る。したがって、このようなスプレー組成物は、場合により噴射剤

10

20

30

40

50

、発泡剤などをさらに含み得る。注目すべきは、殺虫的に有効な量の本発明の化合物と担体とを含むスプレー組成物である。このようなスプレー組成物の一実施形態は、殺虫的に有効な量の本発明の化合物と噴射剤とを含む。代表的な噴射剤としては、限定はされないが、メタン、エタン、プロパン、ブタン、イソブタン、ブテン、ペンタン、イソペンタン、ネオペンタン、ペンテン、ヒドロフルオロカーボン、クロロフルオロカーボン、ジメチルエーテル、および上記のものの混合物が挙げられる。注目すべきは、蚊、ブヨ（black fly）、サシバエ、メクラアブ、ウマバエ、カリバチ、キオビクロスズメバチ（yellow jacket）、スズメバチ（hornet）、マダニ、クモ、アリ、ブヨ（gnat）などからなる群から選択される少なくとも1種の寄生性の無脊椎有害生物を、個々にまたは組み合わせて、防除するのに使用されるスプレー組成物（およびスプレー容器から分配されるこのようなスプレー組成物を用いる方法）である。

10

【0985】

動物寄生生物の防除は、宿主動物の体表（例えば、肩、腋窩、腹部、大腿部の内側部分）に寄生する外部寄生生物および宿主動物の体内（例えば、胃、腸、肺、静脈、皮下、リンパ組織）に寄生する内部寄生生物を防除することを含む。外部寄生有害生物または疾患を伝播する有害生物としては、例えば、ツツガムシ、マダニ、シラミ、蚊、ハエ、ダニおよびノミが挙げられる。内部寄生生物としては犬糸状虫、鉤虫および寄生蠕虫が挙げられる。本発明の化合物は、外部寄生有害生物に対処するのに特に適し得る。本発明の化合物は、動物への寄生生物による蔓延または感染の全身のおよび／または非全身的な防除に適し得る。

20

【0986】

本発明の化合物は、野生動物、家畜動物および農業用使役動物の寄生性の無脊椎有害生物を含む、動物の対象に寄生する寄生性の無脊椎有害生物に対処するのに適し得る。家畜は、食物または繊維などを製造させるため、または労働のために農業施設において意図的に飼育される家畜を（単数または複数で）指すのに使用される用語であり；家畜の例としては、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、雌鶏、シチメンチョウ、カモおよびガチョウ（例えば、肉、乳汁、バター、卵、毛皮、皮革、羽毛および／または毛のために飼育される）、養殖魚、ミツバチが挙げられる。寄生生物に対処することによって、死亡率および生産性減少（肉、乳汁、毛、表皮、卵などに関して）が低下され、したがって、本発明の化合物の施用により、動物のより経済的で簡単な飼育が可能になる。

30

【0987】

これらの有害生物を防除することによって、死亡率を低下させ、宿主動物の生産性（performance）（肉、乳汁、毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）ならびに健康を向上させることが意図される。また、寄生生物の防除は、病原体の伝播を防ぐのに役立ち、獣医学分野に関する「防除する」という用語は、活性化合物が、寄生生物に感染した動物における該当する寄生生物の発生を、無害なレベルまで減少させるのに有効であり、例えば活性化合物が、該当する寄生生物を殺滅し、その成長を阻害し、またはその増殖を阻害するのに有効であることを意味する。

【0988】

本発明の化合物は、コンパニオンアニマルおよびペット（例えば、イヌ、ネコ、愛玩鳥および観賞魚）、研究動物および実験動物（例えば、ハムスター、モルモット、ラットおよびマウス）、ならびに動物園、野生動物の生息環境および／またはサーカスのためか、動物園、野生動物の生息環境および／またはサーカスにおいて飼育される動物に寄生する寄生性の無脊椎有害生物に対処するのに適し得る。

40

【0989】

本発明の一実施形態において、動物は、好ましくは脊椎動物、より好ましくは哺乳動物、鳥類または魚類である。特定の実施形態において、動物の対象は哺乳動物（ヒトなどの類人猿を含む）である。他の哺乳動物の対象としては、霊長類（例えば、サル）、ウシ亜科の動物（例えば、ウシまたは乳牛）、ブタ類（例えば、成ブタ（hog）またはブタ（

50

p i g))、ヒツジ類(例えば、ヤギまたはヒツジ)、ウマ科の動物(例えば、ウマ)、イヌ科の動物(例えば、イヌ)、ネコ科の動物(例えば、飼いネコ)、ラクダ、シカ、ロバ、水牛、レイヨウ、ウサギ、およびげっ歯類(例えば、モルモット、リス、ラット、マウス、アレチネズミ、およびハムスター)が挙げられる。鳥類としては、カモ科(*Anatidae*) (ハクチョウ、カモおよびガチョウ)、ハト科(*Columbidae*) (例えば、コバトおよびハト)、キジ科(*Phasianidae*) (例えば、ヤマウズラ、ライチョウおよびシチメンチョウ)、テシエニダエ(*Thesienidae*) (例えば、家禽)、オウム科(*Psittacines*) (例えば、インコ、コンゴウインコ、およびオウム)、狩猟鳥、および走鳥類(例えば、ダチョウ)が挙げられる。

【0990】

10

本発明の化合物によって治療または保護される鳥類は、商業的または非商業的な鳥類の飼育に関連し得る。これらとしては、特に、ペットまたはコレクター市場用に飼育される、ハクチョウ、ガチョウ、およびカモなどのカモ科(*Anatidae*)、コバトおよびドバトなどのハト科(*Columbidae*)、ヤマウズラ、ライチョウおよびシチメンチョウなどのキジ科(*Phasianidae*)、家禽などのテシエニダエ(*Thesienidae*)、ならびにインコ、コンゴウインコおよびオウムなどのオウム科(*Psittacines*)が挙げられる。

【0991】

本発明の趣旨では、「魚類」という用語は、限定はされないが、硬骨魚類(*Teleostei*)の魚、すなわち、硬骨魚を含むことが理解される。サケ目(*Salmoniformes*) (サケ科(*Salmonidae*)を含む)およびスズキ目(*Perciformes*) (サンフィッシュ科(*Centrarchidae*)を含む)はいずれも硬骨魚類(*Teleostei*)に含まれる。可能性のある魚類レシピエントの例としては、特に、サケ科(*Salmonidae*)、ハタ科(*Serranidae*)、タイ科(*Sparidae*)、カワスズメ科(*Cichlidae*)、およびサンフィッシュ科(*Centrarchidae*)が挙げられる。

20

【0992】

本発明の方法が、寄生生物感染または蔓延を治療または予防するのに安全かつ有効である有袋類(カンガルーなど)、爬虫類(養殖亀(*farmed turtle*)など)、および他の経済的に重要な家畜を含む他の動物も、本発明の方法から利益を受けることが

30

想定されている。

【0993】

殺虫的に有効な量の本発明の化合物を、保護されるべき動物に投与することによって防除される寄生性の無脊椎有害生物の例としては、外部寄生生物(節足動物、ダニなど)および内部寄生生物(寄生蠕虫、例えば、線虫、吸虫、条虫、鉤頭虫など、およびコクシジウム類などの原虫)が挙げられる。

【0994】

蠕虫病として一般に記載される疾患または疾患群は、寄生蠕虫として公知の寄生虫による動物宿主の感染に起因する。「寄生蠕虫」という用語は、線虫、吸虫、条虫および鉤頭虫を含むことを意味する。蠕虫病は、ブタ、ヒツジ、ウマ、ウシ、ヤギ、イヌ、ネコおよび家禽などの家畜に関連する、広まった深刻な経済的問題である。

40

【0995】

寄生蠕虫の中でも、線虫として記載される虫の群は、様々な種類の動物に広範囲にわたる時には深刻な感染を引き起こす。

【0996】

本発明の化合物によって処置されることが考えられる線虫としては、限定はされないが、以下の属:アカントケイロネマ属(*Acanthocheilonema*)、アエルロストロンギルス属(*Aelurostrongylus*)、アンシロストーマ属(*Ancylostoma*)、アンギオストロンギルス属(*Angiostrongylus*)、アスカリディア属(*Ascaridia*)、アスカリス属(*Ascaris*)、ブルギア

50

属 (*Brugia*)、ブノストマム属 (*Bunostomum*)、キャピラリア属 (*Capillaria*)、チャベルチア属 (*Chabertia*)、クーペリア属 (*Cooperia*)、クレノソマ属 (*Crenosoma*)、ディクチオカウルス属 (*Dictyocaulus*)、ジオクトフィーマ属 (*Diectophyme*)、ディペタロネマ属 (*Dipetalonema*)、ジフィロボスリウム属 (*Diphyllbothrium*)、ディロフィラリア属 (*Dirofilaria*)、ドラクンクルス属 (*Dracunculus*)、エンテロビウス属 (*Enterobius*)、フィラロイデス属 (*Filaroides*)、ヘモンクス属 (*Haemonchus*)、ヘテラキス属 (*Heterakis*)、ラゴキラスカリス属 (*Lagochilascaris*)、ロア属 (*Loa*)、マンソネラ属 (*Mansonella*)、ムエレリウス属 (*Muellerius*)、ネカトール属 (*Necator*)、ネマトジルス属 (*Nematodirus*)、エソファゴストマム属 (*Oesophagostomum*)、オステルタギア属 (*Ostertagia*)、オキシウリス属 (*Oxyuris*)、パラフィラリア属 (*Parafilaria*)、パラスカリス属 (*Parascaris*)、フィサロプテラ属 (*Physaloptera*)、プロトストロンギルス属 (*Protostrongylus*)、セタリア属 (*Setaria*)、スピロセルカ属 (*Spirocerca*)、ステファノフィラリア属 (*Stephanofilaria*)、ストロンギロイデス属 (*Strongyloides*)、ストロンギルス属 (*Strongylus*)、テラジア属 (*Thelazia*)、トキサスカリス属 (*Toxascaris*)、トキシカラ属 (*Toxocara*)、トリキネラ属 (*Trichinella*)、トリコネマ属 (*Trichonema*)、トリコストロンギルス属 (*Trichostrongylus*)、トリチュリス属 (*Trichuris*)、ウンシナリア属 (*Uncinaria*) およびウケレリア属 (*Wuchereria*) が挙げられる。

【0997】

上記のうち、上述した動物に感染する線虫の最も一般的な属は、ヘモンクス属 (*Haemonchus*)、トリコストロンギルス属 (*Trichostrongylus*)、オステルタギア属 (*Ostertagia*)、ネマトジルス属 (*Nematodirus*)、クーペリア属 (*Cooperia*)、アスカリス属 (*Ascaris*)、ブノストマム属 (*Bunostomum*)、エソファゴストマム属 (*Oesophagostomum*)、チャベルチア属 (*Chabertia*)、トリチュリス属 (*Trichuris*)、ストロンギルス属 (*Strongylus*)、トリコネマ属 (*Trichonema*)、ディクチオカウルス属 (*Dictyocaulus*)、キャピラリア属 (*Capillaria*)、ヘテラキス属 (*Heterakis*)、トキシカラ属 (*Toxocara*)、アスカリディア属 (*Ascaridia*)、オキシウリス属 (*Oxyuris*)、アンシロストーマ属 (*Ancylostoma*)、ウンシナリア属 (*Uncinaria*)、トキサスカリス属 (*Toxascaris*) およびパラスカリス属 (*Parascaris*) である。ネマトジルス属 (*Nematodirus*)、クーペリア属 (*Cooperia*) およびエソファゴストマム属 (*Oesophagostomum*) など、これらのうちのいくつかは、主に腸管を攻撃するが、ヘモンクス属 (*Haemonchus*) およびオステルタギア属 (*Ostertagia*) などの他のものは、胃においてより優勢であり、ディクチオカウルス属 (*Dictyocaulus*) などの他のものは、肺において見られる。さらに他の寄生生物は、心臓および血管、皮下およびリンパ組織などの他の組織に住みつき得る。

【0998】

本発明によっておよび本発明の方法によって処置されることが考えられる吸虫としては、限定はされないが、以下の属：アラリア属 (*Alaria*)、ファシオラ属 (*Fasciola*)、ナノフィエツス属 (*Nanophyetus*)、オピストルキス属 (*Opisthorchis*)、パラゴニムス属 (*Paragonimus*) およびシストソーマ属 (*Schistosoma*) が挙げられる。

【0999】

10

20

30

40

50

本発明によっておよび本発明の方法によって処置されることが考えられる条虫としては、限定はされないが、以下の属：ジフィロボスリウム属 (*Diphyllobothrium*)、ジプリジウム属 (*Diplydium*)、スピロメトラ属 (*Spirometra*) およびテニア属 (*Taenia*) が挙げられる。

【1000】

ヒトの胃腸管の寄生生物の最も一般的な属は、アンシロストーマ属 (*Ancylostoma*)、ネカトル属 (*Necator*)、アスカリス属 (*Ascaris*)、ストロングヒデス属 (*Strongyloides*)、トリキネラ属 (*Trichinella*)、キャピラリア属 (*Capillaria*)、トリチュリス属 (*Trichuris*) およびエンテロビウス属 (*Enterobius*) である。血液または胃腸管の外側の他の組織および器官に見られる寄生生物の他の医学的に重要な属は、ウケレリア属 (*Wuchereria*)、ブルギア属 (*Brugia*)、オンコセルカ属 (*Onchocerca*) およびロア属 (*Loa*)、ならびにドラクンクルス属 (*Dracunculus*) などの糸状虫ならびに腸内寄生虫のストロンギロイデス属 (*Strongyloides*) およびトリキネラ属 (*Trichinella*) の腸外段階である。

10

【1001】

多くの他の寄生蠕虫属および種は、当該技術分野において公知であり、また、本発明の化合物によって処置されることが考えられる。これらは、Textbook of Veterinary Clinical Parasitology, Volume 1, Helminths, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa.; Helminths, Arthropods and Protozoa, (6th Edition of Monnig's Veterinary Helminthology and Entomology), E. J. L. Soulsby, Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md. においてかなり詳細に列挙されている。

20

【1002】

本発明の化合物は、多くの動物外部寄生生物（例えば、哺乳動物および鳥類の節足動物外部寄生生物、特に、ハエ（刺咬性および舐性）、寄生性のハエ幼虫、シラミ、アタマジラミ、ハジラミ、ノミなどの昆虫；あるいは、マダニ、例えばカタダニもしくはヒメダニなどのコナダニ、またはヒゼンダニ、ツツガムシ、トリサシダニ (bird mite) などのダニ）に対して有効であり得る。

30

【1003】

昆虫およびダニの有害生物としては、例えば、ハエおよび蚊、ダニ、マダニ、シラミ、ノミ、半翅類の昆虫、寄生性のウジなどの刺咬昆虫が挙げられる。

【1004】

成虫のハエとしては、例えば、ノサシバエまたはハエマトビア・イリタンス (*Haematobia irritans*)、ウマバエまたはアブ属 (*Tabanus* spp.)、サシバエまたはストモキス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、ブヨまたはブヨ属 (*Simulium* spp.)、メクラアブまたはメクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、シラミバエまたはメロファガス・オビヌス (*Melophagus ovinus*)、およびツェツェバエまたはツェツェバエ属 (*Glossina* spp.) が挙げられる。寄生性のハエウジとしては、例えば、ウマバエ (オエストルス・オビス (*Oestrus ovis*)) およびウサギヒフバエ種 (*Cuterebra* spp.)、クロバエまたはヒロズキンバエ種 (*Phaenicia* spp.)、ラセンウジバエまたはコクリオミア・ホミニボラクス (*Cochliomyia hominivorax*)、ウシバエまたはウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマのフリースワーム (fleece worm) およびウマバエ属 (*Gastrophilus*) が挙げられる。蚊としては、例えば、イエカ属 (*Culex* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.) およびヤブカ属 (*Aedes* spp.) が挙げられる。

40

50

【1005】

ダニとしては、中気門亜目種 (*Mesostigmata* spp.)、例えば、ニワトリダニ、デルマニッス・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*) などの中気門類；ヒゼンダニ科種 (*Sarcoptidae* spp.)、例えば、サルコプテス・スカビエイ (*Sarcoptes scabiei*) などのヒゼンダニまたは疥癬虫；コリオプテス・ボビス (*Chorioptes bovis*) およびプソロプテス・オビス (*Psoroptes ovis*) を含むキュウセンヒゼンダニ科種 (*Psoroptidae* spp.) などの疥癬ダニ；ツツガムシ、例えば、ツツガムシ科種 (*Trombiculidae* spp.)、例えば北米ツツガムシ、トロンビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*) が挙げられる。

10

【1006】

マダニとしては、例えば、ヒメダニ科種 (*Argasidae* spp.) を含む軟体マダニ、例えばナガヒメダニ属 (*Argas* spp.) およびカズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)；マダニ科種 (*Ixodidae* spp.)、例えばクリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*)、アンダーソンカクマダニ (*Dermacentor andersoni*)、アメリカキララマダニ (*Amblyomma americanum*)、クロアシマダニ (*Ixodes scapularis*) および他のコイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.) (以前のウシマダニ属 (*Boophilus*) を含む) を含む硬体マダニが挙げられる。

20

【1007】

シラミとしては、例えば、吸血シラミ、例えば、タンカクハジラミ属 (*Menopon* spp.) およびボビコラ属 (*Bovicola* spp.)；刺咬性のシラミ、例えば、ブタジラミ属 (*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ属 (*Linognathus* spp.) およびソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.) が挙げられる。

【1008】

ノミとしては、例えば、イヌノミ (イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)) およびネコノミ (ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)) などのイヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.)；ケオプスネズミノミ (キシノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)) などのネズミノミ属 (*Xenopsylla* spp.)；およびヒトノミ (プレクス・イリタンス (*Pulex irritans*)) などのヒトノミ属 (*Pulex* spp.) が挙げられる。

30

【1009】

半翅類の昆虫としては、例えば、トコジラミ科 (*Cimicidae*) または例えば、一般的なトコジラミ (シメクス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*))；サシガメとしても知られているオオサシガメを含むオオサシガメ亜科種 (*Triatominae* spp.)；例えばロドニウス・プロリクス (*Rhodnius prolixus*) およびサシガメ属 (*Triatoma* spp.) が挙げられる。

40

【1010】

一般に、ハエ、ノミ、シラミ、蚊、プヨ、ダニ、マダニおよび寄生蠕虫は、家畜およびコンパニオンアニマル分野に多大な損失をもたらす。節足動物寄生生物はまた、ヒトにとって厄介であり、ヒトおよび動物における疾患を引き起こす生物を媒介し得る。

【1011】

多くの他の寄生性の無脊椎有害生物が当該技術分野において公知であり、また、本発明の化合物によって処置されることが考えられる。これらは、*Medical and Veterinary Entomology*, D. S. Kettle, John Wiley AND Sons, New York and Toronto; *Control of Arthropod Pests of Livestock: A Review*

50

w of Technology, R. O. Drummand, J. E. George, and S. E. Kunz, CRC Press, Boca Raton, Fla. においてかなり詳細に列挙されている。

【1012】

本発明の化合物は、外部寄生生物、例えば、ハエ（刺咬性および舐性）、寄生性のハエ幼虫、シラミ、アタマジラミ、ハジラミ、ノミなどの昆虫；あるいは、マダニ、例えばカタダニもしくはヒメダニなどのコナダニ、またはヒゼンダニ、ツツガムシ、トリサシダニなどのダニに対しても有効であり得る。これらとしては、例えば、ハエマトビア（リペロシア）イリタンス（*Haematobia (Lyperosia) irritans*）（ノサシバエ）、ブヨ属（*Simulium spp.*）（ブヨ）、ツェツェバエ属（*Glossina spp.*）（ツェツェバエ）、ヒドロテア・イリタンス（*Hydrotaea irritans*）（ヘッドフライ（head fly））、ムスカ・オータムナリス（*Musca autumnalis*）（フェースフライ（face fly））、イエバエ（*Musca domestica*）（イエバエ）、モレリア・シンプレックス（*Morellia simplex*）（スウェットフライ（sweat fly））、アブ属（*Tabanus spp.*）（ウマバエ）、ヒポデルマ・ボビス（*Hypoderma bovis*）、ヒポデルマ・リネアツム（*Hypoderma lineatum*）、ルシリア・セリカータ（*Lucilia sericata*）、ルシリア・クプリナ（*Lucilia cuprina*）（ヒツジキンバエ）、オオクロバエ属（*Calliphora spp.*）（クロバエ）、プロトフォルミア属（*Protophormia spp.*）、オエストルス・オビス（*Oestrus ovis*）（ヒツジバエ）、サシバエ属（*Culicoides spp.*）（ミジ）、ヒッポボスカ・エクイナ（*Hippobosca equina*）、ガストロフィルス・インテスチナリス（*Gastrophilus intestinalis*）、ガストロフィルス・ハエモホイダリス（*Gastrophilus haemorrhoidalis*）およびガストロフィルス・ナサリス（*Gastrophilus nasalis*）などのハエ；ボビコラ（ダマリニア）ボビス（*Bovicola (Damalinia) bovis*）、ボビコラ・エクイ（*Bovicola equi*）、ハエマトピヌス・アシニ（*Haematopinus asini*）、フェリコラ・スブロストラツス（*Felicola subrostratus*）、ヘテロドクサス・スピニガー（*Heterodoxus spiniger*）、リノグナサス・セトサス（*Linognathus setosus*）およびトリコデクテス・カニス（*Trichodectes canis*）などのシラミ；メロファガス・オビヌス（*Melophagus ovinus*）などのヒツジシラミバエ；ならびにプソロプテス属（*Psoroptes spp.*）、サルコプテス・スカビエイ（*Sarcoptes scabiei*）、コリオプテス・ボビス（*Chorioptes bovis*）、デモデックス・エクイ（*Demodex equi*）、ツメダニ属（*Cheyletiella spp.*）、ノトエドレス・カティ（*Notoedres cati*）、ツツガムシ属（*Trombicula spp.*）およびオトデクテス・シノチス（*Otodectes cyanotis*）（ミミダニ）などのダニが挙げられる。

【1013】

動物の健康への有害生物種の例としては、シラミ目（*Anoplurida*）からの有害生物種、例えば、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.*）、ケジラミ属（*Phthirus spp.*）、ソレノポテス属（*Solenopotes spp.*）；特定の例は：リノグナサス・セトサス（*Linognathus setosus*）、ウシホソジラミ（*Linognathus vituli*）、ヒツジジラミ（*Linognathus ovis*）、リノグナサス・オビフォルミス（*Linognathus ovisformis*）、リノグナサス・ペダリス（*Linognathus pedalis*）、ヤギホソジラミ（*Linognathus ste*

nopsis)、ハエマトピヌス・アシニ・マクロセファルス (*Haematopinus asini macrocephalus*)、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、アタマジラミ (*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ (*Pediculus humanus corporis*)、フィロエラ・バスタトリックス (*Phylloera vastatrix*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、ケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) であり；ハジラミ目 (*Mallophagida*) ならびにその亜目であるマルツノハジラミ亜目 (*Amblycerina*) およびホソツノハジラミ亜目 (*Ischnocerina*) からの有害生物種、例えば、トリメノポン属 (*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.)、フェリコラ属 (*Felicola* spp.)；特定の例は：ボビコラ・ボビス (*Bovicola bovis*)、ヒツジハジラミ (*Bovicola ovis*)、ボビコラ・リンバータ (*Bovicola limbata*)、ダマリナ・ボビス (*Damalina bovis*)、トリコデクテス・カニス (*Trichodectes canis*)、フェリコラ・スブロストラツス (*Felicola subrostratus*)、ヤギハジラミ (*Bovicola caprae*)、レピケントロン・オビス (*Lepikentron ovis*)、ウェルネッキエラ・エクイ (*Werneckiella equi*) であり；双翅目 (*Diptera*) ならびにそのネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) および短角亜目 (*Brachycerina*) からの有害生物種、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.)、ツノマユブユ属 (*Eusimulium* spp.)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus* spp.)、ルツォミヤ属 (*Lutzomyia* spp.)、サシバエ属 (*Culicoides* spp.)、メクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、オダグミア属 (*Odagmia* spp.)、ウィルヘルミア属 (*Wilhelmia* 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.)、フィリポミア属 (*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* spp.)、モレリア属 (*Morellia* spp.)、ヒメイェバエ属 (*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.)、クリソミア属 (*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.)、ヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属 (*Rhinoestrus* spp.)、ガガンボ属 (*Tipula* spp.)；特定の例は：ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、イーデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、ガンビエハマダラカ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・マクリペンニス (*Anopheles maculipennis*)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvi*

10

20

30

40

50

alis)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、アカ
 イエカ (*Culex pipiens*)、キュレックス・タルサリス (*Culex ta
 rsalis*)、ヒメイエバエ (*Fannia canicularis*)、ニクバエ (*Sarcophaga carnaria*)、ストモキス・カルシトランス (*Stomo
 xys calcitrans*)、ガガンボ (*Tipula paludosa*)、ルシ
 リア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルシリア・セリカータ (*Luci
 lia sericata*)、シムリウム・レプタンス (*Simulium reptan
 s*)、フレオボトムス・パパタシ (*Phlebotomus papatasi*)、ヒ
 ゲナガサシチョウバエ (*Phlebotomus longipalpis*)、ツメトゲ
 ブユ (*Odagmia ornata*)、ウマブユ (*Wilhelmia equina*) 10
 、ボーフソラ・エリスロセファラ (*Boophthora erythrocephala*)、
 タバヌス・ブロミウス (*Tabanus bromius*)、タバヌス・スポド
 プテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラツス (*Tab
 anus atratus*)、タバヌス・スデチクス (*Tabanus sudetic
 us*)、ヒボミトラ・シウレア (*Hybomitra ciurea*)、クリソプス・カ
 エキュチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクツス
 (*Chrysops relictus*)、ゴマフアブ (*Haematopota plu
 vialis*)、ヘマトポタ・イタリカ (*Haematopota italica*)
 、ムスカ・オータムナリス (*Musca autumnalis*)、イエバエ (*Musc
 a domestica*)、ノサシバエ (*Haematobia irritans i* 20
rritans)、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア (*Haematobia i*
rritans exigua)、ヘマトビア・スティミュランス (*Haematobia*
stimulans)、ヒドロテア・イリタンス (*Hydrotaea i*
rritans)、ヒドロテア・アルビプンクタ (*Hydrotaea albipuncta*)、
 クリソミア・クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、クリソミア・
 ベジアナ (*Chrysomya bezziana*)、オエストルス・オビス (*Oest
 rus ovis*)、ヒポデルマ・ボビス (*Hypoderma bovis*)、ヒポデ
 ルマ・リネアツム (*Hypoderma lineatum*)、プルゼワルスキアナ・シ
 レヌス (*Przhevalskiana silenus*)、ヒトヒフバエ (*Derma
 tobia hominis*)、メロファガス・オビヌス (*Melophagus ov* 30
inus)、リポプテナ・カブレオリ (*Lipoptena capreoli*)、リポ
 プテナ・セルビ (*Lipoptena cervi*)、ヒッポボスカ・バリエガタ (*Hi
 ppobosca variegata*)、ヒッポボスカ・エクイナ (*Hippobos
 ca equina*)、ウマバエ (*Gasterophilus intestinal
 is*)、アトアカウマバエ (*Gasterophilus haemorroidali
 s*)、ガステロフィルス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)
 、ムネアカウマバエ (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィル
 ス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、アカウ
 マバエ (*Gasterophilus pecorum*)、ミツバチシラミバエ (*Bra
 ula coeca*) であり；ノミ目 (*Siphonapterida*) からの有害生物 40
 種、例えば、ヒトノミ属 (*Pulex spp.*)、イヌノミ属 (*Ctenoceph
 alides spp.*)、スナノミ属 (*Tunga spp.*)、ネズミノミ属 (*Xen
 opsylla spp.*)、ナガノミ属 (*Ceratophyllus spp.*)；
 特定の例は：イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*C
 tenocephalides felis*)、プレクス・イリタンス (*Pulex i
 rritans*)、スナノミ (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオ
 ピス (*Xenopsylla cheopis*) であり；異翅目 (*Heteropter
 ida*) からの有害生物種、例えば、トコジラミ属 (*Cimex spp.*)、サシガメ
 属 (*Triatoma spp.*)、ロードニウス属 (*Rhodnius spp.*)、
 パンストロギルス属 (*Panstrongylus spp.*)；ゴキブリ目 (*Blatt* 50

arida)からの有害生物種、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*)、チャオビゴキブリ属 (*Supella* spp.) (例えばスペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*)) ; ダニ亜綱 (*Acarari* (*Acarina*)) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) および中気門亜目 (*Mesostigmata*) からの有害生物種、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.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、コイタマダニ属 (ウシマダニ属) (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemaphysalis* spp.)、ダニ属 (*Hyalomma* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主性マダニの元の属)、イエダニ属 (*Ornithonyssus* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* 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.)、バロア属 (*Varroa* spp.)、アカラピス属 (*Acarapis* spp.) ; 特定の例は：ナガヒメダニ (*Argas persicus*)、鳩扁ダニ (*Argas reflexus*)、カズキダニ (*Ornithodoros moubata*)、オトビウス・メグニニ (*Otobius megnini*)、オウシマダニ (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・デコロラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・アンヌラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・カルセラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*)、ヒアロマ・アナトリクム (*Hyalomma anatolicum*)、ヒアロマ・エジプトクム (*Hyalomma aegypticum*)、ヒアロマ・マルギナツム (*Hyalomma marginatum*)、ヒアロマ・トランジェンス (*Hyalomma transiens*)、リピセファルス・エバーツィ (*Rhipicephalus evertsi*)、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴヌス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビクンズ (*Ixodes rubicundus*)、クロアシマダニ (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヘマフィサリス・プンクタータ (*Haemaphysalis punctata*)、ヘマフィサリス・シンアバリナ (*Haemaphysalis cinabarina*)、ヘマフィサリス・オトフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ヘマフィサリス・リーチ (*Haemaphysalis leachi*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、デルマセントル・マルギナツス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントル・レチクラツス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセントル・ピクツス (*Dermacentor pictus*)、デルマセントル・アルビピクツス (*Dermacentor albipictus*)、アンダーソンカクマダニ (*Dermacentor andersoni*)、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*)、ヒアロマ・マウリタニクム (*Hyalomma mauritanicum*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファルス・ブルサ (*Rhipicephalus bur*

10

20

30

40

50

sa)、リピセファルス・アペンジクラツス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファルス・カペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファルス・ツラニクス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファルス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*)、アメリカキラマダニ (*Amblyomma americanum*)、アムブリオンマ・バリエガツム (*Amblyomma variegatum*)、アムブリオンマ・マクラツム (*Amblyomma maculatum*)、アムブリオンマ・ヘブレウム (*Amblyomma hebraeum*)、アムブリオンマ・カジェネンセ (*Amblyomma cajennense*)、デルマニسس・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、ネッタイトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) であり；ダニ目 (*Actiniedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) およびカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) からの有害生物種、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.)、ミオビア属 (*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.)、プソロプテス属 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属 (*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.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.)、ラミノシオプテス属 (*Laminosioptes* spp.)；特定の例は：ケイレチエラ・ヤスグリ (*Cheyletiella yasguri*)、ケイレチエラ・ブラケイ (*Cheyletiella blakei*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ウシニキビダニ (*Demodex bovis*)、ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*)、ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*)、デモデックス・エクイ (*Demodex equi*)、デモデックス・カバリ (*Demodex caballi*)、ブタニキビダニ (*Demodex suis*)、アキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、ネオトロムビキュラ・デザレリ (*Neotrombicula desaleri*)、ネオシェーンガスティア・キセロテルモビア (*Neoschongastia xerothermobia*)、アカツツガムシ (*Trombicula akamushi*)、オトデクテス・シノチス (*Otodectes cynotis*)、ノトエドレス・カティ (*Notoedres cati*)、イヌセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptis canis*)、ウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes bovis*)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカプラエ (*Sarcoptes rupicaprae*) (S. カプラエ (*S. caprae*))、ウマセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes equi*)、ブタセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes suis*)、プソロプテス・オビス (*Psoroptes ovis*)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*)、コリオプテス・ボビス (*Chorioptes bovis*)、プソエルガテス・オビス (*Psoergates ovis*)、ニューモニソイディック・マンゲ (*Pneumonyssoides mange*)、イヌハナダニ (*Pneumonyssoides caninum*)、アカリンダニ (*Acarapis woodi*) であり；ウマバエ属 (*Gastero*

philus spp.)、サシバエ属 (Stomoxys spp.)、トリコデクテス属 (Trichodectes spp.)、ロードニウス属 (Rhodnius spp.)、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、トコジラミ (Cimex lecturarius)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ルシリア・クプリナ (Lucilia cuprina) が挙げられ；コナダニの例としては、カズキダニ属 (Ornithodoros spp.)、タネガタマダニ属 (Ixodes spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.) が挙げられる。

【1014】

本発明の処置は、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク剤、水薬調製物 (drenching preparation)、顆粒剤、ペースト剤、大型丸剤 (bolus)、フィードスルー (feed-through) 手順、または坐薬の形態の腸内投与；あるいは例えば、注射 (筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内を含む) または埋め込みなどの非経口投与；あるいは経鼻投与；あるいは例えば、薬浴 (bathing) または浸漬、噴霧、ポアオンおよびスポットオン、洗浄、散布の形態の皮膚適用などの従来の手段によって、および首輪、耳標、尾標、肢バンド (limb band)、端綱、マーキング装置などの活性化合物を含む成形品を用いて行われる。

10

【1015】

本発明の化合物が、追加の生物学的に活性な成分と組み合わせて施用される場合、それらは、例えば別個の組成物として別々に投与され得る。この場合、生物学的に活性な成分は、同時にまたは連続して投与され得る。あるいは、生物学的に活性な成分は、1つの組成物の成分であり得る。

20

【1016】

本発明の化合物は、制御放出形態で、例えば皮下または経口投与される徐放製剤として投与され得る。

【1017】

典型的に、本発明に係る殺寄生生物組成物は、場合により追加の生物学的に活性な成分と組み合わせて、本発明の化合物、あるいはそのN-オキシドまたは塩を、意図される投与経路 (例えば、経口または注射などの非経口投与) に関しておよび標準的手法にしたがって選択される賦形剤および助剤を含む1種以上の薬学的にまたは獣医学的に許容される担体とともに含む。さらに、好適な担体は、pHおよび水分含量に対する安定性などの考慮事項を含め、組成物中の1種以上の活性成分との適合性に基づいて選択される。したがって、注目すべきは、寄生に有効な量の本発明の化合物を、場合により追加の生物学的に活性な成分および少なくとも1種の担体と組み合わせて含む無脊椎寄生性有害生物から動物を保護するための本発明の化合物である。

30

【1018】

静脈内、筋肉内および皮下注射を含む非経口投与の場合、本発明の化合物は、油性または水性媒体中の懸濁液、溶液または乳剤として製剤化することができ、懸濁化剤、安定剤および／または分散剤などの補助剤を含有し得る。

【1019】

本発明の化合物は、ボラス注入または持続注入用に製剤化することもできる。注入用の医薬組成物は、好ましくは、医薬製剤の技術分野において公知であるような他の賦形剤または助剤を含有する生理学的に適合する緩衝液中の水溶性形態の活性成分 (例えば、活性化合物の塩) の水溶液を含む。さらに、活性化合物の懸濁液は、脂溶性媒体中で調製され得る。好適な脂溶性媒体としては、ゴマ油などの脂肪油、オレイン酸エチルおよびトリグリセリドなどの合成脂肪酸エステル、またはリポソームなどの材料が挙げられる。

40

【1020】

水性の注射用懸濁液は、ナトリウムカルボキシメチルセルロース、ソルビトール、またはデキストランなどの、懸濁液の粘度を高める物質を含有し得る。注射用の製剤は、単剤形で、例えば、アンプルまたは多回投与容器において提供され得る。あるいは、活性成

50

分は、使用前に、好適な媒体、例えば、滅菌発熱性物質除去蒸留水を用いて構成するための粉末形態であり得る。

【1021】

上述した製剤に加えて、本発明の化合物は、デポー製剤としても製剤化され得る。このような作用持続型製剤は、埋め込み（例えば、皮下または筋肉内）あるいは筋肉内または皮下注射によって投与され得る。

【1022】

本発明の化合物は、好適なポリマー材料または疎水性材料を用いて（例えば、薬学的に許容される油を用いた乳剤として）、イオン交換樹脂を用いて、または限定はされないが、難溶性の塩などの難溶性の誘導体として、この投与経路用に製剤化され得る。

10

【1023】

吸入による投与の場合、本発明の化合物は、加圧されたパックまたは噴霧器および好適な噴射剤、例えば、限定はされないが、ジクロロジフルオロメタン、トリクロロフルオロメタン、ジクロロテトラフルオロエタンまたは二酸化炭素を用いて、エアゾールスプレーの形態で送達され得る。加圧されたエアゾールの場合、投与単位は、計量された量を供給する弁を設けることによって制御され得る。吸入具または吸入器に使用するための、例えばゼラチンのカプセル剤およびカートリッジが、化合物の粉末混合物およびラクトースまたはデンプンなどの好適な粉末基剤を含有して製剤化され得る。

【1024】

本発明の化合物は、経口投与および摂取から全身アベイラビリティを提供する好ましい薬物動態学および薬力学的特性を有し得る。したがって、保護されるべき動物による摂取の後、血流中の殺寄生生物的に有効な濃度の本発明の化合物は、ノミ、マダニおよびシラミなどの吸血有害生物から処置された動物を保護し得る。したがって、注目すべきは、経口投与（すなわち、殺寄生生物的に有効な量の本発明の化合物に加えて、経口投与に適した結合剤および充填剤から選択される1種以上の担体ならびに飼料濃縮物担体を含む）用の形態で無脊椎寄生性有害生物から動物を保護するための組成物である。

20

【1025】

溶液（吸収のために最も利用しやすい形態）、乳剤、懸濁液、ペースト剤、ゲル、カプセル剤、錠剤、ボーラス、粉剤、顆粒剤、ルーメンリテンション（*rumen-retention*）および飼料／水／リック（*lick*）ブロックの形態における経口投与の場合、本発明の化合物は、糖類および糖誘導体（例えば、ラクトース、スクロース、マンニトール、ソルビトール）、デンプン（例えば、トウモロコシデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、ジャガイモデンプン）、セルロースおよび誘導体（例えば、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルヒドロキシセルロース）、タンパク質誘導体（例えば、ゼイン、ゼラチン）、および合成ポリマー（例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン）などの、経口投与組成物に適していることが当該技術分野において公知の結合剤／充填剤を用いて製剤化され得る。必要に応じて、潤滑剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム）、崩壊剤（例えば、架橋ポリビニルピロリジノン、寒天、アルギン酸）および染料または顔料が加えられ得る。ペースト剤およびゲルは、組成物を口腔と接触した状態に保ち、容易に排出されないようにするために、接着剤（例えば、アカシア、アルギン酸、ベントナイト、セルロース、キサンタンガム、コロイド状ケイ酸マグネシウムアルミニウム）も含有することが多い。

30

40

【1026】

一実施形態において、本発明の組成物は、咀嚼可能および／または食用製品（例えば、チュアブルトリート（*chewable treat*）または食用錠剤）に製剤化される。このような製品は、本発明の化合物の経口投与を促進するように、保護されるべき動物が好む味、舌触りおよび／または香りを理想的には有するであろう。

【1027】

殺寄生生物組成物が、飼料濃縮物の形態である場合、担体は、典型的に、生産性の高い飼料、飼料穀物またはタンパク質濃縮物から選択される。このような飼料濃縮物を含有す

50

る組成物は、殺寄生生物性の活性成分に加えて、動物の衛生または成長を促進し、食肉処理用の動物の肉の品質を高め、または畜産に有用な添加剤を含み得る。これらの添加剤としては、例えば、ビタミン、抗生物質、化学療法剤、静菌剤、静真菌剤、抗コクシジウム剤およびホルモンが挙げられる。

【1028】

本発明の化合物はまた、例えば、カカオ脂または他のグリセリドなどの従来の坐薬基剤を用いて、坐薬または停留かん腸などの直腸組成物に製剤化され得る。

【1029】

本発明の方法のための製剤としては、BHT（ブチル化ヒドロキシトルエン）などの酸化防止剤が挙げられる。酸化防止剤は、一般に、0.1～5パーセント（重量／体積）の量で存在する。製剤によっては、特にスピノサドが含まれる場合、活性剤を溶解させるためにオレイン酸などの可溶化剤を必要とする。これらのポアオン製剤（pour-on formulation）に使用される一般的な展着剤としては、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、飽和C₁₂～C₁₈脂肪族アルコールのカプリル酸／カプリン酸エステル、オレイン酸、オレイルエステル、オレイン酸エチル、トリグリセリド、シリコン油およびジプロピレングリコールメチルエーテルが挙げられる。本発明の方法のためのポアオン製剤は、公知の技術にしたがって調製される。ポアオンが溶液である場合、殺寄生生物剤／殺虫剤は、必要に応じて熱および攪拌を用いて、担体または媒体と混合される。助剤または追加の成分を、活性剤と担体との混合物に加えることができ、またはそれらを、担体を加える前に活性剤と混合することができる。乳剤または懸濁液の形態のポアオン製剤は、公知の技術を用いて同様に調製される。

【1030】

比較的疎水性の医薬化合物のための他の送達系が用いられてもよい。リポソームおよび乳剤が、疎水性薬物用の送達媒体または担体の周知の例である。さらに、ジメチルスルホキシドなどの有機溶媒が、必要に応じて使用されてもよい。

【1031】

有効な寄生性の無脊椎有害生物防除に必要な施用量（例えば「殺虫的に有効な量」）は、防除されるべき寄生性の無脊椎有害生物種、有害生物の生活環、生活段階（life stage）、有害生物の大きさ、生息場所、時期、宿主の穀物または動物、摂食行動、繁殖行動、周囲湿度、温度などの要因に応じて決まる。当業者は、所望のレベルの寄生性の無脊椎有害生物防除に必要な殺虫的に有効な量を容易に決定することができる。

【1032】

家畜への使用について一般に、本発明の化合物は、殺虫的に有効な量で、寄生性の無脊椎有害生物から保護されるべき動物、特に恒温動物に投与される。

【1033】

殺虫的に有効な量は、標的の寄生性の無脊椎有害生物の発生または活性を減少させる観察可能な効果を得るのに必要な活性成分の量である。当業者は、殺虫的に有効な用量が、本発明の方法に有用な様々な化合物および組成物、所望の殺虫効果および持続時間、標的の寄生性の無脊椎有害生物種、保護されるべき動物、投与形態などについて変化し得ることを理解し、特定の結果を得るために必要な量を、簡単な実験によって決定することができる。

【1034】

動物への経口または非経口投与の場合、好適な間隔で投与される本発明の組成物の用量は、典型的に、動物の体重の1kg当たり、約0.01mg～約100mg、好ましくは約0.01mg～約30mgの範囲である。

【1035】

動物への本発明の組成物の投与の好適な間隔は、およそ1日1回からおよそ年1回までの範囲である。注目すべきは、およそ週1回からおよそ6ヶ月ごとの範囲の投与間隔である。特に注目すべきは、月1回の投与間隔（すなわち毎月1回、動物に化合物を投与する）である。

10

20

30

40

50

【1036】

以下の実施例は、本発明を例示するが、本発明を限定するものではない。

この項において、以下の略語を使用した：DMF：ジメチルホルムアミド；THF：テトラヒドロフラン；EtOAc：酢酸エチル；s＝一重項；bs＝幅広の一重項；d＝二重項；dd＝二重の二重項；dt＝二重の三重項；t＝三重項、tt＝三重の三重項、q＝四重項、sept＝七重項；m＝多重項；Me＝メチル；Et＝エチル；Pr＝プロピル；Bu＝ブチル；M. p.＝融点；RT＝保持時間、 $[M+H]^+$ ＝分子カチオンの分子量、 $[M-H]^-$ ＝分子アニオンの分子量。

【1037】

以下のLC-MS法を用いて、化合物を特性評価した：

10

【1038】

【表70】

方法A

MS	Waters製のZQ Mass Spectrometer(シングル四重極質量分析計)、イオン化法:エレクトロスプレー、極性:正イオン化、キャピラリー(kV)3.00、コーン(V)30.00、抽出装置:2.00V、イオン源温度(℃)100、脱溶媒和温度(℃)250、コーンガス流(L/時)50、脱溶媒和ガス流(L/時)400、質量範囲:100~900Da			
LC	Agilent製の1100er Series HPLC:クォータナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。 カラム:Phenomenex Gemini C18, 3 μ m, 30 $\times$ 3mm, 温度:60℃;DAD 波長範囲(nm):210~500 溶媒勾配: A=H ₂ O+5%のMeOH+0.05%のHCOOH B=アセトニトリル+0.05%のHCOOH			
	時間(分)	時間(分)	時間(分)	時間(分)
	0.00	0.00	0.00	0.00
	2.00	2.00	2.00	2.00
	2.80	2.80	2.80	2.80
	2.90	2.90	2.90	2.90

20

30

【1039】

【表 7 1】

方法 B

MS	Waters 製の ZMD Mass Spectrometer(シングル四重極質量分析計)、イオン化法:エレクトロスプレー、極性:正イオン化、キャピラリー(kV)3.80、コーン(V)30.00、抽出装置(V)3.00、イオン源温度(℃)150、脱溶媒和温度(℃)350、コーンガス流(L/時)オフ、脱溶媒和ガス流(L/時)600、質量範囲:100~900Da			
LC	Agilent 製の 1100er Series HPLC:クォータリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置 カラム:Phenomenex Gemini C18, 3μm, 30×3mm、温度:60℃;DAD 波長範囲(nm):200~500 溶媒勾配: A=H ₂ O+5%の MeOH+0.05%の HCOOH B=アセトニトリル+0.05%の HCOOH			
	時間(分)	A%	B%	流量(ml/分)
	0.00	100	0.0	1.700
	2.00	0	100	1.700
	2.80	0	100	1.700
	2.90	100	0	1.700
	3.00	100	0	1.700

10

20

【1 0 4 0】

【表 7 2】

方法 C

MS	Waters 製の ACQUITY SQD Mass Spectrometer(シングル四重極質量分析計) イオン化法:エレクトロスプレー 極性:正イオン キャピラリー(kV)3.00、コーン(V)20.00、抽出装置(V)3.00、イオン源温度(℃)150、脱溶媒和温度(℃)400、コーンガス流(L/時)60、脱溶媒和ガス流(L/時)700 質量範囲:100~800Da DAD 波長範囲(nm):210~400			
LC	以下の HPLC 勾配条件を有する Waters 製の ACQUITY UPLC による方法 (溶媒 A:水/メタノール 9:1、0.1%のギ酸および溶媒 B:アセトニトリル、0.1%のギ酸)			
	時間(分)	A%	B%	流量(ml/分)
	0	100	0	0.75
	2.5	0	100	0.75
	2.8	0	100	0.75
	3.0	100	0	0.75

30

40

【1 0 4 1】

【表 7 3】

方法 D

キラル HPLC	Waters 製の Alliance 2695 HPLC: 溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置 カラム: Chiralpak IB、長さ(mm)250、内径(mm)4.6、粒径(μ)5、波長(nm):270nm、温度($^{\circ}$ C)30、溶媒:定組成のイソプロピルアルコール:ヘプタン:ジエチルアミン 30:70:0.1、注入量 50 μ L、流量(ml/分)1

10

【1 0 4 2】

【表 7 4】

方法 E

MS	Waters 製の ACQUITY SQD Mass Spectrometer(シングル四重極質量分析計) イオン化法:エレクトロスプレー 極性:正イオン キャピラリー(kV)3.00、コーン(V)20.00、抽出装置(V)3.00、イオン源温度($^{\circ}$ C)150、脱溶媒和温度($^{\circ}$ C)400、コーンガス流(L/時)60、脱溶媒和ガス流(L/時)700 質量範囲:100~800Da DAD 波長範囲(nm):210~400			
LC	以下の HPLC 勾配条件を有する Waters 製の ACQUITY UPLC による方法 (溶媒 A:水/メタノール 9:1、0.1%のギ酸および溶媒 B:アセトニトリル、0.1%のギ酸)			
	時間(分)	A%	B%	流量(ml/分)
	0	100	0	0.75
	2.5	0	100	0.75
	2.8	0	100	0.75
	3.0	100	0	0.75

20

30

【1 0 4 3】

【表 7 5】

方法 F

キラル HPLC	Waters 製の Alliance 2695 HPLC: 溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置 カラム: Chiralpak IA、長さ(mm)250、内径(mm)4.6、粒径(μ)5、波長(nm):270nm、温度($^{\circ}$ C)30、溶媒:定組成のイソプロピルアルコール:ヘプタン 10:90、注入量 50 μ L、流量(ml/分)1

40

【1 0 4 4】

【表 7 6】

方法 G

MS	島津製作所(Shimadzu)製の LC-20AD Mass Spectrometer(シングル四重極質量分析計) イオン化法:エレクトロスプレー 極性:正および負イオン キャピラリー(kV)1.50、抽出装置(V)5.00、イオン源温度(℃)200、脱溶媒和温度(℃)250、 コーンガス流(L/時)90、脱溶媒和ガス流(L/時)90 質量範囲:50~1000Da			
LC	以下の HPLC 勾配条件を有する Waters 製の ACQUITY UPLC による方法 (溶媒 A:水、0.1%のトリフルオロ酢酸および溶媒 B:アセトニトリル、0.1%のトリフルオロ酢酸)			
	時間(分)	A%	B%	流量(ml/分)
	0	90	10	1.00
	15.00	0	100	1.00
	25.00	0	100	1.00
	27.00	90	10	1.00
	36.00	90	10	1.00

10

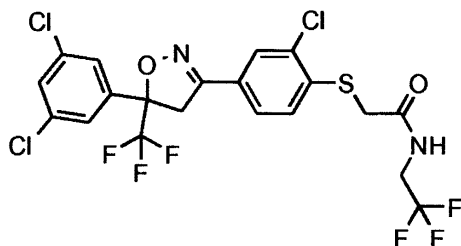
【実施例】

20

【1045】

実施例 1：2- {2-クロロ-4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物 A 29)

【化 5 4】

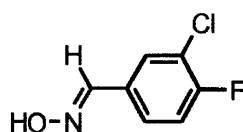


30

工程 A：3-クロロ-4-フルオロベンズアルデヒドオキシム

【化 5 5】

40



室温でエタノール (80 ml) 中の 3-クロロ-4-フルオロベンズアルデヒド (6 g) の攪拌溶液を、50%のヒドロキシルアミン水溶液 (3.7 g) で処理し、得られた溶液を、室温で3時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた油性残渣を、酢酸

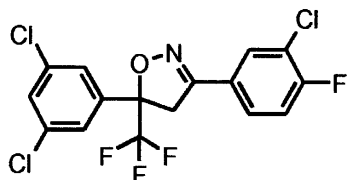
50

エチルに溶解させ、水、塩水で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗製の表題化合物（6.33 g）を得て、これをそのまま次の工程に使用した。LCMS（方法A）RT 1.49分間、 $[M+H]^+$ 174/176。

【1046】

工程B：5-（3，5-ジクロロフェニル）-3-（3-クロロ-4-フルオロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール

【化56】

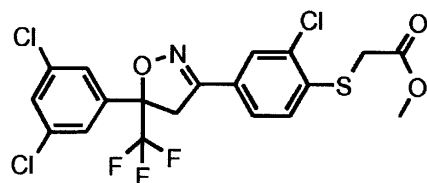


0℃でDMF（80 ml）中の3-クロロ-4-フルオロベンズアルデヒドオキシム（6.2 g）の溶液に、N-クロロスクシンイミド（4.8 g）を何度かに分けて（portionwise）加えた。得られた混合物を室温で3時間攪拌し、次に0℃に冷却し、1,3-ジクロロ-5-（1-トリフルオロメチルビニル）-ベンゼン（13 g、国際公開第2009/080250号パンフレットに記載されるように調製された）、続いて、トリエチルアミン（7.5 ml）を加えた。反応混合物を、室温で24時間攪拌させ、酢酸エチルで希釈し、有機層を、水（3×75 ml）および塩水溶液で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗生成物（18 g）を得て、これを、Combiflash Rf200（220 gのカラム）を用いて精製し、ヘプタン/酢酸エチルで溶離して、表題化合物を黄色の固体（11 g）として得た。LCMS（方法A）RT 2.30分間。 $^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 、400 MHz）：3.69（d，1H）、4.06（d，1H）、7.20～7.70（m，6H）。

【1047】

工程C：{2-クロロ-4-[5-（3，5-ジクロロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル

【化57】



DMF（10 ml）中の5-（3，5-ジクロロフェニル）-3-（3-クロロ-4-フルオロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール（825 mg）および炭酸カリウム（700 mg）の溶液に、室温でチオグリコール酸メチル（0.20 ml）を加え、反応混合物を1時間攪拌し、酢酸エチルで希釈し、次に水に注いだ。混合物を酢酸エチル（3×10 ml）で抽出し、有機層を組み合わせ、水（5×30 ml）、塩水溶液で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗製の表題化合物を得て、これを、フラッシュクロマトグラフィー（ヘプタン/EtOAc 80/20）によって精製して、表題化合物を黄色の固体（770 m

10

20

30

40

50

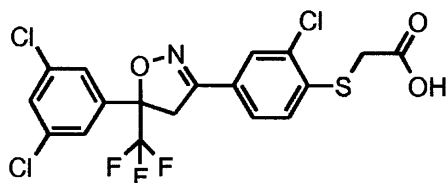
g) として得た。LCMS (方法A) RT 2.35分間。[M+H]⁺ 498/500。¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz): 3.69 (1, 2H)、3.70 (s, 2H)、3.75 (s, 3H)、4.05 (d, 1H)、7.35~7.65 (m, 6H)。

【1048】

工程D: {2-クロロ-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸

【化58】

10



エタノール (15ml) 中の、{2-クロロ-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル (700mg) と、2NのNaOH溶液 (2.2ml) との混合物を、室温で1時間攪拌し、次に溶媒を減圧下で除去した。残渣を、酢酸エチルに溶解させ、次にHClの1Nの溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮して、690mgの粗製の表題化合物を固体 (690mg) として得た。LCMS (方法A) RT 2.33分間。[M-H]⁻ 482/484。¹H-NMR (DMSO, 400MHz): 3.45 (s, 2H)、4.30 (d, 1H)、4.35 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.6 (d, 1H)、7.62 (m, 2H)、7.7 (s, 1H)、7.80 (t, 1H)。

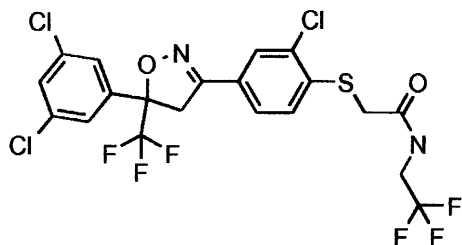
20

【1049】

工程E: 2-{2-クロロ-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

30

【化59】



40

アセトニトリル (7ml) 中の2, 2, 2-トリフルオロエチルアミン (78mg)、7-アザ-1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (AZA, HOBt, 110mg)、O-ベンゾトリアゾール-1-イル-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU, 257mg) およびトリエチルアミン (0.16ml) を含有する混合物に、アセトニトリル (8ml) に溶解させた、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-

50

イル} - フェニルスルファニル} - 酢酸 (320 mg)、およびトリエチルアミン (0.16 ml) を、アルゴン雰囲気下で、室温で15分間にわたって加えた。得られた反応混合物を、室温で一晩攪拌し、塩化アンモニウム水溶液で急冷し、次に酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を、水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮乾固した。生成物を、クロマトグラフィー (Isolute Flash、4 gのカラム) によって精製し、ジクロロメタンおよびメタノールで溶離して、表題生成物 (50 mg) を得た。LCMS (方法B) RT 6.08分間、 $[M+CH_3CN]^+$ 606/608; ^1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): 3.65 (d, 1H)、3.78 (s, 2H)、3.90 (m, 2H)、4.05 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.20 (d, 1H)、7.42 (s, 1H)、7.50 (m, 3H)、7.71 (s, 1H)。

10

【1050】

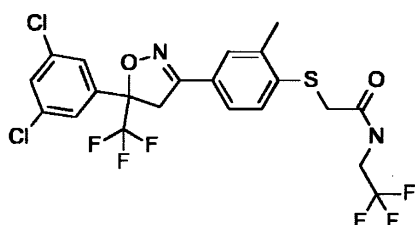
以下の化合物を、実施例1に記載される方法と同様の方法にしたがって調製した：2-{2-ブromo-4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物A29)

【1051】

実施例2. 1: 2-{2-メチル-4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物A49)

20

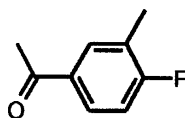
【化60】



30

工程A: 1-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-エタノン

【化61】



40

乾燥 CH_2Cl_2 (50 ml) 中の2-フルオロトルエン (10.0 g、90.8 mmol) および塩化アセチル (6.64 ml、93.4 mmol) の溶液に、 $AlCl_3$ (15.3 g、115 mmol) を何度かに分けて加えた (注意: 激しい発熱反応)。反応物を室温で24時間攪拌した。反応を完了させるために、混合物を2時間加熱還流させた。反応混合物を、飽和 Na_2CO_3 水溶液で急冷し、 Et_2O で希釈し、Celite (登録商標) のパッドに通してろ過した。次に有機相を分離し、飽和 $NaCl$ 水溶液で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。フラッシュクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘプタン: 酢酸エチル 97:3 ~ 90:10) による精製により、表題生成物が薄茶色

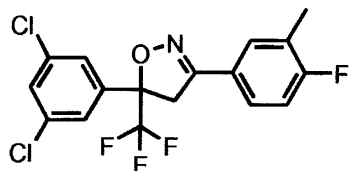
50

の油 (13.6 g) として得られた。LCMS (方法B) RT 1.50 分間。[M+H]⁺ 153。¹H NMR (400 MHz、CDCl₃) 2.32 (d, 3H)、2.58 (s, 3H)、7.06 (t, 1H)、7.77~7.81 (m, 1H)、7.83 (d, 1H)。

【1052】

工程B：5- (3, 5-ジクロロフェニル) -3- (4-フルオロ-3-メチルフェニル) -5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール

【化62】

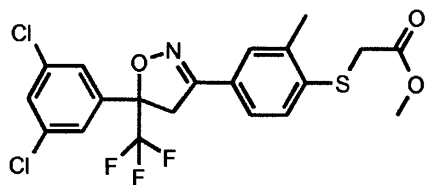


1, 2-ジクロロエタン (90 ml) 中の、1- (4-フルオロ-3-メチルフェニル) -エタノン (4.56 g)、1- (3, 5-ジクロロフェニル) -2, 2, 2-トリフルオロエタノン (7.3 g) および炭酸カリウム (4.1 g) の懸濁液を、トリエチルアミン (0.4 ml) で処理し、得られた混合物を、100℃で12時間加熱した。反応混合物を0℃に冷却し、次に、臭化テトラブチルアンモニウム (2.9 g)、4Nの水酸化ナトリウム水溶液 (15 ml) およびヒドロキシルアミン (水中50%、4.2 ml) を連続して加え、得られた混合物を0℃で3時間攪拌した。反応混合物を、ジクロロメタンで希釈し、1Nの塩酸で中和した。水層をジクロロメタン (2×50 ml) で抽出し、次に有機層を組み合わせ、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、表題生成物をワックス質の黄色の固体として得た。M. p. 72~74℃。LCMS (方法A) RT 2.32 分間。[M+H]⁺ 392/394。¹H NMR (400 MHz、CDCl₃) 2.31 (s, 3H)、3.70 (d, 1H)、4.10 (d, 1H)、7.05 (m, 1H)、7.40~7.60 (m, 5H)。

【1053】

工程C：{4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル] -2-メチルフェニルスルファニル} -酢酸メチルエステル

【化63】



密閉管に、5- (3, 5-ジクロロフェニル) -3- (4-フルオロ-3-メチルフェニル) -5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール (980 mg)、炭酸セシウム (900 mg)、チオグリコール酸メチル (0.25 ml) およびジメチルホルムアミド (10 ml) を充填した。得られた混合物を、130℃で一晩加熱し、次に室温に冷まし、過剰な水を加えた。混合物を酢酸エチル (3×30 ml) で抽出し

10

20

30

40

50

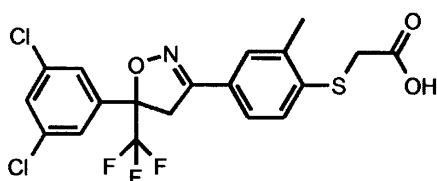
、次に、有機相を、水（ $5 \times 15 \text{ ml}$ ）、 2 N の HCl 、塩水で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗残渣を得て、これを、Combiflash Rf 200（ 24 g のカラム）を用いて精製し、ヘプタン／EtOAcで溶離した。表題生成物を、固体（ 300 mg ）として得た。LCMS（方法A）RT 1.95 分間。 $[\text{M}+\text{H}]^+$ $478/480$ 。 ^1H NMR（ 400 MHz 、 CDCl_3 ） 2.39 （s, 3 H ）、 3.70 （d, 1 H ）、 3.71 （s, 2 H ）、 3.73 （s, 3 H ）、 4.08 （d, 1 H ）、 7.30 （d, 1 H ）、 $7.41 \sim 7.53$ （m, 5 H ）。

【1054】

工程D：{4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

10

【化64】



20

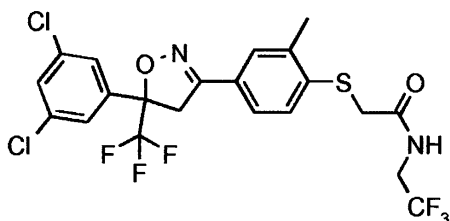
エタノール（ 13 ml ）中の、{4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル（ 600 mg ）と、 2 N の NaOH 溶液（ 2 ml ）との混合物を、室温で1時間攪拌し、次に溶媒を減圧下で除去した。残渣を、酢酸エチルに溶解させ、次に HCl の 1 N の溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮して、 511 mg の粗製の表題化合物を固体（ 690 mg ）として得た。LCMS（方法A）RT 2.14 分間。 $[\text{M}-\text{H}]^-$ $462/464$ 。 ^1H NMR（ 400 MHz 、 CDCl_3 ） 2.40 （s, 3 H ）、 3.69 （d, 1 H ）、 3.71 （s, 2 H ）、 4.07 （d, 1 H ）、 $7.30 \sim 7.60$ （m, 6 H ）。

30

【1055】

工程E：2-{4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化65】



40

アセトニトリル（ 5 ml ）中の、2,2,2-トリフルオロエチルアミン（ 0.036 ml ）、7-アザ-1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（AZA-HOBT、 61 mg ）、O-ベンゾトリアゾール-1-イル-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート（TBUTU、 144 mg ）およびトリエチルアミン（ 0.185 m

50

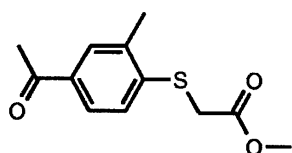
1) を含有する混合物に、アセトニトリル (5 ml) に溶解させた、{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸 (320 mg)、およびトリエチルアミン (0.09 ml) を、アルゴン雰囲気下で、室温で15分間にわたって加えた。得られた反応混合物を、室温で一晩攪拌し、塩化アンモニウム水溶液で急冷し、次に酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を、水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮乾固した。生成物を、クロマトグラフィー (Isolute Flash、4 g のカラム) によって精製し、ジクロロメタンおよびメタノールで溶離して、表題生成物 (122 mg) を得た。LCMS (方法A) RT 2.19 分間、 $[M+H]^+$ 545/547; ^1H -NMR ($CDCl_3$ 、400 MHz): 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)、7.50~7.60 (m, 3H)。

10

【1056】

実施例 2: 2: 2-{2-メチル-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物 A49)
工程 A: (4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル)-酢酸メチルエステル
【化 66】

20



密閉管に、1-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-エタノン (760 mg)、炭酸セシウム (2.4 g)、チオグリコール酸メチル (0.67 ml) およびジメチルホルムアミド (15 ml) を充填した。得られた混合物を130℃で一晩加熱し、次に室温に冷まし、過剰な水を加えた。混合物を酢酸エチル (3×30 ml) で抽出し、次に、有機相を、水 (5×15 ml)、2NのHCl、塩水で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗製の黄色の油を得て、これを、Combiflash Rf 200 (24 g のカラム) を用いて精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離した。表題生成物を、固体 (800 mg) として得た。LCMS (方法A) RT 1.53 分間。 $[M+H]^+$ 239. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) 2.40 (s, 3H)、2.58 (s, 3H)、3.77 (s, 3H)、3.78 (s, 2H)、7.30 (d, 1H)、7.75 (s, 1H)、7.77 (d, 1H)。

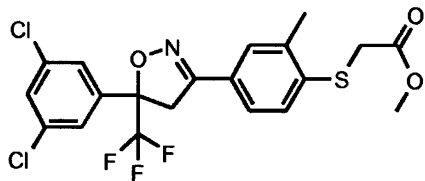
30

【1057】

工程 B: {4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル

40

【化 6 7】



10

1, 2-ジクロロエタン (10 ml) 中の、(4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル)-酢酸メチルエステル (800 mg)、1-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 2, 2-トリフルオロエタノン (802 mg)、炭酸カリウム (455 mg)、トリエチルアミン (0.05 ml) の懸濁液を、100℃で12時間加熱した。反応混合物を0℃に冷却し、次に、臭化テトラブチルアンモニウム (322 mg)、4 Nの水酸化ナトリウム水溶液 (0.82 ml) およびヒドロキシルアミン (水中50%、0.2 ml) を連続して加え、得られた混合物を0℃で3時間攪拌した。反応混合物を、ジクロロメタンで希釈し、1 Nの塩酸で中和した。水層をジクロロメタンで抽出し、次に有機層を組み合わせて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、表題生成物をワックス状の黄色の固体として得た。LCMS (方法A) RT 1.95分間。[M+H]⁺ 479/481。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.39 (s, 3H)、3.70 (d, 1H)、3.71 (s, 2H)、3.73 (s, 3H)、4.08 (d, 1H)、7.30 (d, 1H)、7.41~7.53 (m, 5H)。

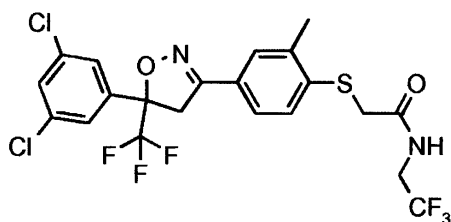
20

【1058】

工程C: {4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

【化 6 8】

30



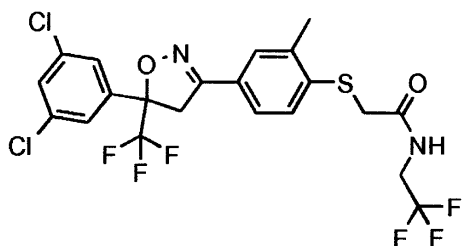
実施例2. 1、工程DおよびEに既述されるように、表題生成物を、{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステルから得た。

40

【1059】

実施例2. 3: 2-{2-メチル-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物A49)

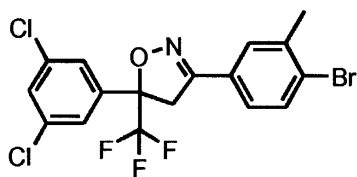
【化 6 9】



10

工程 A：5-（3，5-ジクロロフェニル）-3-（4-ブロモ-3-メチルフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソキサゾール

【化 7 0】



20

4-ブロモ-3-メチルベンズアルデヒド（25 g）を、エタノール（285 ml）および水（85 ml）に溶解させ、次に、酢酸ナトリウム（11.8 g）およびヒドロキシルアミン塩酸塩（10 g）を加えた。反応混合物を室温で10分間攪拌し、次にエタノールを減圧下で蒸発させた。残渣を酢酸エチルで抽出し、水、次に2 Nの水酸化ナトリウム、次に水および塩水で洗浄した。有機層を組み合わせて、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。残渣（黄色の油）を、シクロヘキサンから結晶化させて、4-ブロモ-3-メチルベンズアルデヒドオキシムを白色結晶（19.2 g）として得た。LCMS（方法A）RT 1.63分間。[M+H]⁺ 215/216。¹H NMR（400 MHz、CDCl₃）2.45（s，3H）、7.30～7.60（m，4H）、8.10（s，1H）。室温で、DMF（1400 ml）中の3-クロロ-4-ブロモベンズアルデヒドオキシム（15 g）の溶液に、N-クロロスクシンイミド（9.4 g）を加えた。得られた混合物を室温で2時間攪拌し、次に、DMF（45 ml）中の1，3-ジクロロ-5-（1-トリフルオロメチルビニル）ベンゼン（18.5 g、国際公開第2009/080250号パンフレットに記載されるように調製された）、続いて、DMF（90 ml）中のトリエチルアミン（7.1 ml）を、4時間にわたって滴下して加えた。反応混合物を、室温で24時間攪拌させ、酢酸エチルで希釈し、有機層を、水（3×75 ml）および塩水溶液で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗生成物を得て、これを、シクロヘキサンからの結晶化によって精製した。白色結晶（27 g）。LCMS（方法A）RT 2.40分間。¹H-NMR（CDCl₃、400 MHz）：2.46（s，3H）、3.70（d，1H）、4.10（d，1H）、7.35～7.62（m，6H）。

30

40

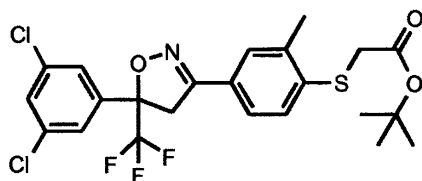
【1060】

工程 B：{4-[5-（3，5-ジクロロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-

50

酢酸 *tert*-ブチルエステル

【化 7 1】



10

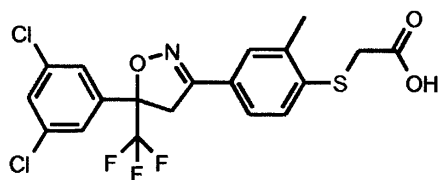
密閉管中に、5-（3，5-ジクロロフェニル）-3-（4-ブromo-3-メチルフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール（455 mg）、N，N-ジイソプロピルエチルアミン（0.33 ml）、チオグリコール酸 *tert*-ブチル（148 mg）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（46 mg）、キサントホス（58 mg）および1，4-ジオキサン（5 ml）を充填した。反応混合物を、120℃で30分間、マイクロ波照射下で加熱し、次に室温に冷まし、セライトのパッドに通してろ過した。ろ液を減圧下で濃縮して、750 mgの樹脂を得て、これを、ISCO Rf 200機械を用いたフラッシュクロマトグラフィー（カラムシリカ4 g、ヘプタン／EtOAc）によって精製して、表題生成物を黄色の樹脂（220 mg）として得た。LCMS（方法A）RT 2.53分間、 $[M+H]^+$ 520/522。¹H-NMR（CDCl₃、400 MHz）：1.36（s，9H）、2.30（s，3H）、3.55（s，2H）、3.60（d，1H）、4.00（d，1H）、7.20～7.45（m，6H）。

20

【1061】

工程C：{4-〔5-（3，5-ジクロロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル〕-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

【化 7 2】



30

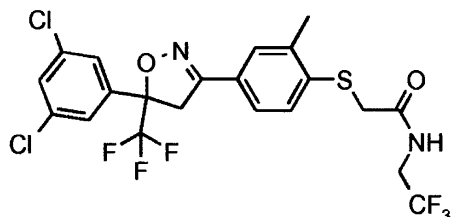
ジクロロメタン（6 ml）中の{4-〔5-（3，5-ジクロロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル〕-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸 *tert*-ブチルエステル（200 mg）の溶液を、室温で1時間にわたってトリフルオロ酢酸（0.43 ml）で処理し、次に溶液を減圧下で濃縮して、粗表題酸（180 mg）を黄色の樹脂として得た。LCMS（方法A）RT 2.26分間、 $[M+H]^+$ 464/466。

40

【1062】

工程D：2-〔4-〔5-（3，5-ジクロロフェニル）-5-トリフルオロメチル-4，5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル〕-2-メチルフェニルスルファニル〕-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）-アセトアミド

【化 7 3】



10

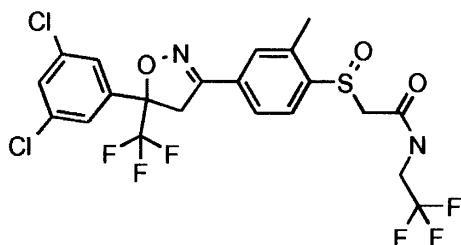
実施例 2. 1、工程 E に既述されるように、表題生成物を、{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸から得た。

【1063】

実施例 3：2-{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルベンゼンスルフィニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物 A 50)

【化 7 4】

20



30

0℃で、ジクロロメタン (4 ml) 中の 2-{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (44 mg) の溶液に、水 (1.5 ml) 中の炭酸水素ナトリウム (40 mg) の溶液、次に 3-クロロ過安息香酸 (70% w/w、22 mg) を加えた。得られた混合物を室温で 1 時間攪拌させた。次に反応混合物をジクロロメタンで抽出し、次に有機相を水で 2 回洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、粗生成物 (50 mg) を固体として得た。ISCO Rf 機械を用いたクロマトグラフィー (ジクロロメタン、次に 5% のメタノール) による精製により、表題生成物 (41 mg) が、白色の固体およびジアステレオマーの混合物として得られた。M. p. 80~83℃。LCMS (方法 B) RT 2.11 分間、[M+H]⁺ 561/563。¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz): 2.35 (s, 3H)、3.40 (d, 1H)、3.65 (d, 1H)、3.70~3.90 (m, 2H)、3.75 (d, 1H)、4.05 (d, 1H)、7.20~7.80 (m, 6H)。

40

【1064】

以下の化合物を、実施例 3 に記載される方法と同様の方法にしたがって調製した：2-{2-ブromo-4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-ベンゼンスルフィニル}-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物 A 78)；2-{2-クロロ

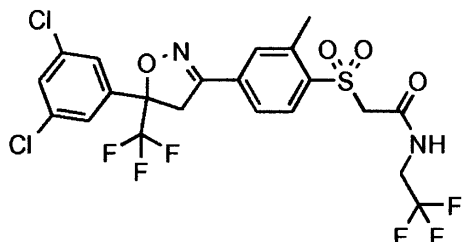
50

－4－〔4－（3，5－ジクロロフェニル）－4－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロ－3H－ピロール－2－イル〕－ベンゼンスルフィニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（化合物B2）。

【1065】

実施例4：2－〔4－〔5－（3，5－ジクロロフェニル）－5－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロイソキサゾール－3－イル〕－2－メチルフェニルスルホニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（化合物A51）

【化75】



0℃で、ジクロロメタン（4ml）中の2－〔4－〔5－（3，5－ジクロロフェニル）－5－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロイソキサゾール－3－イル〕－2－メチルフェニルスルファニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（55mg）の溶液に、水（1.5ml）中の炭酸水素ナトリウム（50mg）の溶液、次に3－クロロ過安息香酸（70% w/w、62mg）を加えた。得られた混合物を室温で1時間攪拌させた。次に反応混合物をジクロロメタンで抽出し、次に有機相を水で2回洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、粗生成物（70mg）を固体として得た。ISCO Rf機械を用いたクロマトグラフィー（ジクロロメタン、次に5%のメタノール）による精製により、表題生成物（56mg）が白色の固体として得られた。M.p. 68～70℃。LCMS（方法B）RT 2.16分間、
 [M+H]⁺ 577/579。¹H-NMR（CDCl₃、400MHz）：2.80（s，3H）、3.70（d，1H）、3.92（m，2H）、4.10（d，1H）、4.17（s，2H）、7.40～8.00（m，6H）。

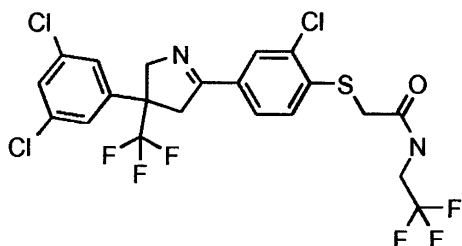
【1066】

以下の化合物を、実施例4に記載される方法と同様の方法にしたがって調製した：；2－〔2－ブromo－4－〔5－（3，5－ジクロロフェニル）－5－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロイソキサゾール－3－イル〕－ベンゼンスルホニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（化合物A53）；2－〔2－クロロ－4－〔4－（3，5－ジクロロフェニル）－4－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロ－3H－ピロール－2－イル〕－ベンゼンスルホニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（化合物B3）。

【1067】

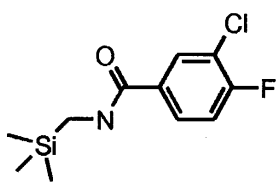
実施例5：2－〔2－クロロ－4－〔4－（3，5－ジクロロフェニル）－4－トリフルオロメチル－4，5－ジヒドロ－3H－ピロール－2－イル〕－フェニルスルファニル〕－N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－アセトアミド（化合物B1）

【化 7 6】



10

工程 A：3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシリルメチルベンズアミド
【化 7 7】



20

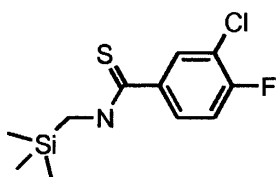
ジクロロメタン（100 ml）中の3-クロロ-4-フルオロ安息香酸（4.6 g）の溶液に、塩化オキサリル（2.5 ml）を加えた。DMF（0.01 ml）を滴下して加え、反応混合物を室温で18時間攪拌した。次に溶液を濃縮して、無色油を得て、これをトルエン（20 ml）で希釈した。この溶液を、トルエン（40 ml）中のトリメチルシリルメチルアミン（4 ml）とトリエチルアミン（10 ml）との混合物に、（約20分間で）滴下して加えた。溶液を室温で1時間攪拌し、次に200 mlの酢酸エチルを加え、得られた溶液を、水で2回（2×100 ml）および塩水（50 ml）で洗浄した。次に有機相を、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、粗製の表題化合物を固体（6.4 g）として得た。LCMS（方法C）RT 0.98分間、 $[M+H]^+$ 258/260。 ^1H-NMR （ $CDCl_3$ 、400 MHz）：0.00（s, 9H）、2.81（s, 2H）、5.90（m, 1H）、7.05（m, 1H）、7.49（m, 1H）、7.70（m, 1H）。

30

【1068】

工程 B：3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシリルメチルチオベンズアミド
【化 7 8】

40



トルエン（70 ml）中の3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシリルメチル

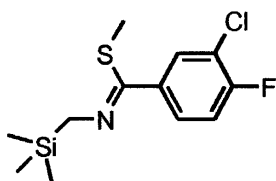
50

ーベンズアミド（6.5 g）の溶液に、ローソン試薬（11 g）を加え、反応混合物を、1時間還流状態で攪拌した。反応混合物を濃縮して、黄色の油を得て、これを、Combiflash Rf200（220 gのカラム）を用いて精製し、ヘプタン／酢酸エチルで溶離して、表題化合物を黄色の固体（5.5 g）として得た。LCMS（方法A）RT 1.98分間、 $[M+H]^+$ 276/278。 $^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 、400 MHz）：0.00（s, 9H）、3.32（d, 2H）、6.93（t, 1H）、7.38（m, 1H）、7.40（br m, 1H）、7.56（m, 1H）。

【1069】

工程C：3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシラニルメチルーチオベンズイミド酸メチルエステル

【化79】

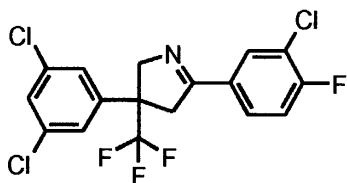


アルゴン雰囲気下で、3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシラニルメチルーチオベンズアミド（5.5 g）を、ブタノン（100 ml）に溶解させた後、炭酸カリウム（5 g）を加えた。次に、反応混合物を、1時間にわたって還流状態で攪拌させ、すぐに溶液を室温に冷ました。次にヨウ化メチル（1.9 ml）を滴下して加え、反応混合物を室温で16時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、次に100 mlの水を混合物に加えた。有機層を酢酸エチルで2回抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、黄色の液体を得て、これを、Combiflash Rf200（220 gのカラム）を用いて精製し、ヘプタン／酢酸エチルで溶離して、表題化合物を黄色の固体（4.6 g）として得た。LCMS（方法B）RT 1.81分間、 $[M+H]^+$ 290/292。 $^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 、400 MHz）：0.00（s, 9H）、2.00（s, 3H）、3.52（s, 2H）、7.00～7.50（m, 3H）。

【1070】

工程D：3-（3,5-ジクロロフェニル）-5-（3-クロロ-4-フルオロフェニル）-3-トリフルオロメチルー3,4-ジヒドロ-2H-ピロール

【化80】



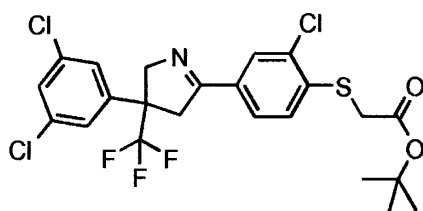
ー5℃で、THF（250 ml）中の3-クロロ-4-フルオロ-N-トリメチルシラニルメチルーチオベンズイミド酸メチルエステル（4.6 g）および1,3-ジクロロ-5-（1-トリフルオロメチルービニル）-ベンゼン（4.0 g、国際公開第2009/080250号パンフレットに記載されるように調製された）の溶液に、フッ化テトラブ

チルアンモニウム（THF中1M、0.75ml）溶液の溶液を滴下して加えた。溶液は、添加中に黄色から橙色へと変わり、次に徐々に黒色へと変わった。得られた混合物を0℃で4時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去した。残渣（8g）を、Combiflash Rf 200（220gのカラム）を用いて精製し、ヘプタン／酢酸エチルで溶離して、表題化合物を黄色の固体（4.5g）として得た。LCMS（方法A）RT 2.22分間、 $[M+H]^+$ 410/412。 ^1H -NMR（ $CDCl_3$ 、400MHz）：3.45（d，2H）、3.80（d，2H）、4.45（d，2H）、4.95（d，2H）、7.20～8.00（m，6H）。

【1071】

工程E：{2-クロロ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸tert-ブチルエステル

【化81】

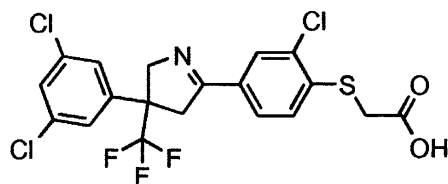


密閉管に、3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-3-トリフルオロメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール（410mg）、炭酸セシウム（490mg）、チオグリコール酸tert-ブチル（148mg）およびDMF（5ml）を充填した。得られた混合物を130℃で一晩加熱し、次に反応混合物を室温に冷まし、過剰な水を加えた。混合物をEtOAc（3×30ml）で抽出し、次に、有機相を、水（5×15ml）、2NのHCl、塩水溶液で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で乾固するまで除去し、残渣を、Combiflash Rf 200（12gのカラム）によって精製し、ヘプタン／EtOAc、次にEtOAcで溶離して、表題化合物を黄色の油として得た。LCMS（方法B）RT 2.27分間、 $[M+H]^+$ 538/540； ^1H -NMR（d-DMSO、400MHz）：1.50（s，9H）、3.45（d，2H）、3.70（s，2H）、3.76（d，2H）、4.46（d，1H）、4.90（d，1H）、7.20～7.90（m，6H）。

【1072】

工程F：{2-クロロ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸

【化 8 2】



10

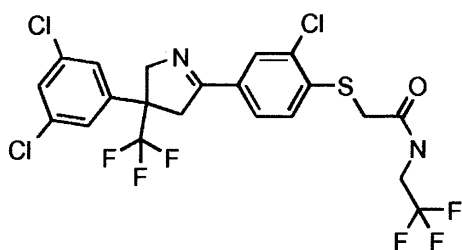
ジクロロメタン（15 ml）中の {2-クロロ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸 tert-ブチルエステル（600 mg）の溶液を、室温で1時間にわたってトリフルオロ酢酸（2.2 ml）で処理し、次に溶液を減圧下で濃縮して、黄色の樹脂を得て、これを、ジエチルエーテル中で研和して、表題化合物を固体（300 mg）として得た。LCMS（方法A）RT 2.12分間、 $[M+H]^+$ 482/484。 ^1H -NMR（d-DMSO、400 MHz）：3.75（d, 1H）、3.90（d, 1H）、4.05（s, 2H）、4.42（d, 1H）、4.85（d, 1H）、7.45（d, 1H）、7.60（s, 2H）、7.70（s, 1H）、7.85（d, 1H）、7.95（s, 1H）。

20

【1073】

工程G：2-{2-クロロ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-フェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化 8 3】



30

アセトニトリル（10 ml）中の2,2,2-トリフルオロエチルアミン（0.095 ml）、7-アザ-1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（AZA-HOBT、163 mg）、O-ベンゾトリアゾール-1-イル-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート（TBTU、385 mg）およびトリエチルアミン（0.45 ml）の溶液に、アセトニトリル（10 ml）に溶解させた、{2-クロロ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-フェニルスルファニル}-酢酸（472 mg）およびトリエチルアミン（0.45 ml）を、アルゴン雰囲気下で、室温で15分間にわたって加えた。得られた反応混合物を、室温で一晩攪拌し、塩化アンモニウム水溶液で急冷し、次に酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を、水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮乾固した。生成物を、Combiflash Rf 200（12 gのカラム）によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物（95 m

40

50

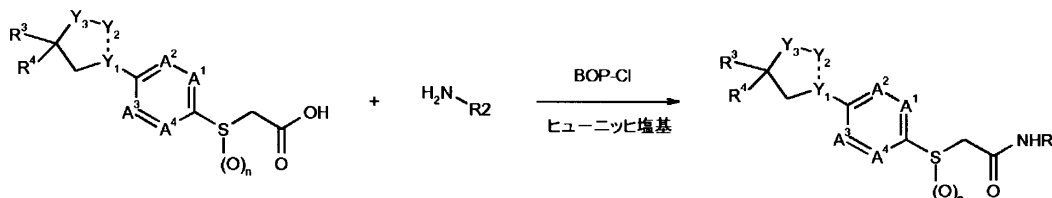
g) を固体として得た。M. p. 189℃; LCMS (方法A) RT 2.12分間、 $[M+H]^+$ 565/567; ^1H-NMR (CDCl₃, 400MHz): 3.45 (d, 1H)、3.78 (d, 1H)、3.80 (s, 2H)、4.48 (d, 1H)、4.91 (d, 1H)、7.00 (br t, NH)、7.20~7.40 (m, 4H)、7.71 (d, 1H)、7.95 (s, 1H)。

【1074】

実施例6：本発明の化合物を並行して調製するための一般的な方法

【化84】

10



N, N-ジメチルアセトアミド (「DMA」) (0.4 ml) 中のカルボン酸 (20 μ mol) の溶液に、N, N-ジメチルアセトアミド (「DMA」) (0.4 ml) 中のアミン (26 μ mol) の溶液、ジイソプロピルエチルアミン (ヒューニツヒ塩基) (0.03 ml)、および N, N-ジメチルアセトアミド (「DMA」) (0.2 ml) 中のビス (2-オキソ-3-オキサゾリジニル) ホスホン酸クロリド (「BOP-Cl」) (10.2 mg) の溶液を連続して加えた。反応混合物を 90℃ で 16 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、粗混合物を、アセトニトリル/N, N-ジメチルアセトアミド (4:1) (0.8 ml) に再び溶解させ、HPLC によって精製した。この方法を用いて、多くの化合物 (化合物番号 A1~A49) を並行して調製した。

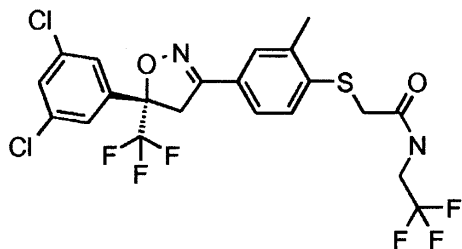
20

【1075】

実施例7. 1: 2- {4- [(S) -5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル] -2-メチルフェニルスルファニル} -N- (2, 2, 2-トリフルオロエチル) -アセトアミド (化合物 C1)

30

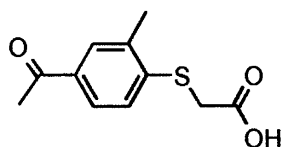
【化85】



40

工程A: (4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル) -酢酸

【化 8 6】



10

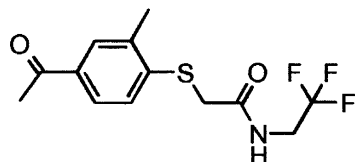
(4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル)-酢酸メチルエステル(4.3 g、実施例2.2、工程A)と、2Nの水酸化ナトリウム(55 ml)と、エタノール(180 ml)との混合物を、室温で1時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去した。残渣を、酢酸エチルに溶解させ、1NのHClで洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮して、表題化合物を黄色の固体(3.7 g)として得た。LCMS(方法A)RT 1.34分間、 $[M-H]^+$ 223; ^1H -NMR(CDC1₃, 400 MHz): 2.31 (s, 3H)、2.50 (s, 3H)、3.72 (s, 2H)、7.21 (d, 1H)、7.68 (s, 1H)、7.70 (m, 1H)、8.0~9.0 (br m, 1H)。

【1076】

工程B: 2-(4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

20

【化 8 7】



30

アセトニトリル(165 ml)中の2,2,2-トリフルオロエチルアミン(2 ml)、7-アザ-1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(AZA-HOBT、3.54 g)、O-ベンゾトリアゾール-1-イル-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート(TBTU、8.4 g)およびトリエチルアミン(4 ml)の溶液に、アセトニトリル(165 ml)に溶解させた、(4-アセチル-2-メチルフェニルスルファニル)-酢酸(3.7 g)およびトリエチルアミン(4 ml)を、アルゴン雰囲気下で、室温で15分間にわたって加えた。得られた反応混合物を、室温で一晩攪拌し、塩化アンモニウム水溶液で急冷し、次に酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を、水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮乾固した。生成物を、CombiFlash Rf200(120 gのカラム)によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物(2.5 g)を固体として得た。LCMS(方法A)RT 1.47分間、 $[M+H]^+$ 306; ^1H -NMR(CDC1₃, 400 MHz): 2.31 (s, 3H)、2.50 (s, 3H)、3.70 (s, 2H)、3.72 (m, 2H)、6.90 (br t, NH)、7.03 (d, 1H)、7.67 (d, 1H)、7.70 (s, 1H)。 ^{19}F -NMR(CDC1₃, 400 MHz): -72.4

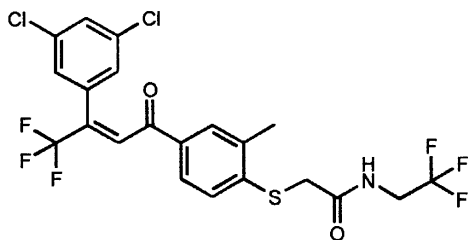
40

【1077】

工程C: 2-{4-[(E)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター-2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

50

【化 8 8】



10

1, 2-ジクロロエタン (20 ml) 中の、2-(4-アセチル-2-メチルフェニル)スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (3.5 g)、1-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 2, 2-トリフルオロエタノン (2.1 g)、炭酸カリウム (1.2 g)、およびトリエチルアミン (0.11 ml) の懸濁液を、100℃で12時間加熱した。反応混合物を室温に冷まし、ジクロロメタンと水とに分液した。水層を分離し、ジクロロメタンで抽出し、組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。残渣を、CombiFlash Rf 200 (120 g のカラム) によって精製し、ヘプタン/EtOAc で溶離して、表題生成物 (2.8 g) を黄色の油として得た。LCMS (方法A) RT 2.10 分間、 $[M+H]^+$ 530/532; ^1H -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): 2.31 (s, 3 H)、3.70 (s, 2 H)、3.82 (m, 2 H)、6.80 (br t, NH)、7.01 (d, 1 H)、7.09 (d, 2 H)、7.25 (t, 1 H)、7.28 (s, 1 H)、7.55~7.58 (m, 2 H)。 ^{19}F -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): -72.4、-66.4。

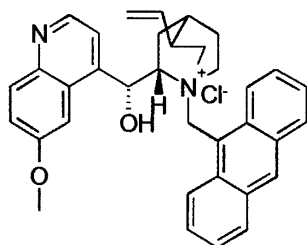
20

【1078】

工程D：触媒の調製：1-アントラセン-9-イルメチルキニニウムクロリド

【化 8 9】

30



40

トルエン (650 ml) 中の9-クロロメチルアントラセン (25 g) およびキニーネ (36 g) の溶液を、80℃で18時間加熱した。黄色の懸濁液を室温に冷まし、ジエチルエーテルに注ぎ入れ、固体をろ過によって収集した。黄色の固体 (52.9 g)。LCMS (方法A) 1.31 分間、 M^+ 515; $M.p.$ 150~152℃ (分解された)。LCMS (方法H) 1.31 分間、 M^+ 515; ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) 9.15 (d, 1 H)、8.65 (d, 1 H)、8.53 (d, 1 H)、8.40 (s, 1 H)、8.00 (m, 3 H)、7.88 (d, 1 H)、7.71 (s, 1 H)、7.68 (t, 1 H)、7.53 (t, 1 H)、7.45 (m, 2 H)、7.33 (dd, 1 H)、7.11 (d, 1 H)、7.02 (d, 1 H)、6.22 (d, 1 H)、5.

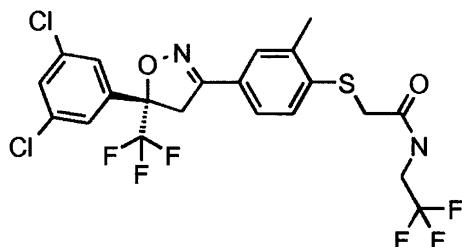
50

5.1 (m, 1H)、5.15 (m, 1H)、4.98 (m, 2H)、4.38 (m, 1H)、3.98 (s, 3H)、3.48 (m, 1H)、2.90 (m, 1H)、2.63 (t, 1H)、2.20 (m, 2H)、1.85 (m, 2H)、1.45 (m, 2H)。

【1079】

工程E：2- {4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化90】



クロロホルム (5 ml) 中の 2- {4- [(E)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブタ-2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (530 mg) の溶液に、1-アントラセン-9-イルメチルキニニウムクロリド (110 mg) を加えた。反応混合物を -15℃ で冷却し、次に、ヒドロキシルアミン (水中 50%、0.2 ml) および水酸化セシウム (水中 10N、0.27 ml) を加えた。反応物を -15℃ で 3 時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わせられた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、飽和した塩化アンモニウム水溶液で処理し、次に酢酸エチルで抽出した。組み合わせられた有機層を、水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、残渣 (600 mg) を得て、これを、Combiflash Rf 200 (24 g のカラム) によって精製し、ヘプタン/EtOAc で溶離して、表題生成物 (470 mg) を黄色の固体として得た。LCMS (方法 A) RT 2.13 分間、 $[M+H]^+$ 545/547; ^1H -NMR (CDCl₃, 400 MHz): 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)、7.50~7.60 (m, 3H)。 ^{19}F -NMR (CDCl₃, 400 MHz): -79.5、-72.4。生成物を、キラル HPLC (方法 D) によって分析した：5.53 分間 (88.1%)、7.24 分間 (10.5%)。

【1080】

工程F：2- {4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (化合物 C1) のエナンチオマー濃縮

工程Eで得られた 2- {4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド (200 mg、鏡像体過剰率 78%) を、ジエチルエーテル (7 ml) に溶解させ、0℃ で 24 時間貯蔵した。沈殿した固体をろ過して取り出し、溶液を減圧下で濃縮して、2- {4

10

20

30

40

50

ー〔(S)ー5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルフェニルスルファニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミドを白色の固体(190mg)として得た。生成物を、キラルHPLC(方法D)によって分析した: 5.99分間(96%)。

【1081】

以下の化合物を、実施例7.1に記載される方法と同様の方法にしたがって調製した: 2ー{4ー〔(S)ー5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルフェニルスルファニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド(化合物C4)。生成物を、キラルHPLC(方法D)によって分析した: 5.23分間(100%)。

10

【1082】

実施例3に記載される酸化手順にしたがって、2ー{4ー(S)ー〔5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルベンゼンスルフィニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド(化合物C2)を、工程Fで調製された2ー{4ー〔(S)ー5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルフェニルスルファニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミドから得た。同様に、2ー{4ー(S)ー〔5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ークロロベンゼンスルフィニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド(化合物C5)を、ジアステレオ異性体の混合物として得た。

20

【1083】

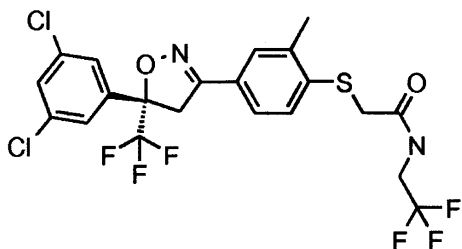
実施例3に記載される酸化手順にしたがって、2ー{4ー(S)ー〔5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルベンゼンスルホニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド(化合物C3)を、工程Fで調製された2ー{4ー〔(S)ー5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルフェニルスルファニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミドから得た。同様に、2ー{4ー(S)ー〔5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ークロロベンゼンスルホニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド(化合物C6)を得た。

30

【1084】

実施例7.2: 2ー{4ー〔(S)ー5ー(3, 5ージクロロフェニル)ー5ートリフルオロメチルー4, 5ージヒドロイソオキサゾールー3ーイル〕ー2ーメチルフェニルスルファニル}ーNー(2, 2, 2ートリフルオロエチル)ーアセトアミド

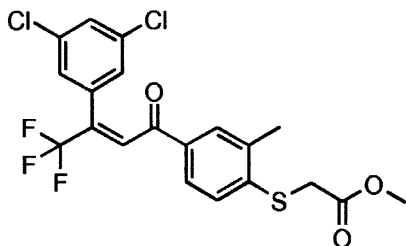
【化 9 1】



10

工程 A：{4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブ
ター-2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル

【化 9 2】



20

1,2-ジクロロエタン (25 ml) 中の、(4-アセチル-2-メチルフェニルス
ルファニル)-酢酸メチルエステル (実施例 2、工程 A、4.8 g)、1-(3,5-
ジクロロフェニル)-2,2,2-トリフルオロエタノン (5 g)、炭酸カリウム
(2.8 g)、およびトリエチルアミン (0.03 ml) の懸濁液を、100℃で12時
間加熱した。反応混合物を室温に冷まし、ジクロロメタンと水とに分液した。水層を分離
し、ジクロロメタンで抽出し、組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶
媒を減圧下で除去した。残渣 (11 g) を、Combiflash Rf 200 (125
g のカラム) によって精製し、ヘプタン/EtOAc で溶離して、表題生成物 (6.0 g
) を黄色の油として得た。LCMS (方法 A) RT 2.17 分間、 $[M+H]^+$ 46
3/465; ^1H -NMR (CDCl₃, 400 MHz): 2.31 (s, 3H)、3.7
0 (s, 3H)、3.71 (s, 2H)、7.00~7.60 (m, 7H)。 ^{19}F -NM
R (CDCl₃, 400 MHz): -66.4。

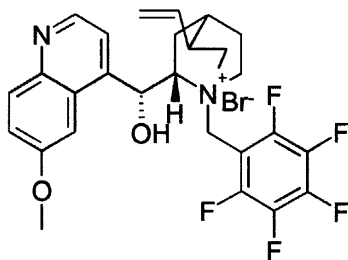
30

40

【1085】

工程 B：触媒の調製：2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルメチルキニニウム
ブロミド

【化 9 3】



10

トルエン（9 ml）中の1-ブロモメチル-2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゼン（0.52 g）およびキニーネ（0.5 g）の溶液を、80℃で18時間加熱した。反応混合物をジエチルエーテルに注ぎ入れ、次にろ過して、表題生成物を白色の固体（0.90 g）として得た。M. p. 162~165℃（分解された）。LCMS（方法G）1.08分間、 M^+ 505； ^1H NMR（400 MHz、 $CDCl_3$ ）8.78（d, 1H）、8.05（d, 1H）、7.78（d, 1H）、7.39（dd, 1H）、7.18（d, 1H）、6.73（m, 1H）、6.41（d, 1H）、6.09（d, 1H）、5.50（m, 1H）、5.04（d, 1H）、4.98（d, 1H）、4.70（m, 1H）、4.63（d, 1H）、3.98（s, 3H）、3.97（m, 1H）、3.74（m, 2H）、3.10（m, 1H）、2.81（m, 1H）、2.30（m, 2H）、2.05（m, 2H）、1.41（m, 1H）。 ^{19}F NMR（376 MHz、 $CDCl_3$ ）-132.67（s, 1F）、-146.60（s, 2F）、-158.28（s, 2F）。

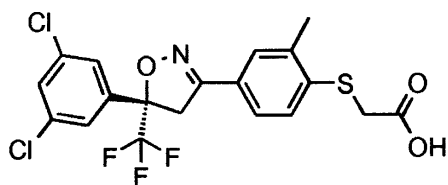
20

【1086】

工程C. 1：{4-[(S)-5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4, 5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

30

【化 9 4】



40

クロロホルム（5 ml）中の2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル-メチルキニウムブロミド（実施例7. 2、工程B、300 mg）の溶液に、クロロホルム（5 ml）中の{4-[3-(3, 5-ジクロロフェニル)-4, 4, 4-トリフルオロブター-2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル（1.15 g）を加え、得られた溶液を、-15℃に冷却した。水（2 ml）中で希釈された水酸化ナトリウム水溶液（5 M、1 ml）、続いて、水（2 ml）中で希釈されたヒドロキシルアミン（水中50%、0.31 ml）を加えた。反応物を-15℃で3時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、Redi Sep機械によって精製して、表題生成物（430 mg）を黄色の固体

50

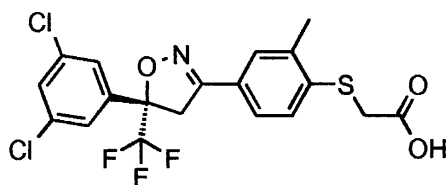
として得た。LCMS (方法A) RT 2.13分間、 $[M+H]^+$ 464/466 $[M-H]^+$ 462/464; ^1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz): 2.31 (s, 3H)、3.60 (d, 1H)、3.69 (s, 2H)、3.98 (d, 1H)、4.10 (d, 1H)、7.20~7.45 (m, 6H)。

【1087】

工程C. 2: {4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

【化95】

10



クロロホルム (5 ml) 中の1-アントラセン-9-イルメチルキニウムクロリド (実施例7. 1、工程D、315 mg) の溶液に、クロロホルム (5 ml) 中の {4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル (1.15 g) を加え、得られた溶液を、-15℃に冷却した。水 (2 ml) 中で希釈された水酸化ナトリウム水溶液 (5M、1 ml)、続いて、水 (2 ml) 中で希釈されたヒドロキシルアミン (水中50%、0.31 ml) を加えた。反応物を-15℃で3時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、Redi Sep 機械によって精製して、表題生成物 (480 mg) を黄色の固体として得た。

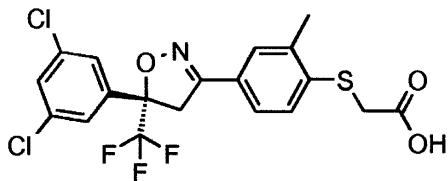
20

【1088】

工程C. 3: {4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

30

【化96】



40

クロロホルム (5 ml) 中の2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルメチルキニウムブロミド (実施例7. 2、工程B、300 mg) の溶液に、クロロホルム (5 ml) 中の {4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル (1.15 g) を加え、得られた溶液を、-15℃に冷却した。水 (4 ml) 中で希釈された水酸化セシウム (1.12 g)、続いて、水 (1 ml) 中で希釈されたヒドロキシルアミン (水中50%、0.31 ml) を加えた。反応物を-15℃で3時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫

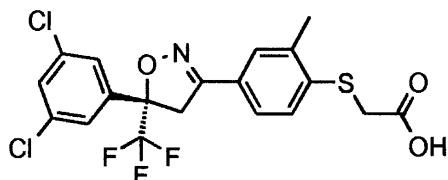
50

酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、Redi Sep 機械によって精製して、表題生成物（500mg）を黄色の固体として得た。

【1089】

工程C. 4: {4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸

【化97】

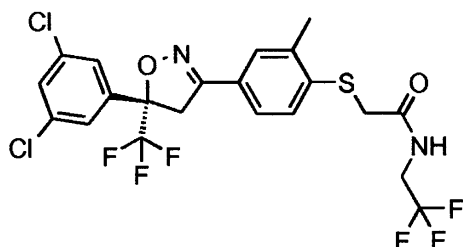


クロロホルム（5ml）中の1-アントラセン-9-イルメチルキニウムクロリド（実施例7. 1、工程D、315mg）の溶液に、クロロホルム（5ml）中の{4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター2-エノイル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸メチルエステル（1.15g）を加え、得られた溶液を、-15℃に冷却した。水（4ml）中で希釈された水酸化セシウム（1.12g）、続いて、水（1ml）中で希釈されたヒドロキシルアミン（水中50%、0.31ml）を加えた。反応物を-15℃で3時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、Redi Sep 機械によって精製して、表題生成物（220mg）を黄色の固体として得た。

【1090】

工程D. 1: 2-{4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化98】



実施例2. 1、工程Eに記載されるように、表題化合物を、{4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸（工程C. 1、450mg）から得た。生成物を、Combiflash Rf 200（24gのカラム）によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物（380mg）を黄色の固体として得た。LCMS（方法A）RT 2.13分間、[M+H]⁺ 545/547；¹

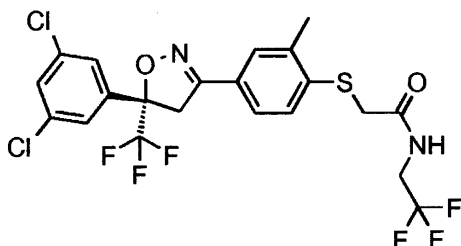
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)、7.50~7.60 (m, 3H)。 $^{19}\text{F-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : -79.5、-72.4。生成物を、キラルHPLC (方法D) によって分析した：5.18分間 (69.3%)、6.47分間 (30.7%)。

【1091】

工程D. 2 : 2- {4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル} -N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化99】

10



20

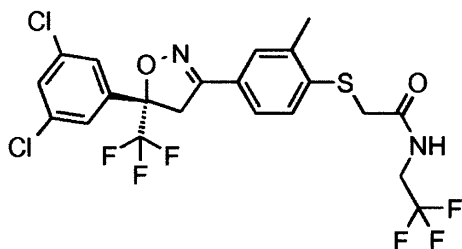
実施例2. 1、工程Eに記載されるように、表題化合物を、{4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル} -酢酸 (工程C. 2、350 mg) から得た。生成物を、Combiflash Rf 200 (24 gのカラム) によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物 (400 mg) を黄色の固体として得た。LCMS (方法A) RT 2.13分間、 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 545/547; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)、7.50~7.60 (m, 3H)。 $^{19}\text{F-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz) : -79.5、-72.4。生成物を、キラルHPLC (方法D) によって分析した：5.11分間 (86.5%)、6.38分間 (13.5%)。

30

【1092】

工程D. 3 : 2- {4- [(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル} -N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化100】



10

実施例2. 1、工程Eに記載されるように、表題化合物を、{4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸(工程C. 3、470 mg)から得た。生成物を、Combiflash Rf200(24 gのカラム)によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物(450 mg)を黄色の固体として得た。LCMS(方法A)RT 2.13分間、 $[M+H]^+$ 545/547; ^1H -NMR(CDCl₃, 400 MHz): 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)、7.50~7.60 (m, 3H)。 ^{19}F -NMR(CDCl₃, 400 MHz): -79.5、-72.4。生成物を、キラルHPLC(方法D)によって分析した: 5.01分間(87.1%)、6.22分間(12.9%)。

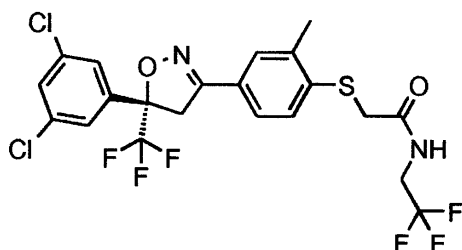
20

【1093】

工程D. 4: 2-{4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-アセトアミド

【化101】

30



40

実施例2. 1、工程Eに記載されるように、表題化合物を、{4-[(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]-2-メチルフェニルスルファニル}-酢酸(工程C. 4、200 mg)から得た。生成物を、Combiflash Rf200(24 gのカラム)によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物(180 mg)を黄色の固体として得た。LCMS(方法A)RT 2.13分間、 $[M+H]^+$ 545/547; ^1H -NMR(CDCl₃, 400 MHz): 2.40 (s, 3H)、3.68 (d, 1H)、3.75 (s, 1H)、3.92 (m, 1H)、4.10 (d, 1H)、6.95 (br t, NH)、7.12 (d, 1H)、7.40 (d, 1H)、7.45 (t, 1H)

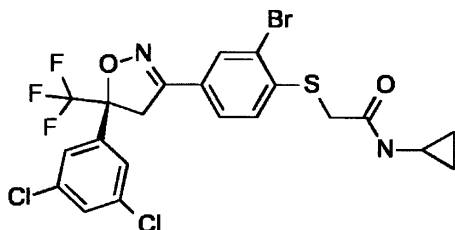
50

)、7.50~7.60 (m, 3H)。 ^{19}F -NMR (CDCl_3 , 400 MHz) : -79.5、-72.4。生成物を、キラルHPLC (方法D) によって分析した: 5.02分間 (87.1%)、6.23分間 (12.9%)。

【1094】

実施例8: 2-[2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]フェニル]スルファニル-N-シクロプロピル-アセトアミド

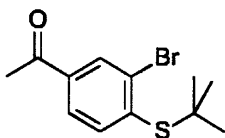
【化102】



10

工程A: 1-(3-bromo-4-tert-butylsulfanylphenyl)エタノン
【化103】

20



機械的に攪拌される反応器中に、ジメチルホルムアミド (350 mL)、1-(4-フルオロ-3-bromoフェニル)エタノン (30 g)、炭酸カリウム (29 g)、続いて、tert-butylチオール (18.7 g) を充填した。得られた懸濁液を、4時間にわたって50℃まで加熱した。次に混合物を室温に冷まし、塩水 (1 L) に注ぎ入れ、水相を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機相を塩水で洗浄し、 MgSO_4 上で乾燥させた。所望の化合物 (40 g) が残るように、溶媒を除去した。LCMS (方法E) RT 1.11分間。 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 277~279。 ^1H -NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.40 (s, 9H)、2.59 (s, 3H)、7.70 (d, 1H)、7.71 (dd, 1H)、8.19 (d, 1H)。

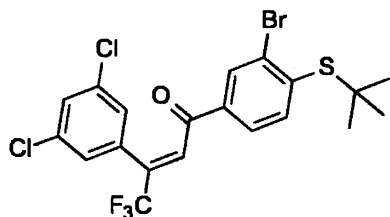
30

【1095】

工程B: (E)-1-(3-bromo-4-tert-butylsulfanylphenyl)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター2-エン-1-オン

40

【化 104】



10

1, 2-ジクロロエタン (500 ml) 中の、1-(3-ブロモ-4-tert-ブチルスルファニル-フェニル) エタノン (工程A、25.0 g)、1-(3, 5-ジクロロ-フェニル)-2, 2, 2-トリフルオロエタノン (23.3 g)、炭酸カリウム (13.5 g)、およびトリエチルアミン (1.2 ml) の懸濁液を、85℃で16時間加熱した。反応混合物を室温に冷まし、ジクロロメタンと水とに分液した。水層を分離し、ジクロロメタンで抽出し、組み合わされた有機層をMgSO₄上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。残渣 (52.5 g) を、ヘプタン/EtOAc (95:5) を用いたSiO₂におけるカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題生成物 (22.8 g) を黄色の固体として得た。LCMS (方法E) RT 1.37分間、[M+OH]⁺ 527/529/531; ¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz): 1.39 (s, 9H)、7.10 (s, 2H)、7.37 (m, 2H)、7.64 (m, 2H)、8.01 (s, 1H)。¹⁹F-NMR (CDCl₃, 400 MHz): -67.2。

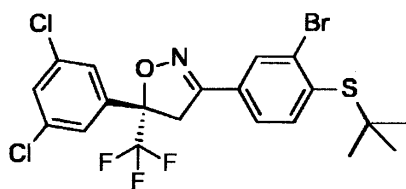
20

【1096】

工程D: (5S)-3-(3-ブロモ-4-tert-ブチルスルファニル-フェニル)-5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール

【化 105】

30



クロロホルム (50 ml) 中の (E)-1-(3-ブロモ-4-tert-ブチルスルファニル-フェニル)-3-(3, 5-ジクロロフェニル)-4, 4, 4-トリフルオロブタ-2-エン-1-オン (工程C、1.0 g) の溶液に、1-アントラセン-9-イルメチルキニウムクロリド (220 mg) を加えた。反応混合物を-20℃で冷却し、次にヒドロキシルアミン (水中50%、0.24 ml) および水酸化セシウム (水中10 N、0.46 ml) を同時に加えた。反応物を-20℃で2時間攪拌してから、室温に戻した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し; 組み合わされた有機層をMgSO₄上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガム (1 g) を得て、これを、CombiFlash Rf200 (48 gのカラム) によって精製し、ヘプタン/EtOAcで溶離して、表題生成物 (834 mg) を黄色の固体として得た。LCMS (方法E) RT 1.42分間、[M+Na]⁺ 544/546/548; ¹H-NMR (CD

40

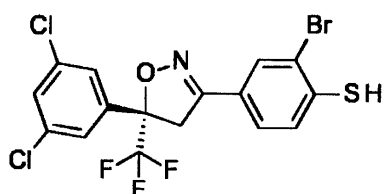
50

CDCl_3 、400 MHz) : 1.38 (s, 9H)、3.68 (d, 1H)、4.07 (d, 1H)、7.43 (t, 1H)、7.50 (s, 2H)、7.59 (dd, 1H)、7.68 (d, 1H)、7.91 (d, 1H)。 ^{19}F -NMR (CDCl_3 、400 MHz) : -79.4。生成物を、キラルHPLC (方法F) によって分析した：2.39分間 (85.2%)、3.21分間 (14.8%)。

【1097】

工程E：2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]ベンゼンチオール

【化106】

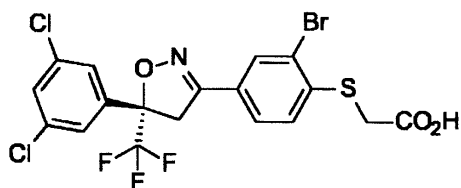


トルエン (50 mL) 中の (5S)-3-(3-ブromo-4-tert-ブチルスルファニル-フェニル)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール (5.0 g) の溶液に、トルエン-4-スルホン酸 (3.33 g) を加え、反応物を 110 °C で一晩加熱した。反応物を冷まして室温に戻し、ジクロロメタン中で希釈し、飽和 NaHCO_3 水溶液で洗浄した。有機相を MgSO_4 上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、粗生成物 (5.3 g) を得た。粗生成物を、シリカのパッドに通し、ヘプタン/酢酸エチル (8:1) で溶離した。次に、得られた生成物を、ヘプタンを用いて研和して、表題化合物をオフホワイトの固体 (3.5 g) として得た。LCMS (方法E) RT 1.33分間、 $[\text{M}-\text{H}]^-$ 468/470/472; ^1H -NMR (CDCl_3 、400 MHz) : 3.64 (d, 1H)、4.03 (d, 1H)、4.17 (s, 1H, SH)、7.39 (d, 1H)、7.41 (m, 2H)、7.49 (m, 3H)、7.78 (d, 1H)。 ^{19}F -NMR (CDCl_3 、400 MHz) : -79.5。

【1098】

工程F：2-[2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]フェニル]スルファニル酢酸

【化107】



THF (1 mL) 中の 2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]ベンゼンチオール (810 mg) の溶液に、水 (3.5 mL) およびクロロ酢酸 (166 mg) を加えた。この二相混合物に、 NaOH 溶液 (4M、0.86 mL) を8分間にわたって加え、そ

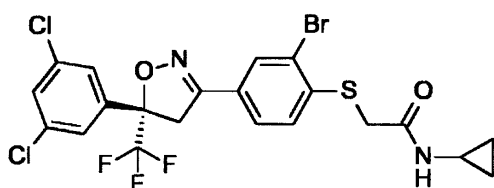
の間に混合物が均一になった。反応物を室温で一晩攪拌し、次に、HCl (4 M) を用いて pH 4 になるまで酸性化した。反応物を酢酸エチルで取った。反応物を酢酸エチルで 2 回抽出し、組み合わされた有機相を $MgSO_4$ 上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、化合物をオフホワイトの固体 (893 mg) として得た。LCMS (方法 E) RT 1.25 分間、 $[M-H]^-$ 526/528/530; ^1H -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): 3.65 (d, 1H)、3.76 (s, 2H)、4.02 (d, 1H)、7.32 (d, 1H)、7.41 (m, 1H)、7.49 (m, 2H)、7.58 (dd, 1H)、7.80 (d, 1H)、12.1 (bs, 1H, CO_2H)。 ^{19}F -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): -79.4。

【1099】

10

工程 G: 2-[2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]フェニル]スルファニル-N-シクロプロピル-アセトアミド

【化108】



20

実施例 2. 1、工程 E に記載されるように、表題化合物を、2-[2-ブromo-4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]フェニル]スルファニル酢酸から得た。LCMS (方法 E) RT 1.19 分間、 $[M+H]^+$ 567/569/571; ^1H -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): 0.41 (m, 2H)、0.75 (m, 2H)、2.76 (m, 2H)、3.63 (d, 1H)、3.65 (s, 2H)、4.02 (d, 1H)、6.65 (s, 1H, NH)、7.17 (d, 1H)、7.41 (m, 1H)、7.52 (m, 2H)、7.54 (dd, 1H)、7.85 (d, 1H)。 ^{19}F -NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): -79.4。

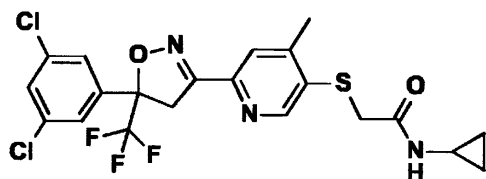
30

【1100】

実施例 9: N-シクロプロピル-2-[[6-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]-4-メチル-3-ピリジル]スルファニル]アセトアミドの合成

【化109】

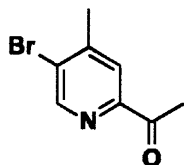
40



工程 A: 1-(5-ブromo-4-メチル-2-ピリジル)エタノンの合成

50

【化 1 1 0】



10

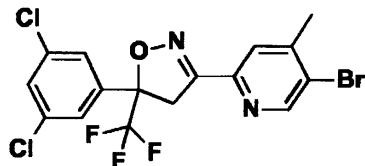
5 ml の THF に溶解させた化合物 5-ブロモ-4-メチル-ピリジン-2-カルボニトリル (450 mg) を、0 °C で 5 ml の THF 中の CH_3MgBr (2 ml、THF 中 2.8 mol/L) の溶液に加えた。1 時間攪拌した後、反応混合物を NH_4Cl 水溶液に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を塩水で洗浄し、無水 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (356 mg) を得た。 ^1H NMR (300 MHz、 CDCl_3) : δ 2.47 (s, 3H)、2.70 (s, 3H)、7.91 (s, 1H)、8.69 (s, 1H)。

【1101】

工程 B : 3-(5-ブロモ-4-メチル-2-ピリジル)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾールの合成

20

【化 1 1 1】



30

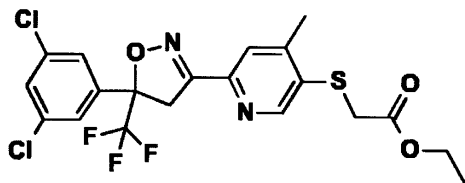
8 mL のジクロロエタン中の、化合物 1-(5-ブロモ-4-メチル-2-ピリジル)エタノン (428 mg) と、化合物 1-(3,5-ジクロロフェニル)-2,2,2-トリフルオロエタノン (726 mg) と、 K_2CO_3 (345 mg) との混合物に、 Et_3N (20 mg) を加えた。混合物を 20 時間還流させた。0 °C に冷却した後、 $\text{Bu}_4\text{N}^+\text{Br}^-$ (129 mg)、 $\text{NH}_2\text{OH} \cdot \text{HCl}$ (276 mg) および NaOH (320 mg、8 mmol、4 N) を加え、反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。次に、反応混合物を希塩酸に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を MgSO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (594 mg の 2 工程収量) を得た。 ^1H NMR (300 MHz、 $\text{DMSO}-d_6$) : δ 2.43 (s, 3H)、4.22 (d, 1H)、4.30 (d, 1H)、7.71 (s, 2H)、7.81 (s, 1H)、7.98 (s, 1H)、8.77 (s, 1H) ; ESI-MS : 453/455 ($\text{M}+\text{H}^+$)、475/477 ($\text{M}+\text{Na}^+$)。

40

【1102】

工程 C : エチル 2-[[6-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]-4-メチル-3-ピリジル]スルファニル]アセテート

【化 1 1 2】



10

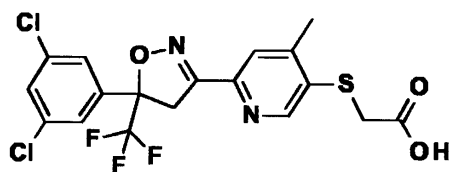
窒素下で、30 ml の乾燥 1, 4-ジオキサン中の、3-(5-ブromo-4-メチル-2-ピリジル)-5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾールの化合物合成 (453 mg) と、メルカプト酢酸エチル (180 mg) と、Pd(dba)₂ (288 mg) と、キサントホス (289 mg) と、DIPEA (194 mg) との混合物を、8 時間還流させた。得られた混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機相を無水 Na₂SO₄ 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (320 mg) を得た。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.26 (t, 3H)、2.45 (s, 3H)、3.71 (s, 2H)、3.92 (d, 1H)、4.20 (q, 2H)、4.28 (d, 1H)、7.42 (s, 1H)、7.51 (s, 2H)、7.86 (s, 1H)、8.46 (s, 1H); EI-MS: 491 (M-1)。

20

【1103】

工程 D: 2-[[[6-[[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-4-メチル-3-ピリジル]スルファニル]酢酸

【化 1 1 3】



30

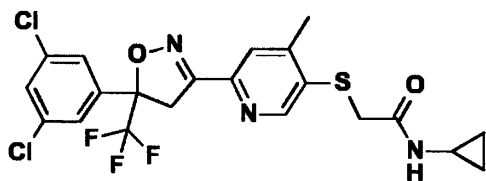
20 ml の THF および 10 ml の H₂O 中の、化合物エチル 2-[[[6-[[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-4-メチル-3-ピリジル]スルファニル]アセテート (380 mg) と LiOH·H₂O (42 mg) との混合物を、室温で 20 分間攪拌した。次に、反応混合物を希塩酸を用いて酸性化し、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を無水 Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、表題化合物 (357 mg) を得た。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆): δ 2.35 (s, 3H)、4.04 (s, 2H)、4.20 (d, 1H)、4.29 (d, 1H)、7.70 (s, 2H)、7.81 (s, 2H)、8.48 (s, 1H)。

40

【1104】

工程 E:

【化 1 1 4】



10

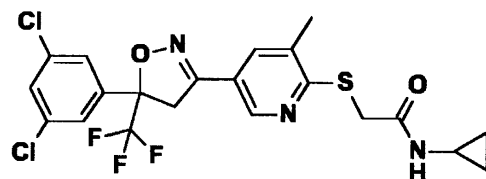
実施例 2. 1、工程 E に記載されるように、表題化合物を、2-[[6-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-4-メチル-3-ピリジル]スルファニル]酢酸から得た。¹H NMR (300 MHz、DMSO-d₆) : δ 0.35~0.39 (m, 2H)、0.58~0.65 (m, 2H)、2.35 (s, 3H)、2.58~2.64 (m, 1H)、3.74 (s, 2H)、4.20 (d, 1H)、4.29 (d, 1H)、7.71 (s, 2H)、7.80 (s, 2H)、8.30 (s, 1H)、8.49 (s, 1H) ; ¹⁹F NMR (282 MHz、DMSO-d₆) : δ -69.31 (s, 3F) ; ESI-MS : 504 (M+H⁺)、526 (M+Na⁺)、558 (M+MeOH+Na⁺) ; m. p. : 134-135°C.

20

【1105】

実施例 10 : N-シクロプロピル-2-[[5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-3-メチル-2-ピリジル]スルファニル]アセトアミドの合成

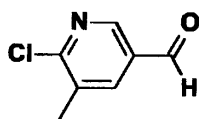
【化 1 1 5】



30

工程 A : 6-クロロ-5-メチル-ピリジン-3-カルバルデヒド

【化 1 1 6】



40

DMF (43.8 g) 中の化合物 (E)-2-メチルブタ-2-エンニトリル (21.87 g) の溶液を、90°C で POC1₃ (91.8 g) に滴下して加えた。添加後、混合物を 100°C で 15 時間攪拌した。次に、反応混合物を水に注ぎ入れ、エチルエーテルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィーによって精製して、表題化合

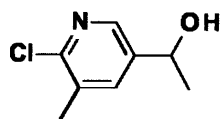
50

物 (11.6 g) を得た。 ^1H NMR (300 MHz、 CDCl_3) : δ 2.49 (s, 3H)、8.04 (s, 1H)、8.71 (s, 1H)、10.08 (s, 1H)。

【1106】

工程B：1-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)エタノール

【化117】



10

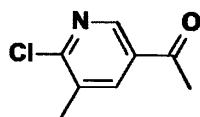
10 ml の THF に溶解させた化合物 6-クロロ-5-メチル-ピリジン-3-カルバルデヒド (1.55 g) を、0℃で、10 ml の THF 中の CH_3MgBr (10 ml、エーテル中 3 mol/L) の溶液に加えた。2時間攪拌した後、反応混合物を、 NH_4Cl 水溶液に注ぎ入れ、 CH_2Cl_2 で3回抽出した。組み合わせられた有機層を塩水で洗浄し、無水 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (1.52 g) を得た。 ^1H NMR (300 MHz、 CDCl_3) : δ 1.33 (d, 3H)、2.33 (s, 3H)、4.74~4.80 (m, 1H)、5.39 (br s, 1H)、7.75 (s, 1H)、8.20 (s, 1H) ; ESI-MS : 172 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

20

【1107】

工程C：1-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)エタノン

【化118】



30

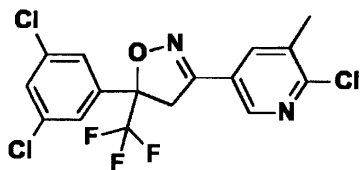
50 ml の DCM 中の PCC (4.26 g) と化合物 1-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)エタノール (1.11 g) との混合物を、室温で5時間攪拌した。次に、反応混合物をろ過し、ろ液を減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (854 mg) を得た。 ^1H NMR (300 MHz、 CDCl_3) : δ 2.46 (s, 3H)、2.64 (s, 3H)、8.09 (s, 1H)、8.77 (s, 1H) ; ESI-MS : 170 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

【1108】

工程D：3-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール

40

【化 1 1 9】



10

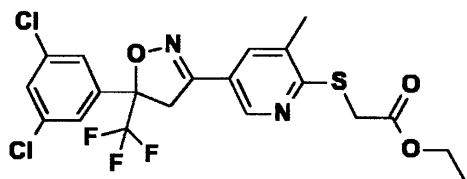
20 ml のジクロロエタン中の、化合物 1- (6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル) エタノン (850 mg) と、化合物 1- (3, 5-ジクロロフェニル) -2, 2, 2-トリフルオロエタノン (1.82 g) と、 K_2CO_3 (862 mg) との混合物に、 Et_3N (50 mg) を加えた。混合物を 16 時間還流させた。0℃に冷却した後、 $Bu_4N^+Br^-$ (322 mg)、 $NH_2OH \cdot HCl$ (690 mg、10 mmol) および $NaOH$ (800 mg、4 N) を加え、反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。次に、反応混合物を希塩酸に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を $MgSO_4$ 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (1.6 g) を得た。 ^1H NMR (300 Mz、 $DMSO-d_6$) : δ 2.39 (s, 3H)、4.37 (d, 1H)、4.43 (d, 1H)、7.62 (s, 2H)、7.83 (s, 1H)、8.17 (s, 1H)、8.55 (s, 1H)。

20

【1109】

工程 E : エチル 2- [[5- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソキサゾール-3-イル] -3-メチル-2-ピリジル] スルファニル] アセテート

【化 1 2 0】



30

窒素下で、60 ml の乾燥トルエン中の、化合物 3- (6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル) -5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソキサゾール (1.6 g) と、メルカプト酢酸エチル (560 mg) と、 $Pd(dba)_2$ (23 mg、0.04 mmol) と、キサントホス (23 mg) と、 Cs_2CO_3 (1.4 g) との混合物を 16 時間還流させた。得られた混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。有機相を無水 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (810 mg、42% の収率) を得た。 ^1H NMR (300 Mz、 $DMSO-d_6$) : δ 1.20 (t, 3H)、2.27 (s, 3H)、4.07 (s, 2H)、4.14 (q, 2H)、4.38 (q, 2H)、7.61 (s, 2H)、7.82 (s, 1H)、7.89 (s, 1H)、8.51 (s, 1H) ; ESI-MS : 515 ($M+Na^+$)。

40

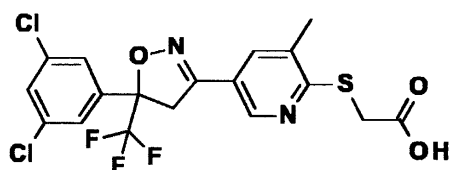
【1110】

工程 F : 2- [[5- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソキサゾール-3-イル] -3-メチル-2-ピリジル] スルファニル]

50

酢酸

【化 1 2 1】



10

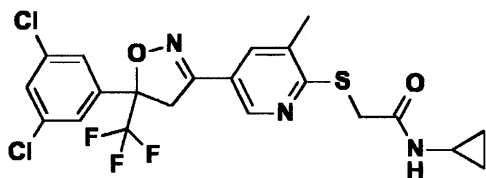
実施例 9、工程 D に記載されるように、表題化合物を、エチル 2-[[5-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-3-メチル-2-ピリジル]スルファニル]アセテートから得た。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.37 (s, 3H)、3.74 (d, 1H)、3.88 (s, 2H)、4.05 (d, 1H)、7.44 (s, 1H)、7.50 (s, 2H)、7.91 (s, 1H)、8.47 (s, 1H); ESI-MS: 463 (M-1)。

【1 1 1 1】

工程 G: N-シクロプロピル-2-[[5-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-3-メチル-2-ピリジル]スルファニル]アセトアミド

20

【化 1 2 2】



30

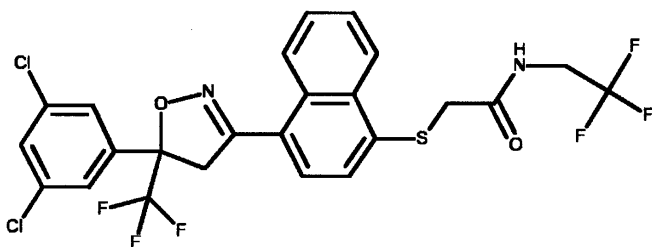
実施例 2. 1、工程 E に記載されるように、表題化合物を、2-[[5-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-3-メチル-2-ピリジル]スルファニル]酢酸から得た。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆): δ 0.41~0.43 (m, 2H)、0.62~0.64 (m, 2H)、2.26 (s, 3H)、2.62~2.63 (m, 1H)、3.89 (s, 2H)、4.33 (d, 1H)、4.39 (d, 1H)、7.62 (s, 2H)、7.83 (s, 1H)、7.88 (s, 1H)、8.26 (s, 1H)、8.53 (s, 1H); ¹⁹F NMR (282 MHz, DMSO-d₆): δ -69.05 (s, 3F); ESI-MS: 504 (M+H⁺)、526 (M+Na⁺); m. p.: 120~121 °C。

40

【1 1 1 2】

実施例 11: 2-[[4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド。化合物 G 1

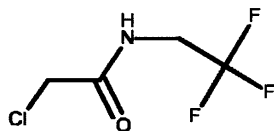
【化 1 2 3】



10

工程 1：2-クロロ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド

【化 1 2 4】



20

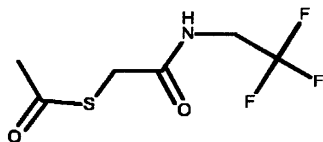
2, 2, 2-トリフルオロエチルアミン (4 ml) を、クロロホルム (50 ml) に溶解させ；溶液を、0℃に冷却し、次に、トリエチルアミン (6 ml)、続いて、塩化クロロアセチル (6 ml) を加えた。氷浴を、30分間後に除去し、溶液を室温で2時間攪拌し、次に溶媒を減圧下で除去した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/ヘプタン) によって精製して、表題生成物を白色の固体 (5 g) として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : δ 4.00 (m, 2H)、4.15 (s, 2H)、6.95 (br s, 1H)。

30

【1 1 1 3】

工程 2：S-[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]エタンチオエート

【化 1 2 5】



40

ジクロロメタン (600 ml) 中のトリエチルアミン (150 ml) およびチオ酢酸 (75 ml) の溶液を、アルゴン下で0℃に冷却した。2-スルファニル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド (155 g、工程1に記載される手順にしたがって調製された) を、ジクロロメタン (400 ml) に溶解させ、前の溶液にゆっくりと加えた。得られた溶液をさらに40分間攪拌し、その間、ベージュ色の固体がゆっくりと沈殿した。500 ml のジクロロメタンを加えて、固体を溶解させ、次に溶液を水 (500 ml) で2回、次に塩水 (200 ml) で2回洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム上で乾

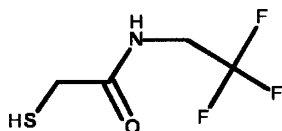
50

燥させ、溶媒を減圧下で除去して、表題生成物をベージュ色の固体（１９５ｇ）として得た。¹H NMR（４００MHz、CDCl₃）：δ ２．４０（s，３H）、３．６０（s，２H）、３．８５（m，２H）、６．７５（br s，１H）。

【１１１４】

工程３：２－スルファニル－N－（２，２，２－トリフルオロエチル）アセトアミド

【化１２６】



10

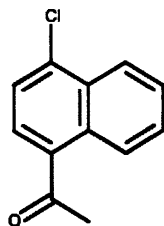
メタノール（１８００ml）中のS－[２－オキソ－２－（２，２，２－トリフルオロエチルアミノ）エチル]エタンチオエート（１９５ｇ）の溶液を、室温で１２時間にわたって、濃塩酸溶液（２７０ml）で処理し、その時点で、溶媒を減圧下で除去した。得られた油をジクロロメタン（８００ml）に溶解させ、次に沈殿物をろ過によって除去した。有機溶液を、水、次に塩水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、表題生成物をベージュ色の固体（６３ｇ）として得た。¹H NMR（４００MHz、CDCl₃）：δ ３．３０（d，２H）、３．９５（m，２H）、７．１５（br s，１H）。ESI-MS：１７４／１７６（M＋１）

20

【１１１５】

工程４：１－（４－クロロ－１－ナフチル）エタノン

【化１２７】



30

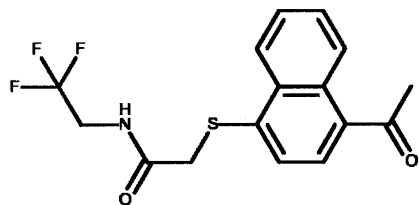
ジクロロメタン（１５０ml）中の塩化アルミニウム（２２ｇ）の懸濁液に、塩化アセチル（７．９ml）、次に１－クロロナフタレン（１４ml）を滴下して加えた（発熱）。得られた溶液を、３０分間還流させ、１０℃に冷却し、１nの塩酸溶液（３０ml）に注ぎ入れ、次にジクロロメタンで抽出した。有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、次に溶媒を減圧下で除去した。残渣を、シリカゲルにおけるフラッシュカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル／ヘプタン）によって精製して、表題生成物を黄色の油（１８ｇ）として得た。¹H NMR（４００MHz、CDCl₃）：δ １．７５（s，３H）、７．６１（d，１H）、７．６９（m，１H）、７．８５（d，１H）、８．４８（m，１H）、８．８０（m，１H）。LCMS（方法A）RT １．８１分間、[M＋H]⁺ ２０５。

40

【１１１６】

工程５：２－[(４－アセチル－１－ナフチル)スルファニル]－N－（２，２，２－トリフルオロエチル）アセトアミド

【化 1 2 8】



10

丸底フラスコに、2-スルファニル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド(1.3g)、炭酸セシウム(3.3g)、およびジメチルホルムアミド(50ml)を充填した。懸濁液を室温で30分間攪拌し、次に1-(4-クロロ-1-ナフチル)エタノン(1g)を加え、得られた溶液を室温で12時間攪拌した。混合物を、酢酸エチル(100ml)で希釈し、次に、水(5*50ml)、2Nの塩酸溶液、塩水で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で除去して、粗残渣を黄色の固体(2g)として得た。フラッシュカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/ヘプタン)により、表題生成物がベージュ色の固体(1.1g)として得られた。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): δ 1.75(s, 3H)、2.75(s, 2H)、3.90(m, 2H)、7.00(br s, 1H)、7.45(d, 1H)、7.70(m, 1H)、7.90(d, 1H)、8.30(d, 1H)、8.72(d, 1H)。LCMS(方法A)RT 0.86分間、[M+H]⁺ 342。

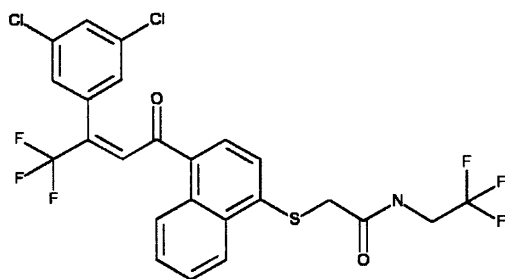
20

【1117】

工程6: 2-[[4-[[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブタ-2-エノイル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド

【化 1 2 9】

30



40

丸底フラスコに、2-[(4-アセチル-1-ナフチル)スルファニル]-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド(2.2g)、1-(3,5-ジクロロフェニル)-2,2,2-トリフルオロエタノン(1.8g)、炭酸カリウム(1g)、トリエチルアミン(0.1ml)およびジクロロエタン(22ml)を充填した。得られた溶液を、12時間還流させた。反応混合物を室温に冷まし、ジクロロメタンと水とに分液した。水層を分離し、ジクロロメタンで抽出し、組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。残渣(酢酸エチル/ヘプタン)のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより、表題生成物が黄色の固体(2g)として得られた。¹

50

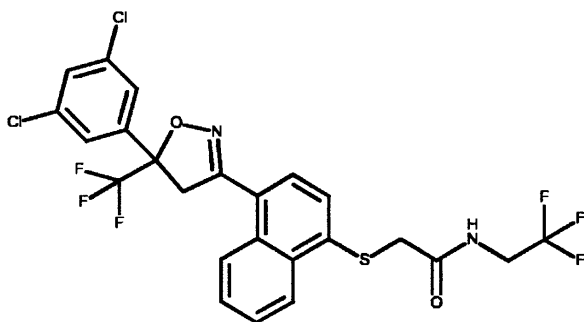
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 3.90 (s, 2H)、3.95 (m, 2H)、6.90 (br s, 1H)、7.05~7.75 (m, 8H)、8.25 (d, 1H)、8.65 (d, 1H)。LCMS (方法E) RT 2.51分間、 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 582/584。

【1118】

工程7: 2-[4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル-N-(2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド。化合物G1

【化130】

10



20

クロロホルム (3.5 ml) 中の 2-[4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロブター-2-エノイル]-1-ナフチル]スルファニル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド (200 mg) の溶液に、臭化テトラブチルアンモニウム (34 mg) を加えた。反応混合物を -15°C で冷却し、次に、ヒドロキシルアミン (水中 50%、0.05 ml) および水酸化ナトリウム (水中 10N、0.14 ml) を加えた。反応物を -15°C で 3 時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、残渣のフラッシュカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/ヘプタン) によって精製して、表題生成物を黄色の固体 (190 mg) として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 3.80~4.00 (m, 5H)、4.30 (d, 1H)、6.95 (br s, 1H)、7.30~7.80 (m, 7H)、8.35 (d, 1H)、9.00 (d, 1H)。LCMS (方法E) RT 2.25分間、 $[\text{M}+\text{H}]^+$ 581/583。生成物を、キラル HPLC (方法F) によって分析した: 10.54分間 (49.2%)、12.40分間 (50.8%)。

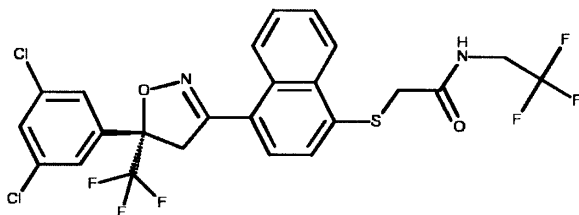
30

【1119】

実施例12: 2-[4-[5-(S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アセトアミド。化合物G2

40

【化 1 3 1】



10

クロロホルム（20 ml）中の2-[[4-[3-（3，5-ジクロロフェニル）-4，4-トリフルオロブター2-エノイル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）アセトアミド（1.1 g）の溶液に、1-アントラセン-9-イルメチルキニウムクロリド（0.22 g、実施例7、工程D）を加えた。反応混合物を-15℃に冷却し、次に、ヒドロキシルアミン（水中50%、0.25 ml）および水酸化セシウム（1.5 mlの水中0.91 g）を加えた。反応物を-15℃で3時間、次に室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで数回抽出し；組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で蒸発させて、褐色のガムを得た。残渣を、残渣のフラッシュカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル／ヘプタン）によって精製して、表題生成物を黄色の固体（900 mg）として得た。¹H NMR（400 MHz、CDCl₃）：δ 3.80～4.00（m，5H）、4.30（d，1H）、6.95（br s，1H）、7.30～7.80（m，7H）、8.35（d，1H）、9.00（d，1H）。LCMS（方法E）RT 2.25分間、[M+H]⁺ 581/583。生成物を、キラルHPLC（方法F）によって分析した：14.31分間（84.7%）、16.79分間（15.3%）。得られた化合物（900 mg）をエーテル（30 ml）に溶解させ、次に懸濁液を0℃で3日間貯蔵した。固体（200 mg）をろ過によって分離し、母液を濃縮して、より高い鏡像体過剰率で表題生成物（600 mg）を得た：HPLC（方法F）：13.94分間（91.2%）、16.51分間（8.8%）。

20

30

【1120】

同様に、2-[[4-[5-（S）-（3，5-ジクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-シクロプロピルアミドを、同様の順序にしたがって得た。

【1121】

実施例4に記載されるように、2-[[4-[5-（S）-（3，5-ジクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルフィニル]-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）アセトアミドを、2-[[4-[5-（S）-（3，5-ジクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）アセトアミドの酸化によって得た。

40

【1122】

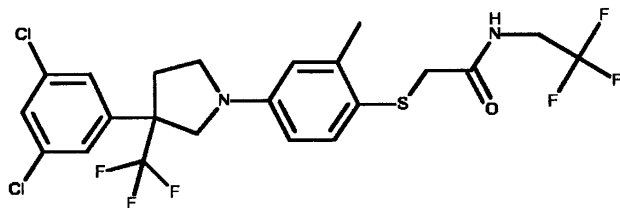
実施例5に記載されるように、2-[[4-[5-（S）-（3，5-ジクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルホニル]-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）アセトアミドを、2-[[4-[5-（S）-（3，5-ジクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1-ナフチル]スルファニル]-N-（2，2，2-トリフルオロエチル）アセトアミドの酸化によって得た。

【1123】

実施例13：2-[[4-[3-（3，5-ジクロロフェニル）-3-（トリフルオロメチ

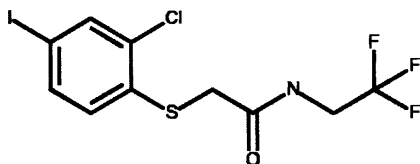
50

ル) ピロリジン-1-イル]-2-メチルフェニル] スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル) アセトアミド。化合物H1
【化132】



10

工程1: 2-(2-クロロ-4-ヨードフェニル)スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド
【化133】



20

丸底フラスコに、2-スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド(実施例14、工程3、7.69g)、炭酸セシウム(19.7g)、ジメチルホルムアミド(100ml)を充填し、次に懸濁液を室温で30分間攪拌した。ジメチルホルムアミド(50ml)中の3-クロロ-4-フルオロヨードベンゼン(7.69g)の溶液を加え、混合物を、室温で12時間、次に70℃で1時間攪拌した。混合物を、酢酸エチル(100ml)で希釈し、次に、水(5*100ml)、2Nの塩酸溶液、塩水で洗浄し、次に硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で乾固するまで除去して、粗生成物を黄色の固体(13g)として得た。残渣を、残渣のフラッシュカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/ヘプタン)によって精製して、表題生成物を黄色の固体(900mg)として得た。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): δ 3.70(s, 2H)、4.40(m, 2H)、6.90(d, 2H)、6.95(br s, 1H)、7.48(d, 2H)、7.76(d, 2H)。LCMS(方法E)RT 1.03分間、[M+H]⁺ 408/410。

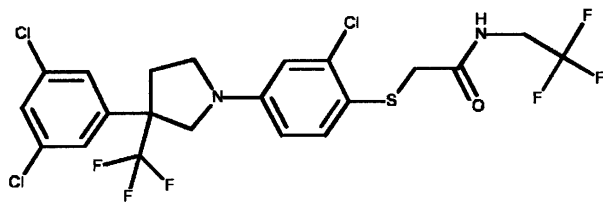
30

【1124】

40

工程2: 2-[4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)ピロリジン-1-イル]-2-メチルフェニル]スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド。化合物H1

【化 1 3 4】



10

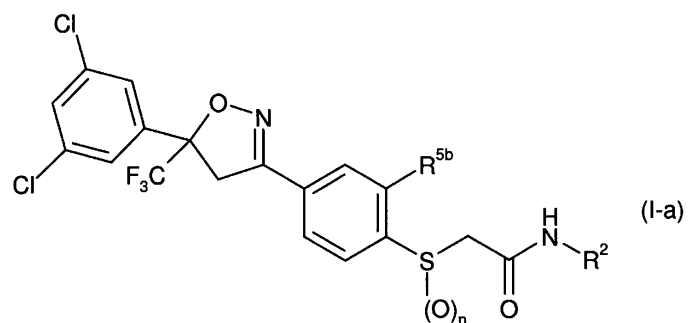
トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウムクロロホルム錯体（43 mg）、キサントホス（73 mg）、ナトリウム *tert*-ブトキシド（206 mg）を、アルゴン雰囲気下で、トルエン（8 ml）中の 2-（2-クロロ-4-ヨードフェニル）スルファニル-N-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アセトアミド（868 mg）および 4-〔3-（3, 5-ジクロロフェニル）-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル〕-2-メチル安息香酸（568 mg、特開 2008110971 号公報に記載される調製）の脱気した溶液に加えた。混合物を、130℃で30分間にわたってマイクロ波で加熱した。混合物を、酢酸エチル（20 ml）で希釈してから、水、次に塩水で2回洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー（ヘプタン/EtOAc）によって精製して、表題生成物を黄色の固体（50 mg）として得た。¹H NMR（400 MHz、CDCl₃）：δ 2.55（m, 1H）、2.90（m, 1H）、3.50～4.10（m, 8H）、6.45（m, 1H）、6.70（s, 1H）、7.19（br t, 1H）、7.35（d, 1H）、7.40（s, 1H）。LCMS（方法E）RT 2.20分間、[M+H]⁺ 563/565。

20

【1125】

【表 7 7】

表 A: 式(I-A)の化合物:



化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル[M+H] ⁺
A1	0	Cl	エチル-	C	2.05	511.18
A2	0	Cl	ブチル-	C	2.19	539.21
A3	0	Cl	1-メトキシ-プロパ-2-イル-	C	2.09	555.21
A4	0	Cl	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)- アセトアミド-2-イル	C	1.99	622.19
A5	0	Cl	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	B	2.27	606/608 (M+CH ₃ CN)
A6	0	Cl	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-	C	2.19	539.23
A7	0	Cl	ブタ-2-イル-	C	2.07	567.2
A8	0	Cl	(テトラヒドロフラン-2-イル)- メチル-	C	2.18	573.21
A9	0	Cl	フェニル-メチル-	C	2.2	591.2
A10	0	Cl	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-	C	2.13	579.19
A11	0	Cl	1-フェニル-エタ-1-イル-	C	2.24	587.21
A12	0	Cl	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-	C	2.17	603.23
A13	0	Cl	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-	C	1.94	587.15
A14	0	Cl	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)- メチル-	C	2.1	608.16
A15	0	Cl	3-フルオロ-フェニル-	C	2.25	577.1

【表 7 8】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル[M+H] ⁺
A16	0	Cl	(ピリダ-2-イル)-メチル-	C	1.94	574.2
A17	0	Cl	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール- 5-イル-	C	2.02	577.21
A18	0	Cl	4-メチル-チアゾール-2-イル-	C	2.01	579.63
A19	0	Cl	3-メチル-チエタン-3-イル-	C	2.19	569.22
A20	0	Cl	1,1-ジメチル-2-メチルスルファ ニル-エチル	C	2.28	585.21
A21	0	Cl	1-オキソ-チエタン-3-イル-	C	1.86	571.15
A22	0	Cl	チエタン-3-イル-	C	2.11	555.22
A23	0	Cl	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-	C	2.3	577.22
A24	0	Cl	シクロブチル-	C	2.16	537.24
A25	0	Br	エチル-	C	2.07	555.14
A26	0	Br	ブチル-	C	2.21	583.17
A27	0	Br	1-メトキシ-プロパ-2-イル-	C	2.11	599.18
A28	0	Br	N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)- アセトアミド-2-イル	C	2.01	666.17
A29	0	Br	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.27	609/611
A30	0	Br	3,3,3-トリフルオロ-プロピル-	C	2.15	623.14
A31	0	Br	ブタ-2-イル-	C	2.2	583.16
A32	0	Br	(テトラヒドロフラン-2-イル)- メチル-	C	2.09	611.15
A33	0	Br	フェニル-メチル-	C	2.2	617.13
A34	0	Br	(2-フルオロ-フェニル)-メチル-	C	2.21	635.21

【 1 1 2 7 】

【表 7 9】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル[M+H] ⁺
A35	0	Br	1-フェニル-エタ-1-イル-	C	2.26	631.16
A36	0	Br	(4-メトキシ-フェニル)-メチル-	C	2.19	647.18
A37	0	Br	1,1-ジオキソ-チエタン-3-イル-	C	1.96	631.05
A38	0	Br	(2-クロロ-ピリダ-5-イル)- メチル-	C	2.12	652.15
A39	0	Br	3-フルオロ-フェニル-	C	2.26	621.06
A40	0	Br	(ピリダ-2-イル)-メチル-	C	1.95	618.17
A41	0	Br	1,3-ジメチル-1H-ピラゾール- 5-イル-	C	2.04	621.16
A42	0	Br	4-メチル-チアゾール-2-イル-	C	2.19	624.15
A43	0	Br	3-メチル-チエタン-3-イル-	C	2.21	612.43
A44	0	Br	1,1-ジメチル-2-メチルスルファ ニル-エチル	C	2.29	629.17
A45	0	Br	1-オキソ-チエタン-3-イル-	C	1.88	615.09
A46	0	Br	チエタン-3-イル-	C	2.13	599.12
A47	0	Br	ビスクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル-	C	2.32	621.23
A48	0	Br	シクロブチル-	C	2.17	581.15
A49	0	CH ₃	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.16	545/547
A50	1	CH ₃	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	B	1.98	561/563
A51	2	CH ₃	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.16	577/579
A52	1	Br	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.29	627/629
A53	2	Br	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.16	641/643

10

20

30

【 1 1 2 8 】

【表 80】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル[M+H] ⁺
A54	1	Cl	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.05	581/583
A55	2	Cl	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	A	2.06	598/600
A57	0	NO2	2,2,2-トリフルオロ-エチル-	E	1.18	577.3
A58	0	Cl	2-エトキシ-2-オキソ-エチル	A	2.16	569/572
A59	0	Br	H	A	2.04	570/572
A62	0	Br	メチルスルホニル-	A	2.28	605/607
A63	0	Br	(1-メチル-2-フェニル-エチル)-	C	2.36	645.2
A64	0	Br	2-シアノエチル-	C	2.02	580.1
A65	0	Br	1,1,3,3-テトラメチルブチル-	C	2.52	639.2
A66	0	Br	シクロヘキシルメチル-	C	2.40	623.1
A67	0	Br	(2-オキソピロリジン-1-イル) メチル-	C	1.97	624.2
A68	0	Br	[(1S,2S)-1-(ヒドロキシメチル)- 2-メチル-ブチル]-	C	2.13	627.2
A69	0	Br	メチル-	C	2.02	541.2
A70	0	Br	1,2-ジメチルプロピル-	C	2.30	597.3
A71	0	Br	1,1-ジメチルプロパ-2-イニル-	C	2.20	593.3
A72	0	Br	2-メチルブチル-	C	2.30	597.3
A73	0	Br	シクロプロピル-	C	2.10	567.2
A74	0	Br	2-クロロアリル-	C	2.19	601.2
A75	0	Br	1-シアノエチル-	C	2.07	580.2
A76	0	Br	2-メチルアリル-	C	2.19	581.2
A77	0	Br	1-シアノ-1-メチルエチル-	C	2.11	594.3
A78	0	Br	2-フルオロエチル-	C	2.06	573.2
A79	0	Br	シアノメチル-	C	2.02	566.2

10

20

30

【1129】

【表 8 1】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル[M+H] ⁺
A80	0	Br	[(2E)-2-メトキシイミノ-1,1-ジメチル-エチル]-	C	2.25	626.3
A81	0	Br	(E)-3-クロロアリル-	C	2.18	601.2
A82	0	Br	ブタ-2-イニル-	C	2.14	579.3
A83	0	Br	2-フルオロ-1-メチルエチル-	C	2.12	587.2
A84	0	Br	2-フルオロプロピル-	C	2.12	587.3
A85	0	Br	n-プロピル-	C	2.17	569.2
A86	0	Br	イソプロピル-	C	2.17	569.3
A87	0	Br	イソブチル-	C	2.24	583.3
A88	0	Br	プロパルギル-	C	2.07	565.2
A89	0	Br	2,2-ジフルオロエチル-	C	2.10	591.2
A90	0	Br	アリル-	C	2.13	567.2
A91	0	Br	シクロプロピルメチル-	C	2.18	581.2

【1130】

化合物 A 5 6、A 6 0 および A 6 1 についての実験の詳細：

A 5 6：2- [2-クロロ-4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルフィニル-N- (1-シアノシクロプロピル) アセトアミド (ジアステレオ異性体の混合物)

¹H NMR (クロロホルム-d、400 MHz)：δ = 7.86 ~ 7.94 (m, 2 H)、7.76 (ddd, J = 9.9、8.3、1.7 Hz、1 H)、7.48 ~ 7.52 (m, 2 H)、7.44 ~ 7.45 (m, 1 H)、7.34 (m, 1 H)、4.07 (d, J = 17.2 Hz、1 H)、3.67 ~ 3.87 (m, 3 H)、1.47 ~ 1.60 (m, 2 H)、1.12 ~ 1.28 ppm (m, 2 H)

【1131】

A 6 0：2- [2-クロロ-4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルファニル-N- (1-シアノシクロプロピル) アセトアミド

¹H NMR (クロロホルム-d、400 MHz)：δ = 7.77 (d, J = 1.5 Hz、1 H)、7.40 ~ 7.53 (m, 4 H)、7.21 (d, J = 8.4 Hz、1 H)、7.08 (s, 1 H)、4.04 (d, J = 16.9 Hz、1 H)、3.71 (s, 2 H)、3.66 (d, J = 17.2 Hz、1 H)、1.52 ~ 1.58 (m, 2 H)、1.10 ~ 1.22 ppm (m, 2 H)

【1132】

A 6 1：2- [2-クロロ-4- [5- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (トリフルオロメチル) -4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルホニル-N- (1-シアノシクロプロピル) アセトアミド

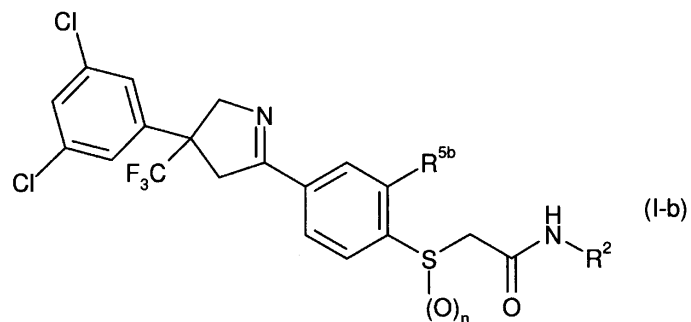
¹H NMR (クロロホルム-d、400 MHz)：δ = 8.14 (d, J = 8.1 Hz、1 H)、7.95 (d, J = 1.5 Hz、1 H)、7.74 (dd, J = 8.3、1.7 Hz、1 H)、7.49 ~ 7.53 (m, 2 H)、7.42 ~ 7.49 (m, 1 H)、7.00 (s, 1 H)、4.32 (s, 2 H)、4.08 (d, J = 17.2 Hz、1 H)、3.71 (d, J = 17.2 Hz、1 H)、1.54 ~ 1.57 (m, 2 H)、1

. 2 3 ~ 1 . 2 9 (m, 2 H)

【 1 1 3 3 】

【表 8 2】

表 B: 式(I-b)の化合物:

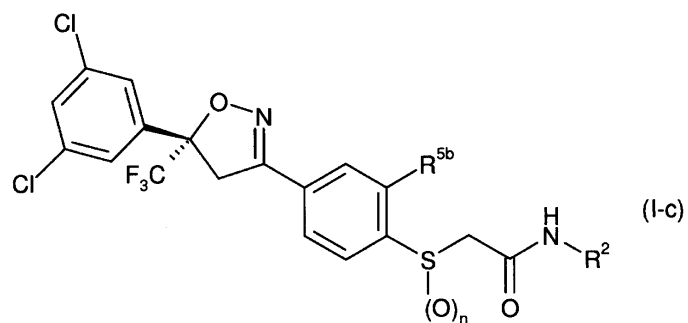


化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分)	質量スペクトル
B1	0	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2.12	563/565
B2	1	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2	579/581
B3	2	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2.01	595/597

【 1 1 3 4 】

【表 8 3】

表 C: 式(I-c)の化合物:



化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C1	0	CH ₃	CH ₂ CF ₃	B	2.14 分: 545/547	5.99 分 (95.5%)
C2	1	CH ₃	CH ₂ CF ₃	B	1.99 分: 561/563	
C3	2	CH ₃	CH ₂ CF ₃	B	2.05 分	
C4	0	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2.17 分: 565/567	5.23 分 (100%)
C5	1	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2.05 分: 581/583	10.11 分 (47.65%), 11.68 (51.43%)
C6	2	Cl	CH ₂ CF ₃	A	2.08 分: 597/599	5.27 分 (97.91%)

【 1 1 3 5 】

【表 8 4】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C7	0	Br	シクロプロピル-	E	1.19 分: 567/569/571	
C9	0	Cl	2-フルオロフェニル-	C	2.25 分: 577.33	
C10	0	Cl	4-フルオロフェニル-	C	2.22 分: 577.33	
C11	0	Cl	アリル	C	2.08 分: 523.32	
C12	0	Cl	2-クロロフェニル-	C	2.34 分: 593.4	
C13	0	Cl	2-エトキシ-2-オキソ- エチル-	C	2.07 分: 569.36	
C14	0	Cl	2-メトキシエチル-	C	2.02 分: 541.32	
C15	0	Cl	2-メチルスルファニルエ チル-	C	2.1 分: 557.36	
C16	0	Cl	4-メチル-2-ピリジル-	C	2.17 分: 574.35	
C17	0	Cl	2,5-ジフルオロフェニル-	C	2.28 分: 595.31	
C18	0	Cl	o-トリルメチル-	C	2.24 分: 587.35	
C19	0	Cl	2-(3,4-ジメトキシフェニ ル)エチル-	C	2.15 分: 647.38	
C20	0	Cl	p-トリルメチル-	C	2.25 分: 587.36	
C21	0	Cl	3,3-ジクロロアリル-	C	2.22 分: 591.24	
C22	0	Cl	3,4-ジクロロフェニル-	C	2.4 分: 626.94	
C23	0	Cl	6-メチル-3-ニトロフェニ ル-	C	2.24 分: 618.47	
C24	0	Cl	3,5-ジクロロフェニル-	C	2.44 分: 626.72	

【 1 1 3 6 】

【表 8 5】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C25	0	Cl	4-プロモフェニル-	C	2.33 分: 637.51	
C26	0	Cl	2,6-ジイソプロピルフェニル-	C	2.43 分: 643.4	
C27	0	Cl	2-エトキシ-1-エトキシカルボニル-2-オキソ-エチル-	C	2.19 分: 641.35	
C28	0	Cl	3-プロモフェニル-	C	2.34 分: 637.68	
C29	0	Cl	2,4-ジメチルフェニル-	C	2.31 分: 587.29	
C30	0	Cl	2,5-ジメチルフェニル-	C	2.32 分: 587.35	
C31	0	Cl	1,1-ジメチルプロピル-	C	2.3 分: 553.43	
C32	0	Cl	2-エチルフェニル-	C	2.3 分: 587.36	
C33	0	Cl	シクロプロピルメチル-	C	2.13 分: 537.33	
C34	0	Cl	4-エチルフェニル-	C	2.34 分: 587.32	
C35	0	Cl	2-プロモフェニル-	C	2.36 分: 637.21	
C36	0	Cl	2,4-ジクロロフェニル-	C	2.44 分: 627.12	
C37	0	Cl	3-クロロフェニル-	C	2.32 分: 593.39	
C38	0	Cl	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル-	C	2.35 分: 643.25	
C39	0	Cl	2-プロモ-4-フルオロフェニル-	C	2.35 分: 655.33	
C40	0	Cl	2,3-ジクロロフェニル-	C	2.43 分: 627.01	

【 1 1 3 7 】

【表 8 6】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C41	0	Cl	m-トリルメチル-	C	2.25 分: 586.6	
C42	0	Cl	3,5-ジメチルフェニル-	C	2.35 分: 587.4	
C43	0	Cl	p-トリル-	C	2.28 分: 573.37	
C44	0	Cl	プロパルギル-	C	2.03 分: 521.3	
C45	0	Cl	3-ニトロフェニル-	C	2.22 分: 603.57	
C46	0	Cl	2,6-ジエチル-4-メチル フェニル-	C	2.41 分: 629.39	
C47	0	Cl	4H-1,2,4-トリアゾール- 3-イル-	C	1.86 分: 550.11	
C48	0	Cl	5-メチルチアゾール-2- イル-	C	2.17 分: 580.3	
C49	0	Cl	5-メチル-2-ピリジル-	C	2.2 分: 574.4	
C50	0	Cl	2-ヒドロキシフェニル-	C	2.12 分: 575.32	
C51	0	Cl	o-トリル-	C	2.25 分: 573.36	
C52	0	Cl	3-ピリジル-	C	1.91 分: 560.32	
C53	0	Cl	2,2-ジフルオロエチル-	C	2.06 分: 546.67	
C54	0	Cl	イソブチル-	C	2.19 分: 539.34	
C55	0	Cl	2,4-ジフルオロフェニル-	C	2.24 分: 595.3	
C56	0	Cl	2-メチル-3-ピリジル-	C	2.2 分: 594.49	
C57	0	Cl	2-フリルメチル-	C	2.11 分: 563.33	
C58	0	Cl	シクロプロピル-	C	2.05 分: 523.32	

【 1 1 3 8 】

【表 8 7】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C59	0	Cl	イソプロピル-	C	2.12 分: 525.32	
C60	0	Cl	n-ブチル-	C	2.12 分: 525.1	
C61	0	Cl	フェニル-	C	2.22 分: 559.33	
C62	0	Cl	tert-ブチル-	C	2.24 分: 539.34	
C65	2	Cl	プロパルギル-	A	2.04 分: 555/557	
C66	0	Cl	2-メチルブチル-	C	2.29 分: 553.32	
C68	0	Cl	2-クロロアリル-	C	2.17 分: 557.14	
C69	0	Cl	1-シアノエチル-	C	2.05 分: 536.32	
C70	0	Cl	2-メチルアリル-	C	2.17 分: 537.31	
C71	0	Cl	1-シアノ-1-メチルエチル-	C	2.09 分: 550.28	
C72	0	Cl	2-フルオロエチル-	C	2.04 分: 529.29	
C73	0	Cl	シアノメチル-	C	2 分: 522.25	
C74	0	Cl	[(2E)-2-メトキシイミノ- 1,1-ジメチル-エチル]-	C	2.24 分: 582.33	
C75	0	Cl	(E)-3-クロロアリル-	C	2.16 分: 557.28	
C76	0	Cl	ブタ-2-イニル-	C	2.12 分: 535.26	
C77	0	Cl	2-フルオロ-1-メチルエチ ル-	C	2.11 分: 543.29	
C78	0	Cl	2-フルオロプロピル-	C	2.1 分: 543.28	

【 1 1 3 9 】

【表 8 8】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C79	0	Me	メチル-	C	1.96 分: 477.33	
C80	0	Me	1,2-ジメチルプロピル-	C	2.25 分: 533.35	
C81	0	Me	1,1-ジメチルプロパ-2- イニル-	C	2.15 分: 529.35	
C82	0	Me	2-メチルブチル-	C	2.25 分: 533.39	
C83	0	Me	シクロプロピル-	C	2.04 分: 503.33	
C84	0	Me	2-クロロアリル-	C	2.14 分: 537.32	
C85	0	Me	1-シアノエチル-	C	2.01 分: 515.71	
C86	0	Me	2-メチルアリル-	C	2.14 分: 517.35	
C87	0	Me	1-シアノ-1-メチルエチル-	C	2.05 分: 530.34	
C88	0	Me	2-フルオロエチル-	C	2 分: 509.39	
C89	0	Me	シアノメチル-	C	1.96 分: 502.33	
C90	0	Me	イソプロピル-	C	2.11 分: 505.35	
C91	0	Me	イソブチル-	C	2.18 分: 519.37	
C92	0	Me	プロパルギル-	C	2.02 分: 501.28	
C93	0	Me	2,2-ジフルオロエチル-	C	2.05 分: 527.29	
C94	0	Me	アリル-	C	2.07 分: 503.35	
C95	0	Me	シクロプロピルメチル-	C	2.12 分: 517.36	
C96	0	Cl	メチル-	C	2 分: 497.24	

【 1 1 4 0 】

【表 8 9】

化合物 番号	n	R ^{5b}	R ²	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	キラル HPLC (方法 D)
C97	0	Cl	1,2-ジメチルプロピル-	C	2.28 分: 553.33	
C98	0	Cl	1,1-ジメチルプロパ-2- イニル-	C	2.18 分: 549.23	
C99	0	Me	[(2E)-2-メトキシミノ- 1,1-ジメチル-エチル]-	C	2.21 分: 562.39	
C100	0	Me	(E)-3-クロロアリル-	C	2.13 分: 537.41	
C101	0	Me	ブタ-2-イニル-	C	2.08 分: 515.29	
C102	0	Me	2-フルオロ-1-メチルエチ ル-	C	2.07 分: 523.35	
C103	0	Me	2-フルオロプロピル-	C	2.07 分: 523.35	
C104	0	Me	プロピル-	C	2.11 分: 505.35	

【1141】

化合物 C 6 3 および C 6 4 についての実験の詳細：

C 6 3：2- [4- [(5S)-5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-フルオロフェニル] スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル) アセトアミド：

¹H NMR (クロロホルム-d, 00 MHz) : δ = 7.50 (d, J = 1.5 Hz, 2H)、7.42~7.48 (m, 2H)、7.31~7.37 (m, 2H)、6.94 (m, 1H)、4.04 (d, J = 17.2 Hz, 1H)、3.91 (qd, J = 8.9、6.6 Hz, 2H)、3.73 (s, 2H)、3.60~3.69 ppm (m, 1H)

【1142】

C 6 4：2- [4- [(5S)-5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-フルオロフェニル] スルフィニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル) アセトアミド (ジアステレオ異性体の混合物)：

¹H NMR (クロロホルム-d, 400 MHz) : δ = 7.74~7.85 (m, 1H)、7.62 (m, 1H)、7.55 (m, 1H)、7.50 (s, 2H)、7.46~7.48 (m, 1H)、7.17 (m, 1H)、3.86~4.14 (m, 3H)、3.55~3.76 ppm (m, 3H)

【1143】

化合物 D についての実験の詳細：

D 1：2- [2-クロロ-4- [(5S)-5-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルファニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル) アセトアミド：

¹H NMR (クロロホルム-d, 400 MHz) : δ = 7.72 (d, J = 1.8 Hz, 1H)、7.64 (s, 2H)、7.50 (dd, J = 8.4、1.8 Hz, 1H)、7.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H)、6.86~6.97 (m, 1H)、4.05 (d, J = 17.2 Hz, 1H)、3.90 (m, 2H)、3.78 (s, 2H)、3.65 ppm (d, J = 17.2 Hz, 1H)

【1144】

D 2：2- [2-クロロ-4- [(5S)-5-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-

5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルフィニル-N-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アセトアミド（ジアステレオ異性体の混合物）：

^1H NMR（クロロホルム-d、400MHz）： δ =7.88（d, J=8.1Hz、1H）、7.72~7.81（m, 2H）、7.64（s, 2H）、7.09~7.23（m, 1H）、3.91~4.19（m, 3H）、3.81（d, J=14.7Hz、1H）、3.58~3.76ppm（m, 2H）

【1145】

D3：2-〔2-クロロ-4-〔（5S）-5-（3, 4, 5-トリクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルホニル-N-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）アセトアミド

10

^1H NMR（クロロホルム-d、400MHz）： δ =8.13（d, J=8.1Hz、1H）、7.90（d, J=1.5Hz、1H）、7.74（dd, J=8.3、1.7Hz、1H）、7.63（s, 2H）、6.79（m, 1H）、4.40（s, 2H）、4.04~4.13（m, 1H）、3.89（qd, J=8.9、6.4Hz、2H）、3.70ppm（d, J=17.2Hz、1H）

【1146】

D4：2-〔2-クロロ-4-〔（5S）-5-（3, 4, 5-トリクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルファニル-N-シクロプロピル-アセトアミド

20

^1H NMR（クロロホルム-d、400MHz）： δ =7.71（d, J=1.8Hz、1H）、7.64（s, 2H）、7.49（dd, J=8.4、1.8Hz、1H）、7.21（d, J=8.4Hz、1H）、6.65~6.66（m, 1H）、4.05（d, J=17.2Hz、1H）、3.63~3.67（m, 3H）、2.68（m, 1H）、0.75~0.78（m, 2H）、0.41~0.43ppm（m, 2H）

【1147】

D5：2-〔2-クロロ-4-〔（5S）-5-（3, 4, 5-トリクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルフィニル-N-シクロプロピル-アセトアミド（ジアステレオ異性体の混合物）：

^1H NMR（クロロホルム-d、400MHz）： δ =7.86（d, J=8.1Hz、1H）、7.80（dt, J=8.2、1.6Hz、1H）、7.74（t, J=1.5Hz、1H）、7.64（s, 2H）、6.73（m, 1H）、4.09（d, J=17.2Hz、1H）、3.82（d, J=14.3Hz、1H）、3.61~3.74（m, 2H）、2.62（m, 1H）、0.74~0.79（m, 2H）、0.41~0.60ppm（m, 2H）

30

【1148】

D6：2-〔2-クロロ-4-〔（5S）-5-（3, 4, 5-トリクロロフェニル）-5-（トリフルオロメチル）-4H-イソオキサゾール-3-イル] フェニル] スルホニル-N-シクロプロピル-アセトアミド

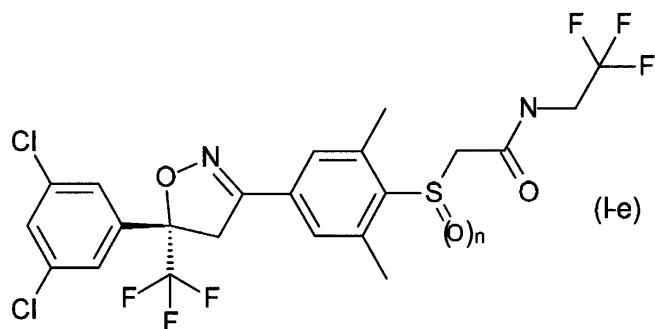
^1H NMR（クロロホルム-d、400MHz）： δ =8.11（d, J=8.4Hz、1H）、7.87（d, J=1.5Hz、1H）、7.75（dd, J=8.3、1.7Hz、1H）、7.63（s, 2H）、6.45（m, 1H）、4.26（s, 2H）、4.06~4.11（m, 1H）、3.70（d, J=17.2Hz、1H）、2.63~2.66（m, 1H）、0.71~0.82（m, 2H）、0.39~0.54ppm（m, 2H）

40

【1149】

【表 9 0】

表 E: 式(I-e)の化合物:

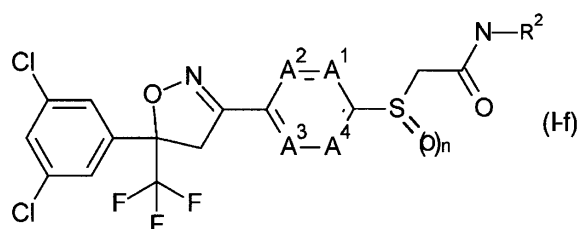


化合物 番号	n	LCMS 法	RT(分): 質量スペクトル	MW	キラル HPLC (方法 D)
E1	0	A	2.22	559/561	
E2	1	A	2.09	575/577	
E3	2	A	2.17	591/592	

【 1 1 5 0】

【表 9 1】

表 F: 式(I-f)の化合物:



化合物 番号	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	R ²	n	LCMS 法	RT(分):	質量
F1	CCH3	CH	CH	N	シクロプロピル-	0	G	17.18	502[M-H]-
F2	CCH3	CH	N	CH	シクロプロピル-	0	G	17.02	504[M+H]+

10

20

30

40

50

【1151】

生物学的実施例

これらの実施例は、式（I）の化合物の殺有害生物／殺虫特性を説明するものである。
試験を以下のとおりに行った：

【1152】

スポドプテラ・リトラリス（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）：

ワタの葉片を、24ウェルマイクロタイタープレートにおいて寒天上に配置し、200 ppmの施用量で試験溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5 L1の幼虫を寄生させた。処理（DAT）の3日後の死亡率、摂食行動、および成長調節について試料を調べた。以下の化合物により、スポドプテラ・リトラリス（*Spodoptera littoralis*）の少なくとも80%の防除が得られた：A1、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A19、A2、A21、A22、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A4、A40、A42、A43、A45、A46、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A6、A60、A61、A62、A63、A64、A67、A69、A7、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A8、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A9、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C10、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C12、C13、C14、C14、C15、C16、C17、C18、C19、C2、C20、C21、C3、C33、C4、C44、C5、C53、C54、C55、C56、C57、C58、C59、C6、C60、C62、C63、C64、C65、C66、C68、C69、C7、C70、C72、C73、C74、C75、C76、C77、C78、C79、C80、C81、C82、C83、C84、C86、C87、C88、C89、C9、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C97、C98、C99、D1、D2、D3、D4、E1、E2、E3、F1、F2、G1、G2、G3、G4、H1

【1153】

ヘリオチス・ビレセンス（*Heliothis virescens*）（オオタバコガ）：

卵（0～24時齢）を、24ウェルマイクロタイタープレートにおいて人工飼料上に配置し、ピペッティングによって、200 ppmの施用量（ウェル中の濃度は18 ppm）で、試験溶液で処理した。4日間のインキュベーション期間の後、卵死亡率、幼虫死亡率、および成長調節について試料を調べた。以下の化合物により、ヘリオチス・ビレセンス（*Heliothis virescens*）の少なくとも80%の防除が得られた：A1、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A19、A2、A21、A22、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A4、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A6、A60、A61、A63、A64、A66、A67、A68、A69、A7、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A8、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A9、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C10、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C12、C13、C14、C14、C15、C16、C17、C19、C2、C20、C21、C23、C26、C28、C3、C32、C33、C35、C36、C37、C39、C40、C42、C43、C44、C45、C46、C47、C48、C49、C5、C51、C52、C53、C54、C55、C56、C57、C58、C59、C6、C60、C62、C63、C64、C

65、C66、C68、C69、C7、C70、C71、C72、C73、C74、C75、C76、C77、C78、C79、C80、C81、C82、C83、C84、C85、C86、C87、C88、C89、C9、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C97、C98、C99、D1、D2、D3、D4、E1、E2、E3、F1、F2、G1、G2、G3、G4、H1

【1154】

プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (コナガ) :

人工飼料を入れた24ウェルマイクロタイタープレート (MTP) を、ピペッティングによって、200 ppmの施用量 (ウェル中の濃度は18 ppm) で、試験溶液で処理した。乾燥させた後、MTPにL2の幼虫 (ウェル当たり7~12匹) を寄生させた。6日間のインキュベーション期間の後、幼虫死亡率および成長調節について試料を調べた。以下の化合物により、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) の少なくとも80%の防除が得られた: A1、A10、A12、A13、A14、A16、A17、A19、A2、A21、A22、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A4、A40、A41、A42、A45、A46、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A6、A60、A61、A63、A64、A67、A69、A7、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A78、A79、A8、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A9、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C13、C14、C14、C15、C2、C3、C33、C4、C44、C47、C5、C53、C54、C56、C58、C59、C6、C60、C62、C63、C64、C65、C66、C68、C69、C7、C70、C71、C72、C73、C74、C75、C76、C77、C78、C79、C80、C81、C82、C83、C84、C85、C86、C87、C88、C89、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C98、C99、D1、D2、D3、D4、E1、E2、E3、F1、F2、G1、G2、G3、G4、H1

【1155】

ディアブロティカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) (トウモロコシハムシ) :

人工飼料を入れた24ウェルマイクロタイタープレート (MTP) を、ピペッティングによって、200 ppmの施用量 (ウェル中の濃度は18 ppm) で、試験溶液で処理した。乾燥させた後、MTPにL2の幼虫 (ウェル当たり6~10匹) を寄生させた。5日間のインキュベーション期間の後、幼虫死亡率および成長調節について試料を調べた。以下の化合物により、ディアブロティカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) の少なくとも80%の防除が得られた: A1、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A19、A2、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A4、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A6、A60、A61、A63、A64、A66、A69、A7、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A8、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A9、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C10、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C12、C13、C14、C14、C15、C16、C17、C18、C19、C2、C20、C21、C25、C27、C28、C29、C3、C30、C31、C32、C33、C35、C4、C40、C41、C43、C44、C47、C48、C49、C5、C50、C51、C52、C53、C54、C55、C56、C57、C5

8、C59、C6、C60、C61、C62、C63、C64、C65、C66、C68、
C69、C7、C70、C71、C72、C73、C75、C76、C77、C78、
C79、C80、C81、C82、C83、C84、C85、C86、C87、C88、
C89、C9、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C97、C
98、C99、D1、D2、D3、D4、E1、E2、E3、F1、F2、G1、G2、
G3、G4、H1

【1156】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)、浸透性試験 (systemic test) :

混合齢 (mixed ages) のアブラムシ個体群を寄生させたエンドウの苗の根を、12.5 ppmの施用量で試験溶液に直接入れる。導入の6日後、死亡率およびこの植物に対する特別な影響について試料を調べた。以下の化合物により、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) の少なくとも80%の防除が得られた：A1、A10、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A33、A34、A36、A38、A40、A41、A42、A45、A46、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A59、A6、A60、A64、A69、A70、A72、A73、A74、A76、A78、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A89、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C10、C100、C101、C102、C103、C104、C12、C14、C15、C17、C2、C21、C3、C33、C4、C44、C47、C5、C53、C54、C55、C58、C59、C6、C61、C62、C63、C64、C65、C66、C68、C7、C70、C76、C78、C79、C80、C82、C83、C84、C86、C88、C89、C9、C91、C92、C93、C94、C95、C97、D1、D2、D3、D4、D5、D6、F2、G1、G2、G4、H1。

【1157】

スリップス・タバシ (*Thrips tabaci*) (ネギアザミウマ) :

ヒマワリの葉片を、24ウェルマイクロタイタープレートにおいて寒天上に配置し、200 ppmの施用量で試験溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に、混合齢のアザミウマ個体群を寄生させた。7日間のインキュベーション期間の後、死亡率について試料を調べた。以下の化合物により、スリップス・タバシ (*Thrips tabaci*) の少なくとも80%の防除が得られた：A1、A10、A11、A12、A14、A16、A2、A21、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A38、A40、A44、A45、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A58、A59、A6、A60、A61、A64、A66、A69、A7、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A78、A79、A8、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C13、C14、C14、C15、C18、C2、C21、C3、C33、C4、C44、C5、C53、C58、C59、C6、C62、C63、C64、C65、C66、C68、C69、C7、C70、C72、C73、C75、C76、C77、C78、C79、C80、C81、C82、C83、C84、C85、C86、C88、C89、C9、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C97、C98、D1、D2、D3、D4、F5、G1、G2、G4、H1。

【1158】

テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ) :

24ウェルマイクロタイタープレートにおける寒天上のインゲンマメの葉片に、200 ppmの施用量で試験溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に、混合齢のダニ個体群を寄生させた。8日後、卵死亡率、幼虫死亡率、および成虫死亡率について葉片を調べた。以

10

20

30

40

50

下の化合物により、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) の少なくとも 80% の防除が得られた: A1、A10、A11、A12、A13、A14、A16、A17、A18、A2、A21、A22、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A3、A30、A31、A32、A33、A34、A36、A37、A38、A39、A4、A40、A43、A45、A46、A47、A48、A49、A5、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A59、A6、A60、A61、A62、A64、A66、A67、A69、A7、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A78、A79、A8、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A9、A90、A91、B1、B2、B3、C1、C100、C101、C102、C103、C104、C11、C12、C14、C15、C18、C2、C20、C21、C3、C33、C4、C41、C42、C44、C47、C5、C53、C54、C57、C58、C59、C6、C60、C62、C63、C64、C65、C66、C68、C69、C7、C70、C72、C73、C74、C75、C76、C77、C78、C79、C80、C81、C82、C83、C84、C86、C87、C88、C89、C90、C91、C92、C93、C94、C95、C96、C97、C98、C99、D1、D2、D3、D4、F1、G1、G2、G3、G4、H1。

10

【1159】

比較例

比較試験の表において、表に示される施用量を用いて、上述されるように試験を行った。

20

【1160】

比較試験の表1

この例では、本発明の化合物A49を、特開2007106756号公報の化合物1～020と比較する。硫黄原子上の置換基を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1161】

【表 9 2】

本発明の化合物 A49 		特開 2007106756 号の化合物 1~020 	
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A49	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~020	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A49	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~020	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A49	ディアブロティカ・バルデアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	100
特開 2007106756 号の化合物 1~020	ディアブロティカ・バルデアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	20
		3	未試験

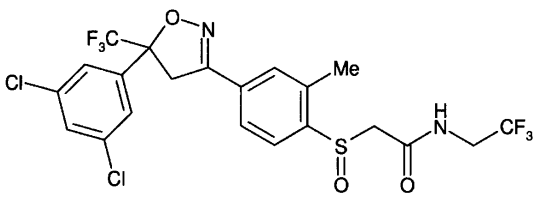
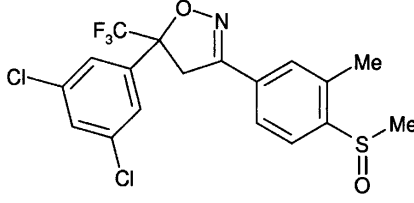
【 1 1 6 2 】

比較試験の表 2

この例では、本発明の化合物 A 5 0 を、特開 2 0 0 7 1 0 6 7 5 6 号公報の化合物 1 ～ 0 2 0 のスルホキシド類似体と比較する。硫黄原子上の置換基を除いて、構造が同一であることが分かる。

【 1 1 6 3 】

【表 9 3】

本発明の化合物 A50 		特開 2007106756 号の化合物 1~020 の スルホキシド類似体 	
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A50	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~020 のスルホキシド類似体	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A50	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~020 のスルホキシド類似体	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A50	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	75
特開 2007106756 号の化合物 1~020 のスルホキシド類似体	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	0
		3	0

【1164】

比較試験の表 3

この例では、本発明の化合物 A 5 1 を、特開 2 0 0 7 1 0 6 7 5 6 号公報の化合物 1 ~ 0 2 1 と比較する。硫黄原子上の置換基を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1165】

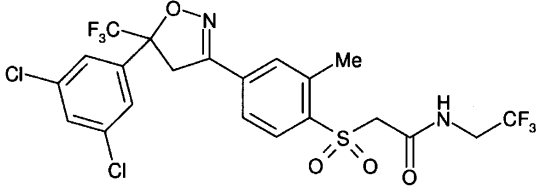
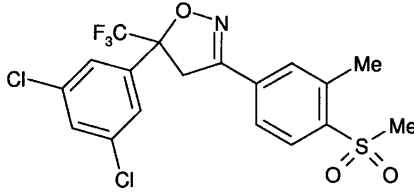
10

20

30

40

【表 9 4】

本発明の化合物 A51 		特開 2007106756 号の化合物 1~021 	
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A51	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~021	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A51	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~021	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A51	ディアブロティカ・バルデアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	100
		12	100
特開 2007106756 号の化合物 1~021	ディアブロティカ・バルデアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	90
		12	0

【1166】

比較試験の表 4

この例では、本発明の化合物 A 4 9 を、特開 2 0 0 7 1 0 6 7 5 6 号公報の化合物 1 ~ 0 2 8 と比較する。オルトメチル置換基の存在を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1167】

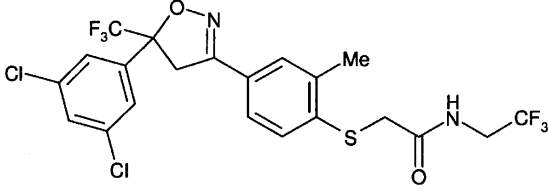
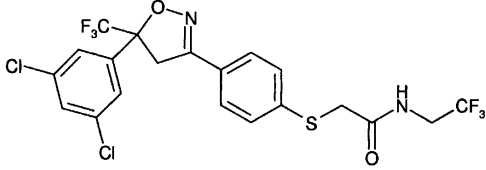
10

20

30

40

【表 9 5】

本発明の化合物 A49 		特開 2007106756 号の化合物 1~028 	
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A49	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	90
		0.8	0
本発明の化合物 A49	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	50
		0.8	0
本発明の化合物 A49	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	100
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	20

【1168】

比較試験の表 5

この例では、本発明の化合物 A50 を、特開 2007106756 号公報の化合物 1~029 と比較する。オルトメチル置換基の存在を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1169】

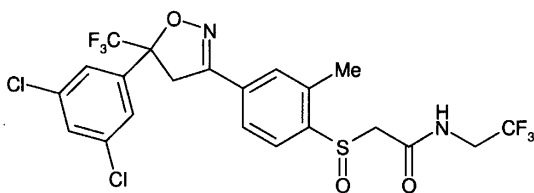
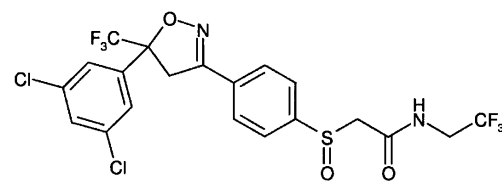
10

20

30

40

【表 9 6】

本発明の化合物 A50		特開 2007106756 号の化合物 1～029	
			
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A50	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1～029	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	0
本発明の化合物 A50	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1～029	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	80
		0.8	0
本発明の化合物 A50	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	100
		12	100
特開 2007106756 号の化合物 1～029	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	100
		12	50

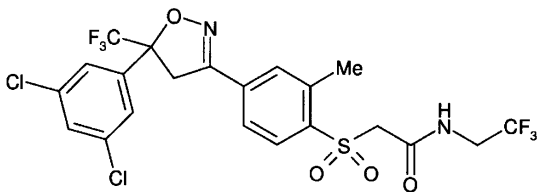
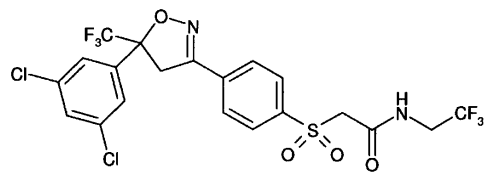
【1170】

比較試験の表 6

この例では、本発明の化合物 A51 を、特開 2007106756 号公報の化合物 1~030 と比較する。オルトメチル置換基の存在を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1171】

【表 9 7】

本発明の化合物 A51 		特開 2007106756 号の化合物 1~030 	
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 A51	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~030	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	80
		0.8	0
本発明の化合物 A51	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~030	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	0
		0.8	0
本発明の化合物 A51	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	100
		12	100
特開 2007106756 号の化合物 1~030	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	50	100
		12	50

【1172】

比較試験の表 7

この例では、本発明の化合物 C 1 を、特開 2007106756 号公報の化合物 1~028 と比較する。オルトメチル置換基の存在および立体中心の配置（反対の立体化学を有する異性体と比較して示される異性体の比率は、示される異性体が優勢で、少なくとも 85：15 であった）を除いて、構造が同一であることが分かる。

【1173】

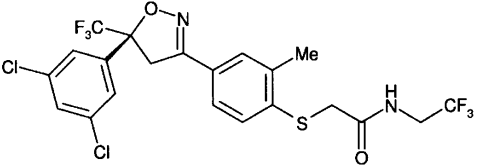
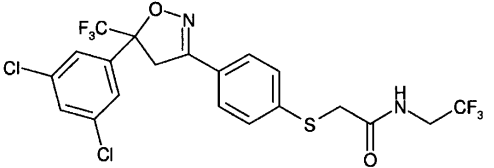
10

20

30

40

【表 9 8】

本発明の化合物 C1		特開 2007106756 号の化合物 1~028	
			
化合物	試験	施用量/ppm	防除/%
本発明の化合物 C1	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	100
		0.8	80
		0.2	80
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ヘリオチス・ビレセンス (<i>Heliothis virescens</i>) オオタバコガ	3	90
		0.8	0
		0.2	0
本発明の化合物 C1	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	100
		0.8	100
		0.2	80
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ブルテラ・キシロステラ (<i>Plutella xylostella</i>) コナガ	3	50
		0.8	0
		0.2	0
本発明の化合物 C1	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	100
		0.8	80
特開 2007106756 号の化合物 1~028	ディアブロティカ・バルテアタ (<i>Diabrotica balteata</i>) トウモロコシハムシ	12	100
		3	20
		0.8	0

【1174】

上記の結果から、本発明の化合物の殺虫活性が、少ない施用量で、構造的に最も近い先行技術の化合物より明らかに優れていることが分かる。多くの場合、同じ施用量で、特開 2007106756 号公報に記載される化合物が、防除を全く提供しない一方で、本発明の化合物は、重要な有害生物の完全なまたはほぼ完全な防除を提供する。

【1175】

この優れた性能は、大幅に少ない施用量で有害生物のより効率的な病害対策を可能にするため、重要である。試験される化合物の構造的類似性を考慮して、殺虫性のこの意外な改良は、全く予想外であり、先行技術から公知のものから導き出すことができない。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 P	33/10	(2006.01)	A 6 1 P 33/10
A 6 1 K	45/00	(2006.01)	A 6 1 K 45/00
A 0 1 N	43/80	(2006.01)	A 0 1 N 43/80 1 0 1
A 0 1 P	7/04	(2006.01)	A 0 1 P 7/04
A 0 1 P	7/02	(2006.01)	A 0 1 P 7/02

(74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信

(74)代理人 100170944
弁理士 岩澤 朋之

(74)代理人 100099759
弁理士 青木 篤

(74)代理人 100077517
弁理士 石田 敬

(74)代理人 100087871
弁理士 福本 積

(74)代理人 100087413
弁理士 古賀 哲次

(74)代理人 100117019
弁理士 渡辺 陽一

(74)代理人 100150810
弁理士 武居 良太郎

(74)代理人 100192201
弁理士 岡部 佐知子

(72)発明者 ジェローム イーブ カッサイル
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラッセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション, ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 ミリエム エルカセミ
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラッセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション, ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 トルステン ルクシュ
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラッセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション, ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 ペーター レノルト
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラッセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション, ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 国際公開第2007/125984 (WO, A1)
特表2009-519953 (JP, A)
英国特許出願公告第00281290 (GB, A)
仏国特許出願公開第00662454 (FR, A1)

国際公開第2010/018874 (WO, A1)
特表2001-506607 (JP, A)
特表2009-529038 (JP, A)
特開平04-066564 (JP, A)
国際公開第2009/063910 (WO, A1)
国際公開第2009/001942 (WO, A1)
特開2007-106756 (JP, A)
国際公開第2011/075616 (WO, A1)
国際公開第2009/035004 (WO, A1)
特表2010-523604 (JP, A)
国際公開第2008/108448 (WO, A1)
国際公開第2005/085216 (WO, A1)
国際公開第2009/005015 (WO, A1)
特表2010-500981 (JP, A)
米国特許第03296308 (US, A)
特開平05-155846 (JP, A)
特表2008-545007 (JP, A)
国際公開第2005/043238 (WO, A1)
英国特許出願公告第01082072 (GB, A)
特開平02-003670 (JP, A)

Oksengendler, G. M. et al., Thioindigoid dyes. I. Synthesis of thiophenols and S-arylthioglycolic acids, Zhurnal Obshchei Khimii, 1957年, 27, pp. 3214-3217

Acetamide, N-cyclopropyl-2-[(2,4-difluorophenyl)thio]-, REGISTRY (STN) [online], ED Entered STN: 18 Apr 2011, 検索日: 2015年12月10日, CAS登録番号1280825-31-1

Acetamide, 2-[(4-bromo-2-methylphenyl)thio]-N-cyclopropyl-, REGISTRY (STN) [online], 検索日: 2015年12月10日, Entered STN: 03 May 2005, CAS登録番号849679-23-8

Acetamide, 2-[(4-bromo-1-naphthalenyl)sulfonyl]-N-cyclopropyl-, REGISTRY (STN) [online], 検索日: 2015年12月10日, Entered STN: 13 Aug 2008, CAS登録番号1040691-34-6

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D

A61K

A01N

CAPLUS/REGISTRY (STN)