

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-530701

(P2005-530701A)

(43) 公表日 平成17年10月13日(2005. 10. 13)

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>

C07D 231/38

A01N 43/56

A01N 43/60

F I

C O 7 D 231/38

A O 1 N 43/56

A O 1 N 43/60

C S P B

D

テーマコード (参考)

4 H O 1 1

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 81 頁)

(21) 出願番号 特願2003-572962 (P2003-572962)  
 (86) (22) 出願日 平成15年2月27日 (2003. 2. 27)  
 (85) 翻訳文提出日 平成16年10月25日 (2004. 10. 25)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2003/002010  
 (87) 国際公開番号 W02003/074493  
 (87) 国際公開日 平成15年9月12日 (2003. 9. 12)  
 (31) 優先権主張番号 60/361, 328  
 (32) 優先日 平成14年3月5日 (2002. 3. 5)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)  
 (31) 優先権主張番号 02027033. 6  
 (32) 優先日 平成14年12月3日 (2002. 12. 3)  
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 502316197  
 バイエル・クロップサイエンス・ソシエテ  
 ・アノニム  
 フランス国エフー６９００９リヨン．アヴ  
 ェニューレーネカサン５５  
 (74) 代理人 100091731  
 弁理士 高木 千嘉  
 (74) 代理人 100127926  
 弁理士 結田 純次  
 (74) 代理人 100105290  
 弁理士 三輪 昭次  
 (72) 発明者 デイヴィッド・テーウエイ・チョウ  
 ドイツ連邦共和国６５８１２パートゾーデ  
 ン・ヨーゼフ・ハイドン・シュトラッセ 1  
 8

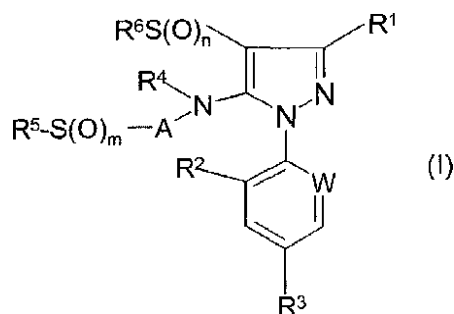
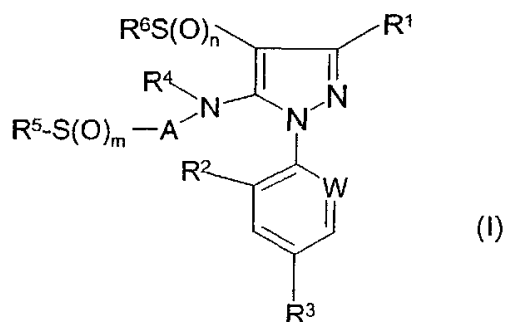
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 農薬としての５－置換アルキルアミノピラゾール誘導体

(57) 【要約】

本発明は動物の寄生虫の防除における５－置換－アルキルアミノピラゾール誘導体である式(I)

【化1】



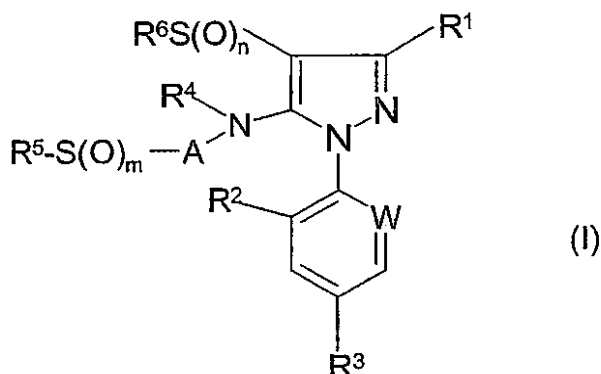
(式中、各記号は本明細書で定義された通りである) の化合物またはその塩の使用、新規な５－置換－アルキルアミノピラゾール誘導体およびその農薬組成物、並びにそれらの製造法に関する。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

殺寄生生物的に有効な量の式 (I) :

## 【化 1】



10

[式中、 $R^1$ はCNであり；

$W$ はC-ハロゲン、C- $CH_3$ またはNであり；

$R^2$ は水素、ハロゲンまたは $CH_3$ であり；

$R^3$ は $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシまたは $S(O)_p-(C_1-C_3)$ -ハロアルキルであり；

20

$R^4$ は水素、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $CO-(CH_2)_q-R^7$ 、 $COR^8$ 、 $CO-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO_2-(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $-CH_2R^7$ 、 $-CH_2R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ 、 $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-O(C=O)-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $NR^{10}COR^{12}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $SO_2NR^{10}R^{11}$ 、 $OH$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $OR^7$ 、 $NR^{10}SO_2R^8$ 、 $COR^8$ および $OR^9$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

30

$A$ は $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_8)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；あるいは $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、後者2個の基のメチレン部分は $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ および $-NR^{15}-$ から選択される基により置換されているが、但し、その置換基は隣接する $S(O)_m$ 基またはN原子と結合していないか、あるいは $(C_2-C_{12})$ -アルケニレンまたは $(C_2-C_{12})$ -ハロアルケニレンであり；

40

$R^5$ はH、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_qR^7$ 、 $-(CH_2)_qR^9$ または $NR^{10}R^{11}$ であるが、最後に挙げた基の場合、 $m$ は2であり；あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルキニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニルオキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $OH$ 、 $COR^{10}$ 、 $NR^{10}COR^{12}$ 、 $NR^{10}SO_2R^8$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $S(O)_pR^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^9$ および $CO_2R^{10}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいは $A$ が $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、そして $R^5$ が未置換、または1個またはそれ以上のハロゲン基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$ の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_m$ および $A$ の1個またはそれ以上の炭

50

素原子と一緒になって5－または6－員の環を形成し；

$R^6$ は $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、 $(C_2-C_6)$ －アルケニル、 $(C_2-C_6)$ －ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ －アルキニルまたは $(C_2-C_6)$ －ハロアルキニルであり；

$R^7$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ －アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ 、 $COR^{11}$ 、 $COR^{13}$ 、 $CONR^{10} R^1$ 、 $SO_2 NR^{10} R^{11}$ 、 $NR^{10} R^{11}$ 、OH、 $SO_3 H$ および $(C_1-C_6)$ －アルキリデンイミノからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ －アルキルまたは $(C_1-C_6)$ －ハロアルキルであり；

$R^9$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ －アルキル、 $(C_1-C_4)$ －ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ －アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ －ハロアルコキシ、 $NO_2$ 、CN、 $CO_2$ 、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $S(O)_p R^8$ 、OHおよびオキソからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{10}$ および $R^{12}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ －アルケニル、 $(C_3-C_6)$ －ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ －アルキニル、 $(C_3-C_6)$ －ハロアルキニル、 $(C_3-C_6)$ －シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ －アルキル－ $(C_3-C_6)$ －シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^{13}$ または $-(CH_2)_q R^9$ であり；あるいは

$R^{10}$ および $R^{11}$ および／または $R^{10}$ および $R^{12}$ はそれぞれ結合しているN原子と一緒になって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5－または6－員の飽和環を形成し、該環は未置換であるか、またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキルおよび $(C_1-C_6)$ －ハロアルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$ および $R^{14}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ －シクロアルキルまたは $-(C_1-C_6)$ －アルキル－ $(C_3-C_6)$ －シクロアルキルであり；

$R^{13}$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ －アルキル、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ －アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ －ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ および $NR^{11} R^{14}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{15}$ は $R^{11}$ または $-(CH_2)_q R^{13}$ であり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に3～7個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有する複素環基である]の5－置換アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農薬的に許容しうる塩を動物に投与することからなる動物の体内外の寄生虫を防除する方法。

## 【請求項2】

式(I)において、

$R^1$ はCNであり；

WはC－Clであり；

$R^2$ は塩素であり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は水素、 $CO_2$ － $(C_1-C_3)$ －アルキル、または未置換またはハロゲンおよび $(C_1-C_3)$ －アルコキシからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ －アルキルであり；

Aは $(C_1-C_4)$ －アルキレンであり；

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ －シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、 $(C_1-C_6)$ －アルキルまたは $(C_1-C_6)$ －ハロアルキルであり；あるいは $R^5$ が $(C_1-C_6)$ －アルキルである場合、 $R^5$ 基の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_p$ 基およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒になって5－または6－員の環を形成し；

$R^6$ は $CF_3$ 、 $CF_2 Cl$ 、 $CFCl_2$ 、 $CBrF_2$ または $CHF_2$ であり；

$R^7$ はフェニルであり；

10

20

30

40

50

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である、

請求項1記載の方法。

【請求項3】

式(I)において、

$R^1$ はCNであり；

WはC-Clであり；

$R^2$ はClであり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は水素、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $COR^9$ （ここで $R^9$ はテトラヒドロフリルである）、 $-COCH_2-(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $-CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^7$ 、 $OR^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ （ここで $R^9$ はピリジルである）であり；あるいは未置換または $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキルおよび $S(0)_p R^8$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

Aは $(C_1-C_6)$ -アルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ または $NR^{10} R^{11}$ であるが、最後に挙げた基の場合、Xは $SO_2$ であり；あるいは $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^6$ は $CF_3$ 、 $CF_2Cl$ 、 $CFCl_2$ 、 $CBrF_2$ 、 $CHF_2$ または $CH_3$ であり；

$R^7$ は未置換、または1個またはそれ以上の $(C_1-C_6)$ -アルコキシ基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

$R^{10}$ および $R^{11}$ は同一または異なって $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいは

$R^{10}$ および $R^{11}$ は結合しているN原子と一緒にあって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5-または6-員の飽和環を形成し；

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である、

請求項1記載の方法。

【請求項4】

式(I)において、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンまたはC- $CH_3$ であり；

$R^2$ は水素、ハロゲンまたは $CH_3$ であり；

$R^3$ は $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシまたは $S(0)_p-(C_1-C_3)$ -ハロアルキルであり；

$R^4$ は $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $CO-(CH_2)_q-R^7$ 、 $CO_2 R^8$ 、 $CO-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^7$ 、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO_2-(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $CONR^{10} R^{11}$ 、 $-CH_2 R^7$ 、 $-CH_2 R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ であり；あるいはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(0)_p R^8$ 、 $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-O(C=O)-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $NR^{10} COR^{12}$ 、 $NR^{10} R^{11}$ 、 $CONR^{10} R^{11}$ 、 $S O_2 NR^{10} R^{11}$ 、OH、CN、 $NO_2$ 、 $OR^7$ 、 $NR^{10} SO_2 R^8$ 、 $COR^8$ および $OR^9$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

Aは $(C_1-C_{12})$ -アルキレンおよび $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_8)$ -シクロ

アルキル環の一部を形成し；あるいは $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、後者2個の基のメチレン部分は $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ および $-NR^{15}-$ から選択される基により置換されるが、但し、その置換基は隣接する $S(O)_m$ 基またはN原子と結合していないか、あるいは $(C_2-C_{12})$ -アルケニレンまたは $(C_2-C_{12})$ -ハロアルケニレンであり；

$R^5$ はH、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、 $-(CH_2)_q R^9$ または $NR^{10}R^{11}$ であるが、最後に挙げた基の場合、mは2であり；あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルキニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニルオキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$ 、CN、 $NO_2$ 、OH、 $COR^{10}$ 、 $NR^{10}COR^{12}$ 、 $NR^{10}SO_2R^8$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $S(O)_p R^7$ 、 $S(O)_p R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^9$ および $CO_2R^{10}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいはAが $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、そして $R^5$ が未置換、または1個またはそれ以上のハロゲン基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$ の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_m$ およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって5-または6-員の環を形成し；

$R^6$ は $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニルまたは $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニルであり；

$R^7$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ 、 $COR^{11}$ 、 $COR^{13}$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $SO_2NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、OH、 $SO_3H$ および $(C_1-C_6)$ -アルキリデンイミノからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシ、 $NO_2$ 、CN、 $CO_2(C_1-C_6)$ -アルキル、 $S(O)_p R^8$ 、OHおよびオキソからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{10}$ および $R^{12}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^{13}$ または $-(CH_2)_q R^9$ であり；あるいは

$R^{10}$ および $R^{11}$ および/または $R^{10}$ および $R^{12}$ はそれぞれ結合しているN原子と一緒にあって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5-または6-員の飽和環を形成し、該環は未置換であるか、またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキルおよび $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$ および $R^{14}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルであり；

$R^{13}$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ および $NR^{11}R^{14}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{15}$ は $R^{11}$ または $-(CH_2)_q R^{13}$ であり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に3~7個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有する複素環基である、請求項1記載の式(I)の5-置換アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農薬的に許容しうる塩。

10

20

30

40

50

## 【請求項 5】

$R^1$  は CN であり；

W は C－ハロゲンまたは C－CH<sub>3</sub> であり；

$R^2$  は水素、ハロゲンまたは CH<sub>3</sub> であり；

$R^3$  は (C<sub>1</sub>－C<sub>3</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>3</sub>)－ハロアルコキシまたは S(O)<sub>p</sub>－(C<sub>1</sub>－C<sub>3</sub>)－ハロアルキルであり；

$R^4$  は水素、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルまたは COR<sup>8</sup> であり；

A は (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－アルキレンおよび (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－ハロアルキレンであり、ここで 2、3 または 4 個の隣接する炭素原子は場合により未置換または (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される (C<sub>3</sub>－C<sub>8</sub>)－シクロアルキル環の一部を形成し；あるいは (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－アルキレンまたは (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－ハロアルキレンであり、後者 2 個の基のメチレン部分は－C(=O)－、－C(=NH)－、－O－、－S－および－NR<sup>15</sup>から選択される基により置換されるが、但し、その置換基は隣接する S(O)<sub>m</sub> 基または N 原子と結合していないか、あるいは (C<sub>2</sub>－C<sub>12</sub>)－アルケニレンまたは (C<sub>2</sub>－C<sub>12</sub>)－ハロアルケニレンであり；

$R^5$  は H、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルケニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルケニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>7</sub>)－シクロアルキル、－(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>、－(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>9</sup> または NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> であるが、最後に挙げた基の場合、S(O)<sub>m</sub> は SO<sub>2</sub> であり；あるいはハロゲン、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルコキシ、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルコキシ、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルケニルオキシ、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルケニルオキシ、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキニルオキシ、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキニルオキシ、(C<sub>3</sub>－C<sub>7</sub>)－シクロアルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、CN、NO<sub>2</sub>、OH、COR<sup>10</sup>、NR<sup>10</sup>COR<sup>12</sup>、NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>7</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup>、OR<sup>7</sup>、OR<sup>9</sup> および CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルであり；あるいは A が (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－アルキレンまたは (C<sub>1</sub>－C<sub>12</sub>)－ハロアルキレンであり、 $R^5$  が 1 個またはそれ以上のハロゲン基により置換される (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルである場合、 $R^5$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子は S(O)<sub>m</sub> および A の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって 5－または 6－員の環を形成し；

$R^6$  は (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>)－アルケニル、(C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキニルまたは (C<sub>2</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキニルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルコキシ、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、COR<sup>11</sup>、COR<sup>13</sup>、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、OH、SO<sub>3</sub>H および (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキリデンイミノからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$  は (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルまたは (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキルであり；

$R^9$  は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>－C<sub>4</sub>)－アルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>4</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>4</sub>)－アルコキシ、(C<sub>1</sub>－C<sub>4</sub>)－ハロアルコキシ、NO<sub>2</sub>、CN、CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、OH および オキソ からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ独立して H、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルケニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルケニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－シクロアルキル、－(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル－(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－シクロアルキル、－(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>13</sup> または －(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>9</sup> であり；あるいは

$R^{10}$  および  $R^{11}$  および／または  $R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ結合している N 原子と一緒にあって、場合により環中に O、S および N から選択される追加のヘテロ原子を含有する 5－または 6－員の飽和環を形成し、該環は未置換であるか、またはハロゲン、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキルおよび (C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$  および  $R^{14}$  はそれぞれ独立して H、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル、(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－ハロアルキル、(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－シクロアルキルまたは －(C<sub>1</sub>－C<sub>6</sub>)－アルキル－(C<sub>3</sub>－C<sub>6</sub>)－シクロアルキルであり；

10

20

30

40

50

$R^{13}$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ および $NR^{11}R^{14}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{15}$ は $R^{11}$ または $-(CH_2)_q R^{13}$ であり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に3～7個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有する複素環基である、請求項1記載の式(I)の5-置換アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農薬的に許容しうる塩。

10

#### 【請求項6】

式(I)において、

$R^1$ はCNであり； $R^2$ は塩素であり； $R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；WはC-Clであり； $R^4$ は水素または $(C_1-C_6)$ -アルキルであり； $R^5$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルであり； $R^6$ は $CF_3$ であり；Aは $(C_2-C_3)$ -アルキレンであり、そしてmおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である、

式(I)の5-置換アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農薬的に許容しうる塩

#### 【請求項7】

動物の体内外の寄生虫を防除するための請求項1～6の何れかの項記載の式(I)の化合物およびその農薬的に許容しうる塩の使用。

20

#### 【請求項8】

獣医用薬剤を製造するための請求項1～6の何れかの項記載の式(I)の化合物およびその農薬的に許容しうる塩の使用。

#### 【請求項9】

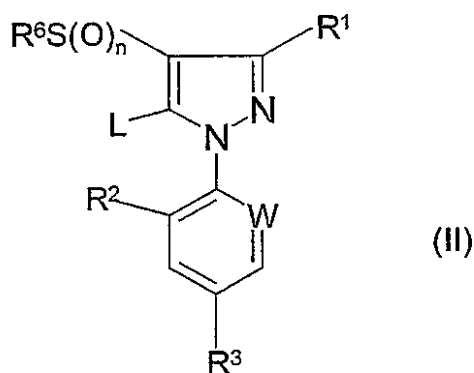
請求項1～6の何れかの項記載の式(I)の化合物またはその農薬的に許容しうる塩を農薬的に許容しうる希釈剤または担体および／または界面活性剤と一緒に含有する農薬組成物。

#### 【請求項10】

a)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、W、A、mおよびnが請求項1で定義された通りであり、 $R^4$ および $R^5$ が水素を除いて請求項1で定義された通りであり、そして $R^4$ がHである場合、式(II)

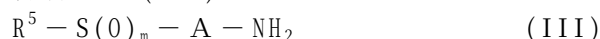
30

#### 【化2】



40

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、Wおよびnは請求項1で定義された通りであり、そしてLは脱離基である)の化合物を式(III)：



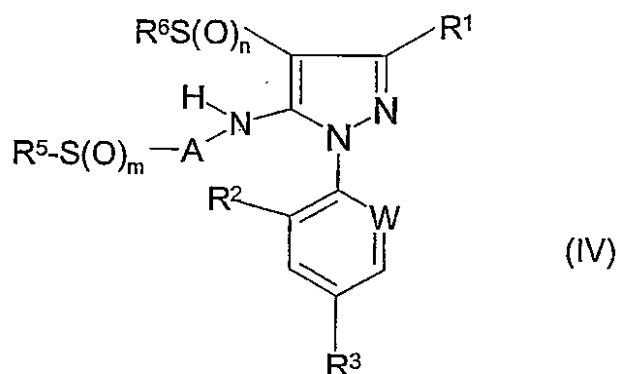
(式中、mおよびAは請求項1で定義された通りであり、そして $R^5$ は水素を除いて請求項1で定義された通りである)の化合物と反応させる；または

b)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、W、A、mおよびnが請求項1で定義された通りであり、 $R^4$ が水素、 $OR^7$ 、 $OR^8$ および $OR^9$ を除いて請求項1で定義された通りであり、そして $R^5$ がHを

50

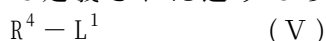
除いて請求項 1 で定義された通りである場合、式 (IV) :

【化 3】



10

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ 、 $m$ および $n$ は請求項 1 で定義された通りであり、そして $R^5$ は水素を除いて請求項 1 で定義された通りである) の化合物を式 (V) :

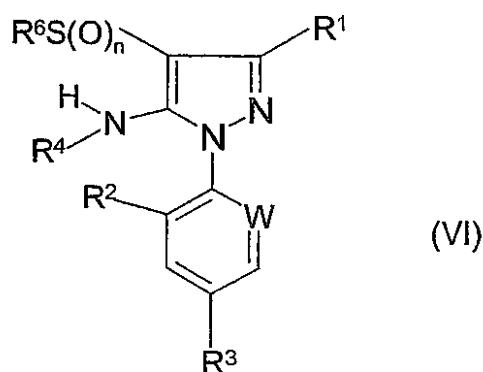


(式中、 $R^4$ は水素、 $OR^7$ 、 $OR^8$ および $OR^9$ を除いて請求項 1 で定義された通りであり、そして $L^1$ は脱離基である) の化合物と反応させる ; または

c)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ 、 $m$ および $n$ が請求項 1 で定義された通りであり、そして $R^5$ が水素を除いて請求項 1 で定義された通りである場合、式 (VI) :

20

【化 4】



30

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は請求項 1 で定義された通りである) の化合物を式 (VII) :

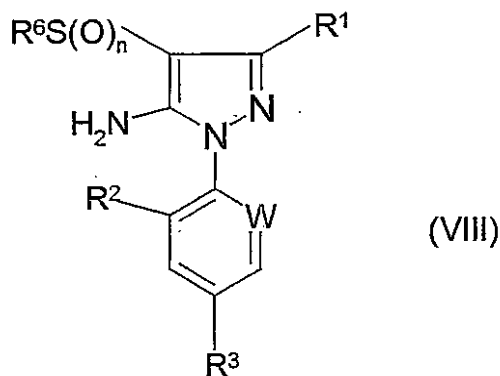


(式中、 $m$ および $A$ は請求項 1 で定義された通りであり、 $R^5$ は水素を除いて請求項 1 で定義された通りであり、そして $L^2$ は脱離基である) の化合物と反応させ ;

d)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ が請求項 1 で定義された通りであり、 $R^5$ が水素を除いて請求項 1 で定義された通りであり、 $R^4$ が水素であり、 $A$ が $-CH_2-$ であり、そして $m$ が 0 である場合、式 (VIII) :

40

【化 5】



10

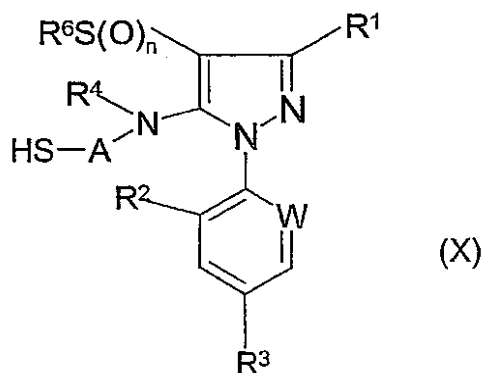
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は請求項1で定義された通りである)の化合物をホルムアルデヒドおよび式(IX)：



(式中、 $R^5$ は水素を除いて請求項1で定義された通りである)の化合物の混合物と反応させる；または

e)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ が請求項1で定義された通りであり、 $R^5$ が水素を除いて請求項1で定義された通りであり、そして $m$ が0である場合、式(X)：

【化 6】



20

30

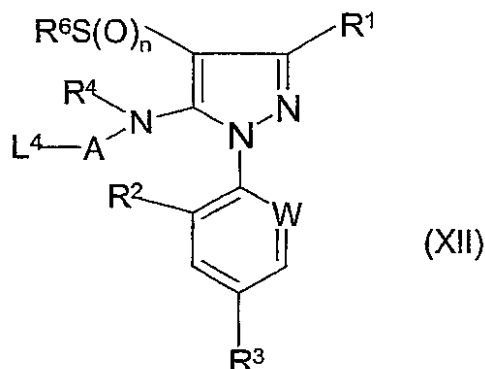
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は請求項1で定義された通りである)の化合物を式(XI)：



(式中、 $R^5$ は水素を除いて請求項1で定義された通りであり、そして $L^3$ は脱離基である)の化合物と反応させる；または

f)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ が請求項1で定義された通りであり、そして $m$ が0である場合、式(XII)：

【化 7】

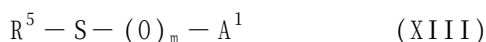


40

50

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は請求項1で定義された通りであり、そして $L^4$ は脱離基である)の化合物を上記で定義された式(IX)の化合物と反応させる；または

g)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ が請求項1で定義された通りであり、 $R^5$ が水素を除いて請求項1で定義された通りであり、そして $A$ がそのうち2個の炭素鎖は $R^5-S(O)_m$ —および $-NR^4-$ 基と結合する $(C_2-C_{12})$ —アルキレンである場合、上記式(VI)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は請求項1で定義された通りである)の化合物を式(XIII)：



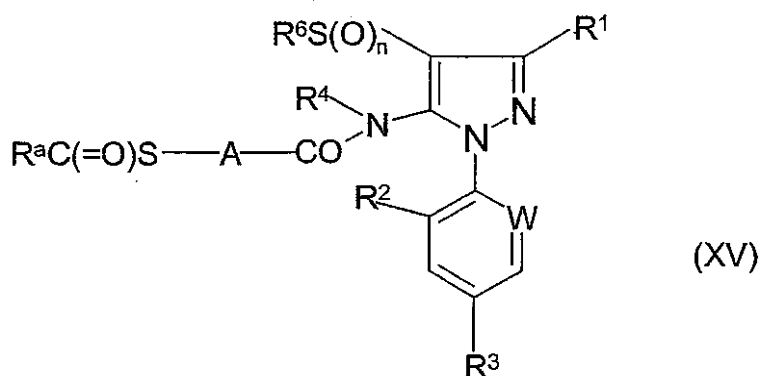
(式中、 $R^5$ は請求項1で定義された通りであり、そして $A^1$ は二重結合が $R^5-S(O)_m$ 基に隣接する $(C_2-C_{12})$ —アルケニル基である)の化合物と反応させる；または

h)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は請求項1で定義された通りであり、 $R^5$ は水素であり、そして $m$ は0である場合、上記で定義された式(XII)の相当する化合物を式(XIV)：



(式中、 $R^a$ は $(C_1-C_6)$ —アルキルである)の化合物と反応させて式(XV)：

【化8】



(式中、各記号は上記で定義された通りである)の化合物を得、次に式(XV)の化合物を加水分解して $R^5$ がHである式(I)の相当する化合物を得る；または

i)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $A$ が請求項1で定義された通りであり、そして $m$ および/または $n$ が1または2である場合、 $m$ および/または $n$ が0または1である相当する化合物を酸化し；そして

j) 所望により、得られた式(I)の化合物をその農薬的に許容しうる塩に変換することからなる請求項1～6の何れかの項記載の式(I)の化合物またはその塩の製造法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は害虫(昆虫、クモ類および蠕虫(線虫など)を含む)の防除における5-置換-アルキルアミノピラゾール誘導体の使用、そこで使用される新規化合物および組成物、並びにそれらの製造で使用される方法に関する。

【背景技術】

【0002】

1-アリアルピラゾール化合物による昆虫、クモ類および蠕虫の防除は例えば特許公開番号W093/06089、W094/21606、W087/03781、EP0295117、EP659745、EP679650、EP201852および米国特許第5,232,940号に記載されている。1-アリアルピラゾール化合物による動物の寄生虫の防除もまた、例えば特許公開番号W000/35884、EP0846686、W098/24769およびW0 97/28126に記載されている。

【0003】

さらに、W002/066423は1-アリアルピラゾール化合物の製造法を開示している。

しかしながら、これらの従来化合物の作用効力および/または作用持続時間はすべての

応用分野で、とりわけ特定の微生物に対して、または低濃度で施用された場合に十分に満足できるものではない。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現在の農薬は例えば作用の効力、持続時間および範囲、使用範囲、毒性、他の活性物質との組合せ、配合補助剤との組合せまたは合成法に関して幅広い要求を満たす必要があるため、また耐性の発現も考えられるため、このような物質の開発が終結したとは決してみなされず、少なくとも幾つかの特徴に関する限り既知化合物より有利な新規化合物に対する高い需要が絶えずある。

10

【0005】

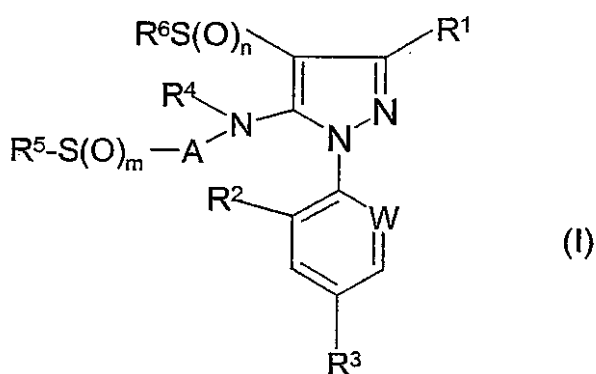
本発明の目的は様々な状況下で、特に動物の寄生虫の防除に関して農薬の作用範囲を広げる化合物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0006】

本発明は殺寄生生物的に有効な量の式(I)

【化1】



20

[式中、 $R^1$ はCNであり；

$W$ はC-ハロゲン、C- $CH_3$ またはNであり；

30

$R^2$ は水素、ハロゲンまたは $CH_3$ であり；

$R^3$ は $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシまたは $S(O)_p-(C_1-C_3)$ -ハロアルキルであり；

$R^4$ は水素、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $CO-(CH_2)_q-R^7$ 、 $COR^8$ 、 $CO-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CO_2-(CH_2)_q-R^9$ 、 $-CO_2-(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $-CH_2R^7$ 、 $-CH_2R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ 、 $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-O(C=O)-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $NR^{10}COR^{12}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $SO_2NR^{10}R^{11}$ 、 $OH$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $OR^7$ 、 $NR^{10}SO_2R^8$ 、 $COR^8$ および $OR^9$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

40

【0007】

$A$ は $(C_1-C_{12})$ -アルキレン〔好ましくは $(C_1-C_6)$ -アルキレン〕または $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレン〔好ましくは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレン〕であり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_8)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；あるいは $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンで

50

あり、後者 2 個の基のメチレン部分は  $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$  および  $-NR^{15}$  から選択される基により置換されているが、但し、その置換基は隣接する  $S(O)_m$  基または N 原子と結合していないか、あるいは  $(C_2-C_{12})$ -アルケニレンまたは  $(C_2-C_{12})$ -ハロアルケニレンであり；

#### 【0008】

$R^5$  は  $H$ 、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、 $-(CH_2)_q R^9$  または  $NR^{10} R^{11}$  であるが、最後に挙げた基の場合、 $m$  は 2 であり；あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルキニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニルオキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $OH$ 、 $COR^{10}$ 、 $NR^{10} COR^{12}$ 、 $NR^{10} SO_2 R^8$ 、 $CONR^{10} R^{11}$ 、 $NR^{10} R^{11}$ 、 $S(O)_p R^7$ 、 $S(O)_p R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^9$  および  $CO_2 R^{10}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいは  $A$  が  $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは  $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、そして  $R^5$  が未置換、または 1 個またはそれ以上のハロゲン基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子は  $S(O)_m$  および  $A$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって 5-または 6-員の環を形成し；

#### 【0009】

$R^6$  は  $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニルまたは  $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ 、 $COR^{11}$ 、 $COR^{13}$ 、 $CONR^{10} R^{11}$ 、 $SO_2 NR^{10} R^{11}$ 、 $NR^{10} R^{11}$ 、 $OH$ 、 $SO_3 H$  および  $(C_1-C_6)$ -アルキリデンイミノからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$  は  $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシ、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $CO_2 (C_1-C_6)$ -アルキル、 $S(O)_p R^8$ 、 $OH$  および オキソからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

#### 【0010】

$R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ独立して  $H$ 、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^{13}$  または  $-(CH_2)_q R^9$  であり；あるいは

$R^{10}$  および  $R^{11}$  および/または  $R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ結合している N 原子と一緒にあって、場合により環中に O、S および N から選択される追加のヘテロ原子を含有する 5-または 6-員の飽和環を形成し、前記環は未置換であるか、またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキルおよび  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$  および  $R^{14}$  はそれぞれ独立して  $H$ 、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは  $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルであり；

#### 【0011】

$R^{13}$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$  および  $NR^{11} R^{14}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{15}$  は  $R^{11}$  または  $-(CH_2)_q R^{13}$  であり；

$m$ 、 $n$  および  $p$  はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；

$q$  は 0 または 1 であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に 3～7 個の環原子と N、O および

10

20

30

40

50

Sからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有する複素環基である]の5-置換アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農薬的に許容しうる塩を動物に投与することからなる動物の体内外の寄生虫を防除する方法を提供する。

【0012】

本発明の別の面において、動物の体内外にいる寄生虫を防除するための式(I)の化合物およびその農薬的に許容しうる塩の使用が提供される。

【0013】

本発明のさらに別の面において、好ましくは動物の体内外にいる寄生虫、特に外部および内部寄生虫を処理するための獣医用薬剤の製造における式(I)の化合物およびその農薬的に許容しうる塩の使用が提供される。

10

【0014】

本発明はまた、式(I)の化合物の立体異性体、エナンチオマーまたは幾何異性体、およびその混合物をすべて包含する。

【0015】

「農薬的に許容しうる塩」なる用語はそのアニオンまたはカチオンが農薬として使用される塩の製造に関して当該技術分野で知られており、許容される塩を意味する。例えばカルボン酸基を含有する式(I)の化合物により生成する塩基との適当な塩にはアルカリ金属(例えばナトリウムおよびカリウム)、アルカリ土類金属(例えばカルシウムおよびマグネシウム)、アンモニウムおよびアミン(例えばジエタノールアミン、トリエタノールアミン、オクチルアミン、モルホリンおよびジオクチルメチルアミン)塩がある。例えばアミノ基を含有する式(I)の化合物により生成する適当な酸付加塩には無機酸との塩、例えば塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩および硝酸塩、並びに有機酸との塩、例えば酢酸塩がある。式(I)のmが0である場合、「塩」なる用語はさらにスルホニウム塩、例えばハロゲン化アルキルまたはベンジルスルホニウム塩、例えば塩化メチルスルホニウム塩を包含する。

20

【0016】

上記の但し書は単に特定の部分が化学的に不安定であるため除外されたのであり、従来技術だからではないことを示すために加えられたことは理解されよう。

【0017】

添付した特許請求の範囲を含む本明細書において、前記置換基は次の意味を有する：

ハロゲン原子はフッ素、塩素、臭素または沃素を意味する。

30

【0018】

基の名前に前置する「ハロ」なる用語はこの基が部分的または完全にハロゲン化される、すなわち何れかの組合せでF、Cl、BrまたはI、好ましくはFまたはClにより置換されることを意味する。

【0019】

アルキル基およびその一部は(特に断りがなければ)直鎖または分枝鎖である。

「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル」なる表現は1、2、3、4、5または6個の炭素原子を有する非分枝鎖状または分枝鎖状炭化水素基、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、1-ブチル、2-ブチル、2-メチルプロピルまたはt-ブチル基を意味する。

アルキル基、さらにその複合基は特に断りがなければ、好ましくは1~4個の炭素原子を有する。

40

【0020】

「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル」は1個またはそれ以上の水素原子が同じ数の同一または異なるハロゲン原子により置換される「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル」で説明したアルキル基を意味し、例えばモノハロアルキル、ペルハロアルキル、CF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHFCH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>FCHCl、CH<sub>2</sub>Cl、CCl<sub>3</sub>、CHCl<sub>2</sub>またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Clである。

「(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-アルキレン」なる表現は1~12個の炭素原子を有する非分枝鎖状または分枝鎖状飽和炭素鎖を意味する。

【0021】

「(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルキレン」なる表現は1~12個の炭素原子を有し、1個または

50

それ以上の水素原子が同じ数の同一または異なるハロゲン原子により置換される非分枝鎖状または分枝鎖状飽和炭素鎖を意味する。

「 $(C_2-C_{12})$ -アルケニレン」なる表現は2～12個の炭素原子を有し、それぞれの不飽和基の何れかの位置に存在する少なくとも1個の二重結合を含有する非分枝鎖状または分枝鎖状飽和炭素鎖を意味する。

#### 【0022】

「 $(C_1-C_6)$ アルコキシ」は炭素鎖が「 $(C_1-C_6)$ アルキル」で定義された意味を有するアルコキシ基を意味する。「ハロアルコキシ」は例えば $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCH_2F$ 、 $CF_3CF_2O$ 、 $OCH_2CF_3$ または $OCH_2CH_2Cl$ である。

「 $(C_2-C_6)$ アルケニル」は表示した範囲に相当する数の炭素原子を有し、それぞれの不飽和基の何れかの位置に存在する少なくとも1個の二重結合を含有する非分枝鎖状または分枝鎖状非環式炭素鎖を意味する。したがって、「 $(C_2-C_6)$ アルケニル」は例えばビニル、アリル、2-メチル-2-プロペニル、2-ブテニル、ペンテニル、2-メチルペンテニルまたはヘキセニル基を示す。 10

#### 【0023】

「 $(C_2-C_6)$ アルキニル」は表示した範囲に相当する数の炭素原子を有し、それぞれの不飽和基の何れかの位置に存在する1個の三重結合を含有する非分枝鎖状または分枝鎖状非環式炭素鎖を意味する。したがって、「 $(C_2-C_6)$ アルキニル」は例えばプロパルギル、1-メチル-2-プロピニル、2-ブチニルまたは3-ブチニル基を示す。

シクロアルキル基は好ましくは環中に3～7個の炭素原子を有し、場合によりハロゲンまたはアルキルにより置換される。 20

#### 【0024】

式(I)の化合物として、次の例の基が示される：

シクロアルキルにより置換されるアルキルの例はシクロプロピルメチルであり；

アルコキシにより置換されるアルキルの例はメトキシメチル( $CH_3OCH_2-$ )であり；そして

アルキルチオにより置換されるアルキルの例はメチルチオメチル( $CH_3SCH_2-$ )である。

#### 【0025】

「複素環」基は飽和、不飽和またはヘテロ芳香族であり；好ましくは複素環中に好ましくはN、OおよびSからなる群より選択される1個またはそれ以上、特に1、2または3個のヘテロ原子を含有し；好ましくは3～7個の環原子を有する脂肪族複素環基または5～7個の環原子を有するヘテロ芳香族基である。複素環基は例えばヘテロ芳香族基または環(ヘテロアリール)、例えば少なくとも1個の環が1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有する単環式、二環式または多環式芳香族系であり、例えばピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、チエニル、チアゾリル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、フリル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリルおよびトリアゾリル、あるいは部分的または完全に水素化された基、例えばオキシラニル、オキセタニル、オキシラニル(=テトラヒドロフリル)、オキサニル、ピロリジル、ペペリジル、ペペラジニル、ジオキシラニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニルおよびモルホリニルである。「複素環」基は未置換であるか、あるいはハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、カルボキシル、シアノ、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、ホルミル、カルバモイル、モノーおよびジアルキルアミノカルボニル、置換アミノ、例えばアシルアミノ、モノーおよびジアルキルアミノ、並びにアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルおよびハロアルキル、さらにオキソからなる群より選択される1個またはそれ以上の基(好ましくは1、2または3個の基)により置換される。オキソ基は例えばNおよびSの場合はいろいろな酸化数が可能であるヘテロ環原子で存在することもできる。 30 40

#### 【0026】

「害虫」なる用語は節足動物の害虫(昆虫およびクモ類を含む)、および蠕虫(線虫を 50

含む)を意味する。「寄生虫」なる用語は動物の体内外に生存するすべての害虫を包含する。

# 【0027】

本発明で使用される好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

$R^2$ は水素またはハロゲンであり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は水素、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $CO_2R^8$ 、 $-CH_2R^7$ 、 $-CH_2R^9$ 、O 10  
 $R^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ および $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

Aは $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

# 【0028】

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_qR^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C$  20  
 $_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ および $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいはAが $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり、そして $R^5$ が $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルである場合、 $R^5$ 基の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_m$ 基およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって5-または6-員の環を形成し；

$R^6$ および $R^8$ はそれぞれ独立して $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^7$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_pR^8$ および $NR^{11}R^{12}$ からなる群より選択される1個またはそ 30  
 れ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキルおよび $(C_1-C_4)$ -アルコキシからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{11}$ および $R^{12}$ は同一または異なって水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

# 【0029】

本発明で使用される他の好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

$R^2$ はハロゲンであり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は水素、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_3)$ -アルキル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_3)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-CH_2R^7$ または $-CH_2R^9$ 、あるいは未置換またはハ 50  
 ロゲン、 $(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ 、 $CO_2-(C_1-C_3)$ -アルキル、 $-O(C=O)-(C_1-C_3)$ -アルキル、 $NR^{10}R^{11}$ 、OH、C

N、NO<sub>2</sub>、OR<sup>7</sup>またはOR<sup>9</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルキルであり；

Aは(C<sub>1</sub>–C<sub>9</sub>)–アルキレンまたは(C<sub>1</sub>–C<sub>9</sub>)–ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>)–シクロアルキル環の一部を形成し；

#### 【0030】

R<sup>5</sup>は(C<sub>3</sub>–C<sub>7</sub>)–シクロアルキルまたは–(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>、あるいは未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルコキシ、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–ハロアルコキシ、(C<sub>3</sub>–C<sub>7</sub>)–シクロアルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、CN、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>7</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup>、OR<sup>7</sup>およびOR<sup>9</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキルであり；

R<sup>6</sup>は(C<sub>1</sub>–C<sub>2</sub>)–ハロアルキルであり；

R<sup>7</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–ハロアルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルコキシ、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、COR<sup>11</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>およびOHからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

R<sup>8</sup>は(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルキルまたは(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–ハロアルキルであり；

R<sup>9</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–ハロアルキルおよび(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)–アルコキシからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

#### 【0031】

R<sup>10</sup>はH、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–ハロアルキル、(C<sub>3</sub>–C<sub>4</sub>)–アルケニル、(C<sub>3</sub>–C<sub>4</sub>)–アルキニル、(C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>)–シクロアルキル、–(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキル–(C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>)–シクロアルキルまたは–(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>13</sup>であり；あるいは

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は結合しているN原子と一緒にあって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5–または6–員の飽和環を形成し、前記環は未置換であるか、またはハロゲンおよび(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換され；

R<sup>11</sup>およびR<sup>14</sup>はそれぞれ独立してH、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–ハロアルキル、(C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>)–シクロアルキルまたは–(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルキル–(C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>)–シクロアルキルであり；

R<sup>13</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–ハロアルキル、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–アルコキシ、(C<sub>1</sub>–C<sub>3</sub>)–ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>およびNR<sup>11</sup>R<sup>14</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に5または6個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有するヘテロ芳香族基である化合物である。

#### 【0032】

さらに、本発明で使用する他の好ましい式(I)の化合物は、

R<sup>1</sup>はCNであり；

WはC–Clであり；

R<sup>2</sup>は塩素であり；

R<sup>3</sup>はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup>は水素、(C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>)–アルケニル、(C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキニル、(C<sub>3</sub>–C<sub>7</sub>)–シクロアルキル、COR<sup>9</sup>（ここでR<sup>9</sup>はテトラヒドロフリルである）、–COCH<sub>2</sub>–(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ、–CO<sub>2</sub>–(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキル、–CO<sub>2</sub>–(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>–R<sup>7</sup>、OR<sup>7</sup>、OR<sup>8</sup>またはOR<sup>9</sup>（ここでR<sup>9</sup>はピリジルである）、あるいは未置換または(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルコキシ、(C<sub>3</sub>–C<sub>7</sub>)–シクロアルキルおよびS(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)–アルキルであり；

10

20

30

40

50

Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレンであり；

R<sup>5</sup>は(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルであり；あるいはAが(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-アルキレンまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルキレンであり、R<sup>5</sup>が(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルである場合、R<sup>5</sup>基の1個またはそれ以上の炭素原子はS(0)<sub>m</sub>基およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒になって5-または6-員の環を形成し；

R<sup>6</sup>はCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CFCl<sub>2</sub>、CBrF<sub>2</sub>またはCHF<sub>2</sub>であり；

R<sup>7</sup>はフェニルであり；

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

10

### 【0033】

さらに、本発明で使用する他の好ましい式(I)の化合物は、

R<sup>1</sup>はCNであり；

WはC-Clであり；

R<sup>2</sup>はClであり；

R<sup>3</sup>はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup>は水素、CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-アルキル、あるいは未置換またはハロゲンおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-アルコキシからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

20

Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル環の一部を形成し；

R<sup>5</sup>は(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>またはNR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>であるが、最後に挙げた基の場合、XはSO<sub>2</sub>であり；あるいは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルであり；

R<sup>6</sup>はCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CFCl<sub>2</sub>、CBrF<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>またはCH<sub>3</sub>であり；

R<sup>7</sup>は未置換、または1個またはそれ以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ基により置換されるフェニルであり；

R<sup>8</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は同一または異なって(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；あるいは

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>は結合しているN原子と一緒になって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5-または6-員の飽和環を形成し；

30

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

### 【0034】

さらに、本発明で使用する他の好ましい式(I)の化合物は、

R<sup>1</sup>はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

R<sup>2</sup>は水素またはハロゲンであり；

R<sup>3</sup>はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup>は水素、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルまたは-CH<sub>2</sub>R<sup>7</sup>、あるいは未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、S(0)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>およびCO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

40

Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレンまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル環の一部を形成し；

R<sup>5</sup>は(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキルまたは-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>、あるいは未置換またはハロゲン、(C

50

$1-C_6$ )—アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ —ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ —シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$  および  $CO_2-(C_1-C_6)$ —アルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_6)$ —アルキルであり；あるいは A が  $(C_1-C_6)$ —アルキレンまたは  $(C_1-C_6)$ —ハロアルキレンであり、 $R^5$  が未置換、または 1 個またはそれ以上のハロゲン基により置換される  $(C_1-C_6)$ —アルキルである場合、 $R^5$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子は  $S(O)_m$  および A の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって 5—または 6—員の環を形成し；

$R^6$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して  $(C_1-C_6)$ —アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ —ハロアルキルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ —アルキル、 $(C_1-C_6)$ —ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ —アルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$  および  $NR^{10} R^{11}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり； 10

$R^{10}$  および  $R^{11}$  はそれぞれ独立して H、 $(C_1-C_6)$ —アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ —ハロアルキルであり；

m、n および p はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；そして

q は 0 または 1 である化合物である。

#### 【0035】

さらに、本発明で使用する他の好ましい式 (I) の化合物は、

$R^1$  は CN であり；

W は C—ハロゲンであり； 20

$R^2$  はハロゲンであり；

$R^3$  は  $CF_3$  または  $OCF_3$  であり；

$R^4$  は水素、 $(C_2-C_6)$ —アルケニル、 $(C_2-C_6)$ —ハロアルケニル、 $(C_3-C_7)$ —シクロアルキル、 $(C_1-C_4)$ —アルキル— $(C_3-C_7)$ —シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_6)$ —アルキル、 $(C_1-C_6)$ —アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ —ハロアルキルであり；

A は未置換または  $(C_1-C_6)$ —アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_{12})$ —アルキレンであり；

$R^5$  は  $(C_1-C_6)$ —アルキルであり；

$R^6$  は  $CF_3$ 、 $CF_2Cl$ 、 $CFCl_2$ 、 $CBrF_2$  または  $CHF_2$  であり；そして

m および n はそれぞれ独立して 0、1 または 2 である化合物である。 30

#### 【0036】

さらに、本発明で使用する特に好ましい式 (I) の化合物は次の特徴の 1 つまたはそれ以上が存在する化合物である：

$R^4$  は水素、 $(C_1-C_4)$ —アルキル、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ —アルキル、 $(C_3-C_4)$ —アルケニル、 $(C_1-C_2)$ —アルキル— $(C_3-C_4)$ —シクロアルキルまたは  $(C_3-C_4)$ —シクロアルキルである；

$R^5$  は  $(C_1-C_2)$ —アルキルである；および

A は  $(C_2-C_3)$ —アルキレンである。

#### 【0037】

さらに、本発明で使用する他の特に好ましい化合物は、 40

$R^1$  は CN であり；

$R^2$  は塩素であり；

$R^3$  は  $CF_3$  であり；

W は C—Cl であり；

$R^4$  は水素、 $(C_1-C_4)$ —アルキル、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ —アルキル、 $(C_3-C_4)$ —アルケニル、 $(C_1-C_2)$ —アルキル— $(C_3-C_4)$ —シクロアルキルまたは  $(C_3-C_4)$ —シクロアルキルであり；

$R^5$  は  $(C_1-C_2)$ —アルキルであり；

$R^6$  は  $CF_3$  であり；

A は  $(C_2-C_3)$ —アルキレンであり；そして 50

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

【0038】

本発明で使用されるより好ましい式(I)の化合物は、

R<sup>1</sup>はCNであり；R<sup>2</sup>は塩素であり；R<sup>3</sup>はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；WはC-Clであり；R<sup>4</sup>は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；R<sup>5</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；R<sup>6</sup>はCF<sub>3</sub>であり；Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキレンであり；そしてmおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

【0039】

さらに、本発明で使用される特に好ましい式(I)の化合物は次の特徴の何れかが存在する化合物である：

WはC-Clである；

R<sup>2</sup>は塩素である；

R<sup>3</sup>はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>である；

R<sup>4</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルである；

R<sup>5</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルである；

R<sup>6</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-ハロアルキル（より好ましくはR<sup>6</sup>はCF<sub>3</sub>）である；および／または

Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン（より好ましくはAは(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-アルキレン）である。

【0040】

幾つかの式(I)の化合物は新規であり、したがって本発明の別の特徴は新規な式(I)の化合物に関する。

【0041】

新規な式(I)の5-置換-アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農業的に許容しうる塩は、

R<sup>1</sup>はCNであり；

WはC-ハロゲンまたはC-CH<sub>3</sub>であり；

R<sup>2</sup>は水素、ハロゲンまたはCH<sub>3</sub>であり；

R<sup>3</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-ハロアルコキシまたはS(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-ハロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>7</sup>、CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>9</sup>、-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、-CO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>7</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、-CO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、-CO<sub>2</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、-CH<sub>2</sub>R<sup>7</sup>、-CH<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、OR<sup>7</sup>、OR<sup>8</sup>またはOR<sup>9</sup>であり；あるいはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、-O(C=O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、NR<sup>10</sup>COR<sup>12</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、OH、CN、NO<sub>2</sub>、OR<sup>7</sup>、NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、COR<sup>8</sup>およびOR<sup>9</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

【0042】

Aは(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-アルキレン〔好ましくは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキレン〕および(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルキレン〔好ましくは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキレン〕であり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル環の一部を形成し；あるいは(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-アルキレンまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルキレンであり、後者2個の基のメチレン部分は-C(=O)-、-C(=NH)-、-O-、-S-および-NR<sup>15</sup>から選択される基により置換されるが、但し、その置換基は隣接するS(O)<sub>m</sub>基またはN原子と結合していないか、あるいは(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-アルケニレンまたは(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルケニレンであり；

【0043】

R<sup>5</sup>はH、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、

(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>7</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>9</sup>またはNR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>であるが、最後に挙げた基の場合、mは2であり；あるいは未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニルオキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニルオキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニルオキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニルオキシ、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-シクロアルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、CN、NO<sub>2</sub>、OH、COR<sup>10</sup>、NR<sup>10</sup>COR<sup>12</sup>、NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>7</sup>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup>、OR<sup>7</sup>、OR<sup>9</sup>およびCO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルであり；あるいはAが(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-アルキレンまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-ハロアルキレンであり、そしてR<sup>5</sup>が未置換、または1個またはそれ以上のハロゲン基により置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルである場合、R<sup>5</sup>の1個またはそれ以上の炭素原子はS(O)<sub>m</sub>およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒に5-または6-員の環を形成し；

10

#### 【0044】

R<sup>6</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニルまたは(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニルであり；

R<sup>7</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、COR<sup>11</sup>、COR<sup>13</sup>、CONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>、OH、SO<sub>3</sub>Hおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキリデンイミノからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

R<sup>8</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルであり；

R<sup>9</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシ、NO<sub>2</sub>、CN、CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、OHおよびオキソからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

20

#### 【0045】

R<sup>10</sup>およびR<sup>12</sup>はそれぞれ独立してH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>13</sup>または-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>9</sup>であり；あるいは

R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>および／またはR<sup>10</sup>およびR<sup>12</sup>はそれぞれ結合しているN原子と一緒に、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5-または6-員の飽和環を形成し、前記環は未置換であるか、またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換され；

30

R<sup>11</sup>およびR<sup>14</sup>はそれぞれ独立してH、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキルまたは-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキルであり；

R<sup>13</sup>は未置換またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>およびNR<sup>11</sup>R<sup>14</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

R<sup>15</sup>はR<sup>11</sup>または-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>13</sup>であり；

40

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に3～7個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有する複素環基であるものである。

#### 【0046】

好ましい式(I)の化合物は、

R<sup>1</sup>はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

R<sup>2</sup>は水素またはハロゲンであり；

50

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $CO_2R^8$ 、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $-CO_2-CH_2R^7$ 、 $-CH_2R^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^8$ または $OR^9$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ および $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

Aは $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

10

#### 【0047】

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_qR^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ および $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいはAが $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり、そして $R^5$ が $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルである場合、 $R^5$ 基の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_p$ 基およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒に5-または6-員の環を形成し；

20

$R^6$ および $R^8$ はそれぞれ独立して $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^7$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $S(O)_pR^8$ および $NR^{11}R^{12}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキルおよび $(C_1-C_4)$ -アルコキシからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{11}$ および $R^{12}$ は同一または異なって水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

30

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

#### 【0048】

他の好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ は $CN$ であり；

WはC-ハロゲンであり；

$R^2$ は水素またはハロゲンであり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $CO_2R^8$ 、 $-CO_2-(C_3-C_6)$ -アルキニルまたは $-CH_2R^7$ 、あるいはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ および $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

40

Aは $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

#### 【0049】

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_qR^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ およ

50

び  $\text{CO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  であり；あるいは A が  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキレン}$  または  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{ハロアルキレン}$  であり、そして  $\text{R}^5$  が未置換、または 1 個またはそれ以上のハロゲン基により置換される  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  である場合、 $\text{R}^5$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子は  $\text{S}(\text{O})_m$  および A の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって 5 - または 6 - 員の環を形成し；

$\text{R}^6$  および  $\text{R}^8$  はそれぞれ独立して  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  または  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{ハロアルキル}$  であり；

$\text{R}^7$  は未置換またはハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルコキシ}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^8$  および  $\text{NR}^{10} \text{R}^{11}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり； 10

$\text{R}^{10}$  および  $\text{R}^{11}$  はそれぞれ独立して  $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  または  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{ハロアルキル}$  であり；

$m$ 、 $n$  および  $p$  はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；そして

$q$  は 0 または 1 である化合物である。

#### 【0050】

他の好ましい式 (I) の化合物は、

$\text{R}^1$  は  $\text{CN}$  であり；

$\text{W}$  は  $\text{C} - \text{ハロゲン}$  であり；

$\text{R}^2$  はハロゲンであり； 20

$\text{R}^3$  は  $\text{CF}_3$  または  $\text{OCF}_3$  であり；

$\text{R}^4$  は  $(\text{C}_2 - \text{C}_6) - \text{アルケニル}$ 、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6) - \text{アルキニル}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7) - \text{シクロアルキル}$ 、 $-\text{CO}_2 \text{R}^8$ 、 $-\text{CO}_2 - (\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{アルキニル}$ 、 $-\text{CO}_2 - (\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{シクロアルキル}$ 、 $-\text{CO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルキル} - (\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{シクロアルキル}$ 、 $-\text{CH}_2 \text{R}^7$  または  $-\text{CH}_2 \text{R}^9$ 、あるいはハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{シクロアルキル}$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^8$ 、 $\text{CO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルキル}$ 、 $-\text{O}(\text{C}=\text{O}) - (\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルキル}$ 、 $\text{NR}^{10} \text{R}^{11}$ 、 $\text{OH}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{OR}^7$  または  $\text{OR}^9$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$  であり；

A は  $(\text{C}_1 - \text{C}_9) - \text{アルキレン}$  または  $(\text{C}_1 - \text{C}_9) - \text{ハロアルキレン}$  であり、ここで 2、3 または 4 個の隣接する炭素原子は場合により未置換または  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  およびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(\text{C}_3 - \text{C}_8) - \text{シクロアルキル環}$  の一部を形成し； 30

#### 【0051】

$\text{R}^5$  は  $(\text{C}_3 - \text{C}_7) - \text{シクロアルキル}$  または  $-(\text{CH}_2)_q \text{R}^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7) - \text{シクロアルキル}$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^8$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NR}^{10} \text{R}^{11}$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^9$ 、 $\text{OR}^7$  および  $\text{OR}^9$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル}$  であり；

$\text{R}^6$  は  $(\text{C}_1 - \text{C}_2) - \text{ハロアルキル}$  であり；

$\text{R}^7$  は未置換またはハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{S}(\text{O})_p \text{R}^8$ 、 $\text{COR}^{11}$ 、 $\text{NR}^{10} \text{R}^{11}$  および  $\text{OH}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり； 40

$\text{R}^8$  は  $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$  または  $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルキル}$  であり；

$\text{R}^9$  は未置換またはハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルキル}$  および  $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシ}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$\text{R}^{10}$  は  $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_4) - \text{アルケニル}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_4) - \text{アルキニル}$ 、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{シクロアルキル}$ 、 $-(\text{C}_1 - \text{C}_6) - \text{アルキル} - (\text{C}_3 - \text{C}_6) - \text{シクロアルキル}$  または  $-(\text{CH}_2)_q \text{R}^{13}$  であり；あるいは

$\text{R}^{10}$  および  $\text{R}^{11}$  は結合している N 原子と一緒にあって、場合により環中に O、S および N から選択される追加のヘテロ原子を含有する 5 - または 6 - 員の飽和環を形成し、前記環 50

は未置換であるか、またはハロゲンおよび $(C_1-C_3)$ -アルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$ および $R^{14}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは $-(C_1-C_3)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルであり；

$R^{13}$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ および $NR^{11} R^{14}$ からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に5または6個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有するヘテロ芳香族基である化合物である。

10

#### 【0052】

さらに、好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-Clであり；

$R^2$ は塩素であり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は $CO_2-(C_1-C_3)$ -アルキル、またはハロゲンおよび $(C_1-C_3)$ -アルコキシからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

20

Aは $(C_1-C_4)$ -アルキレンであり；

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり、あるいは $R^5$ が $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$ 基の 1 個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_m$ 基およびAの 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒に5-または6-員の環を形成し；

$R^6$ は $CF_3$ 、 $CF_2Cl$ 、 $CFCl_2$ 、 $CBrF_2$ または $CHF_2$ であり；

$R^7$ はフェニルであり；

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

30

#### 【0053】

さらに、好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

$R^2$ はハロゲンであり；

$R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり；

$R^4$ は $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $(C_1-C_4)$ -アルキル- $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

Aは未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_{12})$ -アルキレンであり；

40

$R^5$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

$R^6$ は $CF_3$ 、 $CF_2Cl$ 、 $CFCl_2$ 、 $CBrF_2$ または $CHF_2$ であり；そして

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

#### 【0054】

特に好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

$R^2$ は塩素であり；

$R^3$ は $CF_3$ であり；

WはC-Clであり；

50

$R^4$ は $-CO_2-(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_3-C_4)$ -アルケニル、 $(C_1-C_2)$ -アルキル- $(C_3-C_4)$ -シクロアルキルまたは $(C_3-C_4)$ -シクロアルキル（より好ましくは $R^4$ は $-CO_2-(C_1-C_4)$ -アルキル）であり；

$R^5$ は $(C_1-C_2)$ -アルキルであり；

$R^6$ は $CF_3$ であり；

Aは $(C_2-C_3)$ -アルキレンであり；そして

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

#### 【0055】

他の新規な式(I)の5-置換-アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農業的に許容しうる塩は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンまたはC- $CH_3$ であり；

$R^2$ は水素、ハロゲンまたは $CH_3$ であり；

$R^3$ は $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシまたは $S(O)_p-(C_1-C_3)$ -ハロアルキルであり；

$R^4$ は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $COR^8$ であり；

Aは $(C_1-C_{12})$ -アルキレン〔好ましくは $(C_1-C_6)$ -アルキレン〕および $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレン〔好ましくは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレン〕であり、ここで2、3または4個の隣接する炭素原子は場合により未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_3-C_8)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；あるいは $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、後者2個の基のメチレン部分は $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ および $-NR^{15}$ から選択される基により置換されるが、但し、その置換基は隣接する $S(O)_m$ 基またはN原子と結合していないか、あるいは $(C_2-C_{12})$ -アルケニレンまたは $(C_2-C_{12})$ -ハロアルケニレンであり；

#### 【0056】

$R^5$ はH、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_qR^7$ 、 $-(CH_2)_qR^9$ または $NR^{10}R^{11}$ であるが、最後に挙げた基の場合、 $S(O)_m$ は $SO_2$ であり；あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -アルキニルオキシ、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニルオキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_pR^8$ 、CN、 $NO_2$ 、OH、 $COR^{10}$ 、 $NR^{10}COR^{12}$ 、 $NR^{10}SO_2R^8$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $S(O)_pR^9$ 、 $OR^7$ 、 $OR^9$ および $CO_2R^{10}$ からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいはAが $(C_1-C_{12})$ -アルキレンまたは $(C_1-C_{12})$ -ハロアルキレンであり、そして $R^5$ が1個またはそれ以上のハロゲン基により置換される $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$ の1個またはそれ以上の炭素原子は $S(O)_m$ およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒になって5-または6-員の環を形成し；

$R^6$ は $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_2-C_6)$ -アルケニル、 $(C_2-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ -アルキニルまたは $(C_2-C_6)$ -ハロアルキニルであり；

#### 【0057】

$R^7$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_pR^8$ 、 $COR^{11}$ 、 $COR^{13}$ 、 $CONR^{10}R^{11}$ 、 $SO_2NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^{10}R^{11}$ 、OH、 $SO_3H$ および $(C_1-C_6)$ -アルキリデンイミノからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシ、 $NO_2$ 、CN、 $CO_2(C_1-C_6)$ -アルキル、 $S(O)_pR^8$ 、OHおよびオキソからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

10

20

30

40

50

$R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ独立して H、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -アルケニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルケニル、 $(C_3-C_6)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -ハロアルキニル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^{13}$  または  $-(CH_2)_q R^9$  であり；あるいは

$R^{10}$  および  $R^{11}$  および  $/$  または  $R^{10}$  および  $R^{12}$  はそれぞれ結合している N 原子と一緒にあって、場合により環中に O、S および N から選択される追加のヘテロ原子を含有する 5-または 6-員の飽和環を形成し、前記環は未置換であるか、またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキルおよび  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$  および  $R^{14}$  はそれぞれ独立して H、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは  $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルであり；

$R^{13}$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$  および  $NR^{11} R^{14}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{15}$  は  $R^{11}$  または  $-(CH_2)_q R^{13}$  であり；

m、n および p はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；

q は 0 または 1 であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に 3～7 個の環原子と N、O および S からなる群より選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を有する複素環基であるものである。

#### 【0058】

好ましい式 (I) の化合物は、

$R^1$  は CN であり；

W は C-ハロゲンであり；

$R^2$  は水素またはハロゲンであり；

$R^3$  は  $CF_3$  または  $OCF_3$  であり；

$R^4$  は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $COR^8$  であり；

A は  $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、ここで 2、3 または 4 個の隣接する炭素原子は場合により未置換または  $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

$R^5$  は  $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$  および  $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいは A が  $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり、そして  $R^5$  が  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルである場合、 $R^5$  基の 1 個またはそれ以上の炭素原子は  $S(O)_m$  基および A の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって 5-または 6-員の環を形成し；

$R^6$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して  $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$  および  $NR^{11} R^{12}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^9$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキルおよび  $(C_1-C_4)$ -アルコキシからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるヘテロシクリルであり；

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は同一または異なって水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

m、n および p はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；そして

10

20

30

40

50

q は 0 または 1 である化合物である。

【0059】

他の好ましい式 (I) の化合物は、

$R^1$  は CN であり；

W は C-ハロゲンであり；

$R^2$  は水素またはハロゲンであり；

$R^3$  は  $CF_3$  または  $OCF_3$  であり；

$R^4$  は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $COR^8$  であり；

A は  $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、ここで 2、3 または 4 個の隣接する炭素原子は場合により未置換または  $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

$R^5$  は  $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ 、あるいは未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$  および  $CO_2-(C_1-C_6)$ -アルキルからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；あるいは A が  $(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキレンであり、そして  $R^5$  が 1 個またはそれ以上のハロゲン基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルである場合、 $R^5$  の 1 個またはそれ以上の炭素原子は  $S(O)_m$  および A の 1 個またはそれ以上の炭素原子と一緒に 5-または 6-員の環を形成し；

$R^6$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して  $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_6)$ -アルキル、 $(C_1-C_6)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_6)$ -アルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$  および  $NR^{10} R^{11}$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^{10}$  および  $R^{11}$  はそれぞれ独立して H、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

m、n および p はそれぞれ独立して 0、1 または 2 であり；そして

q は 0 または 1 である化合物である。

【0060】

他の好ましい式 (I) の化合物は、

$R^1$  は CN であり；

W は C-ハロゲンであり；

$R^2$  はハロゲンであり；

$R^3$  は  $CF_3$  または  $OCF_3$  であり；

$R^4$  は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは  $COR^8$  であり；

A は  $(C_1-C_9)$ -アルキレンまたは  $(C_1-C_9)$ -ハロアルキレンであり、ここで 2、3 または 4 個の隣接する炭素原子は場合により未置換または  $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_3-C_8)$ -シクロアルキル環の一部を形成し；

$R^5$  は  $(C_3-C_7)$ -シクロアルキルまたは  $-(CH_2)_q R^7$ 、あるいはハロゲン、 $(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_3-C_7)$ -シクロアルキル、 $S(O)_p R^8$ 、CN、 $NR^{10} R^{11}$  および  $S(O)_p R^7$  からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される  $(C_1-C_6)$ -アルキルであり；

$R^6$  は  $(C_1-C_2)$ -ハロアルキルであり；

$R^7$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルコキシ、CN、 $NO_2$ 、 $S(O)_p R^8$ 、 $COR^{11}$ 、 $NR^{10} R^{11}$  および OH からなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

$R^8$  は  $(C_1-C_4)$ -アルキルまたは  $(C_1-C_4)$ -ハロアルキルであり；

$R^9$  は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ -ハロアルキルおよび  $(C_1-C_4)$ -アルコキシからなる群より選択される 1 個またはそれ以上の基により置換される

10

20

30

40

50

ヘテロシクリルであり；

$R^{10}$ はH、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_4)$ -アルケニル、 $(C_3-C_4)$ -アルキニル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは $-(CH_2)_q R^{13}$ であり；あるいは

$R^{10}$ および $R^{11}$ は結合しているN原子と一緒にあって、場合により環中にO、SおよびNから選択される追加のヘテロ原子を含有する5-または6-員の飽和環を形成し、前記環は未置換であるか、またはハロゲンおよび $(C_1-C_3)$ -アルキルからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換され；

$R^{11}$ および $R^{14}$ はそれぞれ独立してH、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルまたは $-(C_1-C_3)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキルであり； 10

$R^{13}$ は未置換またはハロゲン、 $(C_1-C_3)$ -アルキル、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルキル、 $(C_1-C_3)$ -アルコキシ、 $(C_1-C_3)$ -ハロアルコキシ、CN、NO<sub>2</sub>、S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>およびNR<sup>11</sup>R<sup>14</sup>からなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換されるフェニルであり；

m、nおよびpはそれぞれ独立して0、1または2であり；

qは0または1であり；そして

上記の基のヘテロシクリルはそれぞれ独立して環中に5または6個の環原子とN、OおよびSからなる群より選択される1、2または3個のヘテロ原子を有するヘテロ芳香族基である化合物である。

#### 【0061】

20

さらに、好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-Clであり；

$R^2$ は塩素であり；

$R^3$ はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；

$R^4$ は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたはCOR<sup>8</sup>であり；

Aは $(C_1-C_4)$ -アルキレンであり；

$R^5$ は $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(CH_2)_q R^7$ または $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり、あるいは $R^5$ が $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルである場合、 $R^5$ 基の1個またはそれ以上の炭素原子はS(O)<sub>m</sub>基およびAの1個またはそれ以上の炭素原子と一緒にあって5-または6-員の環を形成し； 30

$R^6$ はCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CFCl<sub>2</sub>、CBrF<sub>2</sub>またはCHF<sub>2</sub>であり；

$R^7$ はフェニルであり；

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2であり；そして

qは0または1である化合物である。

#### 【0062】

さらに、好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり；

WはC-ハロゲンであり；

$R^2$ はハロゲンであり； 40

$R^3$ はCF<sub>3</sub>またはOCF<sub>3</sub>であり；

$R^4$ は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたはCOR<sup>8</sup>であり；

Aは未置換または $(C_1-C_6)$ -アルキルおよびハロゲンからなる群より選択される1個またはそれ以上の基により置換される $(C_1-C_{12})$ -アルキレンであり；

$R^5$ は $(C_1-C_6)$ -ハロアルキルであり；

$R^6$ はCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CFCl<sub>2</sub>、CBrF<sub>2</sub>またはCHF<sub>2</sub>であり；そして

mおよびnはそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

#### 【0063】

特に好ましい式(I)の化合物は、

$R^1$ はCNであり； 50

$R^2$ は塩素であり；  
 $R^3$ は $CF_3$ であり；  
 $W$ は $C-Cl$ であり；  
 $R^4$ は水素、 $(C_1-C_6)$ -アルキルまたは $COR^8$ であり；  
 $R^5$ は $(C_1-C_2)$ -ハロアルキルであり；  
 $R^6$ は $CF_3$ であり；

$A$ は $(C_2-C_3)$ -アルキレンであり；そして

$m$ および $n$ はそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

#### 【0064】

さらに他の新規な式(I)の5-置換-アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農業 10  
 的に許容しうる塩は、

$R^1$ は $CN$ であり； $R^2$ は塩素であり； $R^3$ は $CF_3$ または $OCF_3$ であり； $W$ は $C-Cl$ であり； $R^4$ は水素または $(C_1-C_6)$ -アルキルであり； $R^5$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルであり； $R^6$ は $CF_3$ であり；  
 $A$ は $(C_1-C_4)$ -アルキレン（好ましくは $A$ は $(C_2-C_3)$ -アルキレン）であり；そして $m$ および $n$ はそれぞれ独立して0、1または2である化合物である。

#### 【0065】

さらに、特に好ましい本発明の態様は、

$R^1$ は $CN$ であり；

$W$ は $C-Cl$ であり；

$R^2$ は塩素であり；

$R^3$ は $CF_3$ であり；

$R^4$ は水素または $(C_1-C_3)$ -アルキル（より好ましくは $R^4$ は水素またはメチル）であり；

$A$ は $-CH_2-CH_2-$ または $-CH_2CH_2-CH_2-$ であり；

$R^5$ は $(C_1-C_4)$ -アルキル（より好ましくは $R^5$ は $(C_1-C_2)$ -アルキル、最も好ましくは $R^5$ はメチル）であり；

$R^6$ は $CF_3$ であり；そして

$m$ および $n$ はそれぞれ独立して0、1または2である新規な式(I)の5-置換-アルキルアミノピラゾール誘導体またはその農業的に許容しうる塩に関する。

#### 【0066】

一般式(I)の化合物は知られている方法(すなわち、従来から使用されている、または 30  
 化学文献に記載されている方法)の適用または適合により製造することができる。

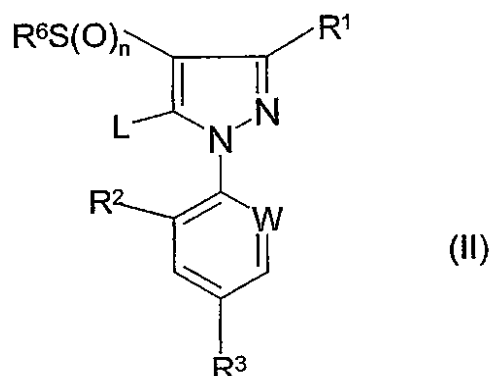
#### 【0067】

次の方法の説明において、式中の記号が特に定義されていない場合、それらは本明細書で最初になされた各記号の定義に従って「上記で定義された通り」とであると理解される。

#### 【0068】

本発明のある特徴によれば、式(I)（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^4$ および $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、そして $R^4$ は $H$ である）の化合物は式(II)：

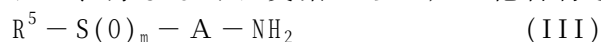
#### 【化2】



40

50

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りであり、そして $L$ は脱離基、一般にハロゲン、好ましくは臭素である)の化合物を式(III)：

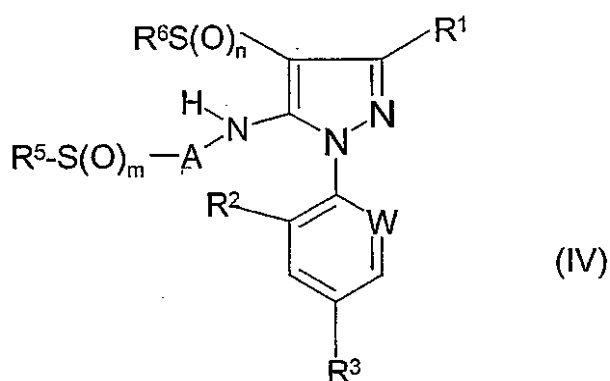


(式中、 $A$ および $m$ は上記で定義された通りであり、そして $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りである)の化合物と反応させることにより製造することができる。反応は一般に $0\sim 100^\circ\text{C}$ (好ましくは $0\sim 50^\circ\text{C}$ )の温度においてジオキサン、テトラヒドロフランまたは $N,N$ -ジメチルホルムアミドのような溶媒中、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸カリウムのような塩基の存在下で行なわれる。

#### 【0069】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ 、 $m$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^4$ は水素、 $OR^7$ 、 $OR^8$ および $OR^9$ を除いて上記で定義された通りであり、そして $R^5$ は $H$ を除いて上記で定義された通りである)の化合物もまた、相当する式(IV)：

#### 【化3】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ 、 $m$ および $n$ は上記で定義された通りであり、そして $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りである)の化合物を式(V)：

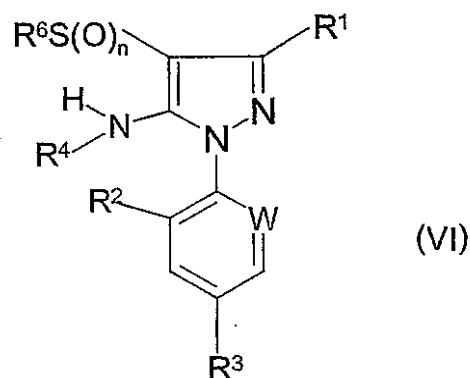


(式中、 $R^4$ は水素、 $OR^7$ 、 $OR^8$ および $OR^9$ を除いて上記で定義された通りであり、そして $L^1$ は脱離基、一般にハロゲン、好ましくはアルキル化反応の場合は塩素または沃素であり、あるいは好ましくはアシル化の場合は塩素である)の化合物でアルキル化またはアシル化することにより製造することができる。反応は一般に $0\sim 100^\circ\text{C}$ (好ましくは $0\sim 50^\circ\text{C}$ )の温度においてジオキサン、テトラヒドロフランまたは $N,N$ -ジメチルホルムアミドのような溶媒中、水素化ナトリウムのような塩基の存在下で行なわれる。

#### 【0070】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $A$ 、 $m$ および $n$ は上記で定義された通りであり、そして $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りである)の化合物もまた、式(VI)：

#### 【化4】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りである)の化合物を式(VII)：



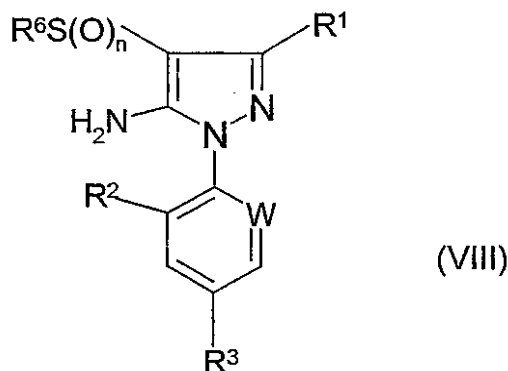
(式中、 $m$ および $A$ は上記で定義された通りであり、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、そして $L^2$ は脱離基、一般にハロゲン、好ましくは塩素である)の化合物と反応させることにより製造することができる。反応は一般に $0\sim 100^\circ\text{C}$ (好ましくは $0\sim 50^\circ\text{C}$ )の温度においてジオキサン、テトラヒドロフランまたは $N,N$ -ジメチルホルムアミドのような溶媒中、水素化ナトリウムのような塩基の存在下で行なわれる。

【0071】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $m$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、 $R^4$ は水素であり、 $m$ は0であり、そして $A$ は $-\text{CH}_2-$ である)の化合物は式(VIII)：

10

【化5】



20

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りである)の化合物をホルムアルデヒドおよび式(IX)：



(式中、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りである)の化合物の混合物と反応させることにより製造することができる。反応は $0\sim 100^\circ\text{C}$ (好ましくは $0\sim 50^\circ\text{C}$ )の温度においてジオキサン、テトラヒドロフランまたは $N,N$ -ジメチルホルムアミドのような溶媒中、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸カリウムのような塩基の存在下または不在下で行なわれる。

30

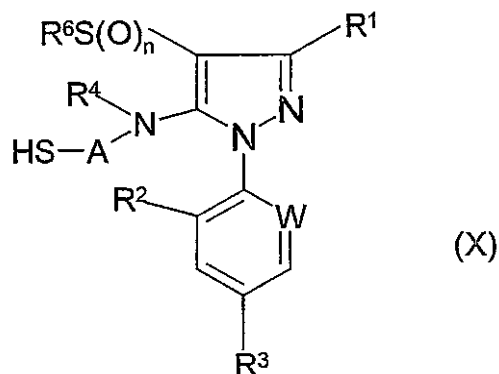
【0072】

反応混合物に水もまた存在する場合、様々な形態のホルムアルデヒド、例えばパラホルムアルデヒドを使用することができる。

【0073】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、そして $m$ は0である)の化合物は式(X)：

## 【化 6】



10

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りである)の化合物を式(XI)：



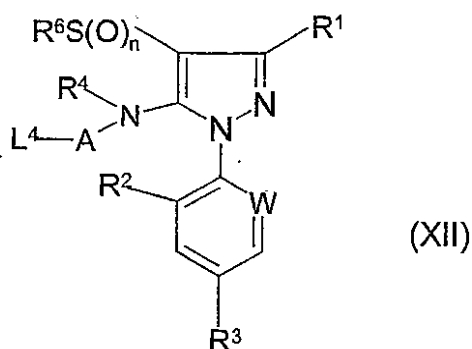
(式中、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、そして $L^3$ は脱離基、一般にハロゲン、例えば塩素またはアルキルスルホニルオキシ基である)の化合物と反応させることにより製造することができる。反応は一般に $0 \sim 60^\circ\text{C}$ の温度でテトラヒドロフランのような不活性溶媒中、式(X)の化合物のアルカリ金属塩、例えばナトリウム塩を使用して行なわれる。

20

## 【0074】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りであり、そして $m$ は0である)の化合物もまた、式(XII)：

## 【化 7】



30

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りであり、そして $L^4$ は脱離基、一般にハロゲン、例えば塩素またはアルキルスルホニルオキシ基である)の化合物を上記で定義されたような式(XI)の化合物と反応させることにより製造することができる。反応は一般に $0 \sim 60^\circ\text{C}$ の温度においてテトラヒドロフランのような不活性溶媒中、塩基、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物、またはカリウム $t$ -ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシドの存在下、あるいは $0^\circ\text{C} \sim$ 溶媒の還流温度においてアセトンのような不活性溶媒中、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩の存在下で行なわれる。

40

## 【0075】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ 、 $m$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^5$ は水素を除いて上記で定義された通りであり、そして $A$ は2個の炭素鎖が $R^5S(O)_m$ —および $-NR^4$ —基と結合する $(C_2 - C_{12})$ —アルキレンである)の化合物もまた、上記式(VI)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りである)の化合物を式(XIII)：



50

(式中、 $R^5$ および $m$ は上記で定義された通りであり、そして $A^1$ は二重結合が $R^5S(O)_m$ 基に隣接する $(C_2-C_{12})$ -アルケニル基である)の化合物と反応させることにより製造することができる。反応は一般に $0\sim 200^\circ\text{C}$ (好ましくは $0\sim 100^\circ\text{C}$ )の温度において有機溶媒中で行なわれる。

#### 【0076】

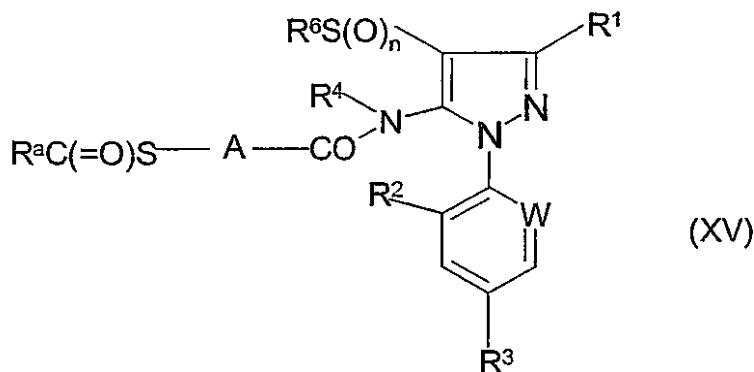
本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $A$ 、 $W$ および $n$ は上記で定義された通りであり、 $R^5$ は水素であり、そして $m$ は0である)の化合物は上記で定義されたような相当する式(XII)の化合物を式(XIV)：



(式中、 $R^a$ は $(C_1-C_6)$ -アルキルである)の化合物と反応させて式(XV)：

10

#### 【化8】



20

(式中、各記号は上記で定義された通りである)の化合物を得ることにより製造することができる。反応は一般に $0\sim 100^\circ\text{C}$ の温度においてジオキサン、テトラヒドロフランまたは $N,N$ -ジメチルホルムアミドのような溶媒中、塩基、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、またはトリエチルアミンの存在下で行なわれる。次に、式(XV)の化合物を加水分解して相当する式(I)(式中、 $R^5$ はHである)の化合物を得る。加水分解は一般に $0\sim 100^\circ\text{C}$ の温度において、一般にアルコール、例えばエタノールのような補助溶媒の存在下で水性アンモニア水のような塩基または水酸化ナトリウムのようなアルカリ金属水酸化物を使用して行なわれる。別法として、加水分解は(XV)を単離することなく系中に行なうことができる。

30

#### 【0077】

本発明の別の特徴によれば、式(I)(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $W$ および $A$ は上記で定義された通りであり、そして $m$ および/または $n$ は1または2である)の化合物は $m$ および/または $n$ が0または1である相当する化合物を酸化することにより製造することができる。酸化は一般に $0^\circ\text{C}\sim$ 溶媒の還流温度でジクロロメタンまたは1,2-ジクロロエタンのような溶媒中、3-クロロ過安息香酸のような過酸を使用して行なわれる。

#### 【0078】

上記工程により合成することができる式(I)の化合物群はまた、並行して製造することができ、これは手動で、あるいは半自動化または全自動化して行なうことができる。この場合、例えば反応、後処理、あるいは生成物または中間体の精製の手順を自動化することが可能である。全体として、これは例えばS.H.DeWittの「Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis」、第1巻、Verlag Escom、69～77頁(1997年)に記載のような手順を意味すると理解される。

40

#### 【0079】

例えばStem社、Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE(英国)および/またはH+P Labortechnik社、Bruckmannring 28, 85764 Oberschleisheim(ドイツ)またはRadleys社、Shirehill, Saffron Walden, Essex(英国)により提供されるような一連の商業的に入手できる装置は反応および後処理の並行手順で使用することができる。式(I)の化合物、または製造中に得られる中間体の並行精製において、特にクロマトグラフィー装置、

50

例えばISC0社、4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504 (米国) により提供されるものを使用することができる。

#### 【0080】

上記装置により個々の工程段階は自動化されるが、各工程段階の間に手動操作を行なう必要があるモジュラー法がもたらされる。これは問題の自動化モジュールが例えばロボットにより操作される半統合型または完全統合型自動化システムを使用することにより回避することができる。このような自動化システムは例えばZymark社、Zymark Center、Hopkinton, MA 01748 (米国) から入手できる。

#### 【0081】

ここで記載したものの他に、式(I)の化合物は固相合成法により部分的または完全に製造することができる。このために、合成法または問題の操作に適合させた合成法の各中間工程または全中間工程は合成樹脂に結合されている。固相合成法は技術文献、例えばBarry A. Buninの「The Combinatorial Index」、Academic Press (1998年) に幅広く記載されている。

#### 【0082】

固相合成法の使用は文献から知られている一連のプロトコルを可能にし、それも同様に手動で、または自動化して行なうことができる。例えば、IRORI社、11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037 (米国) から入手できる製品が使用される“ティーバッグ法”(Houghtenの米国特許第4,631,211号; HoughtenらのProc.Natl.Acad.Sci., 82, 5131~5135 (1985年))は半自動化することができる。固相並行合成法の自動化は例えばArgonaut Technologies社、887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070 (米国) またはMultiSynTech社、Wullener Feld 4, 58454 Witten (ドイツ) の装置により上手く行なわれる。

#### 【0083】

ここで記載した方法による製造はライブラリーと呼ばれる物質コレクションの形態で式(I)の化合物を与える。本発明はまた、少なくとも2個の式(I)の化合物からなるライブラリーに関する。

#### 【0084】

式(II) (式中、Lは塩素、臭素または沃素である) の中間体は知られている方法に従って、例えばEP0295117に記載のようにして、一般に0~100℃の温度で適当なハロゲン化剤、好ましくはブromoホルム、沃素または無水塩化銅の存在下、場合によりアセトニトリルまたはクロロホルムのような溶媒の存在下、亜硝酸t-ブチルのような亜硝酸アルキルを使用して相当する式(VIII)のアミンをジアゾ化することにより製造することができる。

#### 【0085】

幾つかの式(IV)および(X)の化合物は式(I)の定義に含まれ、上記方法により製造することができ、さらに他の式(IV)および(X)の化合物は知られているか、または知られている方法により製造することができる。

#### 【0086】

式(XV)の化合物は新規であり、そのため本発明の別の特徴を形成する。

式(II)、(III)、(V)、(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)、(XI)、(XII)、(XIII)および(XIV)の化合物は知られているか、または知られている方法により製造することができる。

#### 【実施例】

#### 【0087】

次の限定されない実施例により式(I)の化合物の製造を説明する。

NMRスペクトルは特に断りがなければ重水素化クロロホルム中で測定した。次の実施例において、量(百分率)は特に断りがなければ重量に基づく。

#### 実施例 1

1,4-ジオキササン(20ml)およびN、N-ジメチルホルムアミド(20ml)中における5-ブromo-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(5.0g、9.7ミリモル)の溶液に、3-エチルチオプロピルア

ミン(2.306g、19.3ミリモル)および炭酸カリウム(2.7g、19.3ミリモル)を加えた。得られた混合物を20℃で2.75時間攪拌し、一晩放置し、水およびジクロロメタンの混合物に注いだ。有機相を水で洗浄し、乾燥(硫酸ナトリウム)し、蒸発させ、ヘプタン-酢酸エチル(4:1)で溶離するシリカゲル上のクロマトグラフィーにより処理して1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-(3-エチルチオプロピルアミノ)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを黄色の固体として得た(化合物番号1-14、4.79g、収率86%)。融点80℃。

#### 【0088】

##### 実施例 2

窒素下、20℃でテトラヒドロフラン中における1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-(3-エチルチオプロピルアミノ)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(2.0g、3.6ミリモル)の溶液に水素化ナトリウム(0.461g、60%、油中、11.5ミリモル)を加え、0.5時間攪拌した。ヨードメタン(2.065g、14.4ミリモル)を加え、混合物を20℃で4.5時間攪拌し、2.5日間放置した。混合物を酢酸エチルおよび飽和塩化アンモニウム溶液に加えた。有機層を水およびブラインで洗浄し、乾燥(硫酸ナトリウム)し、蒸発させ、ヘプタン-酢酸エチル(3:1)で溶離するシリカゲル上のクロマトグラフィーにより処理して1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-[N-(3-エチルチオプロピル)-N-メチルアミノ]-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを淡褐色の固体として得た(化合物番号2-14、1.3g、収率57%)、融点89℃。

10

20

#### 【0089】

##### 実施例 3

m-クロロ過安息香酸(0.091g、77%、0.4ミリモル)を0~5℃で1、2-ジクロロエタン中における1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-[N-(3-エチルチオプロピル)-N-メチルアミノ]-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(0.23g、0.4ミリモル)の溶液に加えた。混合物を0~5℃で0.5時間攪拌し、飽和重炭酸ナトリウムおよび酢酸エチルに注いだ。有機層をブラインで洗浄し、乾燥(硫酸ナトリウム)し、蒸発させ、ヘプタン-酢酸エチル(1/1~3/7)で溶離するシリカゲル上のクロマトグラフィーにより処理して1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-[N-(エチルスルフィニルプロピル)-N-メチルアミノ]-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを淡褐色の油状物として得た(化合物番号2-15、0.186g、71%)。19F: -63.8、-78.7。

30

#### 【0090】

##### 実施例 4

水素化ナトリウム(0.172g、4.3ミリモル)を氷水浴で冷却したテトラヒドロフラン中における1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-N-メチルアミノ-4-トリフルオロメチルチオピラゾール(1.5g、3.4ミリモル)の溶液に加えた。氷浴を取り除き、混合物を20℃で0.75時間攪拌し、クロロメチルメチルスルフィド(0.456g、4.5ミリモル)を加えた。混合物を20℃で6.5時間攪拌し、2時間加熱還流し、冷却し、飽和塩化アンモニウムおよび酢酸エチルに加えた。有機層を水およびブラインで洗浄し、乾燥(硫酸ナトリウム)し、蒸発させ、ヘプタン-酢酸エチル(9:1)で溶離するシリカゲル上のクロマトグラフィーにより処理して1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-[N-メチル-N-(メチルチオメチル)アミノ]-4-トリフルオロメチルチオピラゾールを淡黄色の油状物として得た(化合物番号2-25、0.59g、収率35%)。19F: -43.9、-63.7。

40

#### 【0091】

##### 実施例 5

水素化ナトリウム(0.032g、60%、0.8ミリモル)を窒素下、20℃でテトラヒドロフラン中における1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-(3-エチルチオプロピルアミノ)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(0.3g、0.54ミ

50

リモル)の溶液に加えた。混合物を20℃で1時間攪拌し、エチルクロロホルメート(0.121g、1.1ミリモル)を加えた。混合物を20℃で5時間攪拌し、飽和塩化アンモニウムおよび酢酸エチルに注いだ。有機層を水およびブラインで洗浄し、乾燥(硫酸ナトリウム)し、蒸発させ、ヘプタン-酢酸エチル(4:1)で溶離するシリカゲル上のクロマトグラフィーにより精製して1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-[N-エトキシカルボニル-N-(3-エチルチオプロピル)アミノ]-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを油状物として得た(化合物番号3-14、0.278g、収率81%)。19F: -63.9; -77.9。

#### 【0092】

##### 実施例6

テトラヒドロフラン中における3-シアノ-5-メチルアミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(0.5g、1.1ミリモル)の溶液に水素化ナトリウム(60%、0.06g、1.4ミリモル)、次に2-クロロエチルフェニルスルホン(0.27g、1.3ミリモル)を加えた。混合物を10時間加熱還流した。抽出処理し、ヘプタン-酢酸エチル(1:1)を使用するカラムクロマトグラフィーにより処理した後、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-N-(2-フェニルスルホニルエチル)-N-メチルアミノ-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールを得た(化合物番号2-38、0.26g)。19F: -64.1; -73.0。

#### 【0093】

##### 実施例7

テトラヒドロフラン中における1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-(2-フェニルチオエチル)アミノ-4-トリフルオロメチルチオピラゾール(0.15g、0.27ミリモル)の溶液にエチルクロロホルメート(58mg、0.54ミリモル)、ジイソプロピルエチルアミン(70mg、0.54ミリモル)および4-ジメチルアミノピリジン(10mg)を加えた。混合物を1時間加熱還流した。抽出処理し、ヘプタン-酢酸エチル(1:1)を使用するカラムクロマトグラフィーにより処理した後、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-5-N-(2-フェニルチオエチル)-N-エトキシカルボニルアミノ-4-トリフルオロメチルチオピラゾールを得た(化合物番号3-109、0.07g)。19F: -63.7; -70.8。

#### 【0094】

次の参照例により上記実施例の合成に使用される中間体の製造を説明する。

##### 参照例1

亜硝酸t-ブチル(84ml、0.662モル)をブロモホルム(320ml)中における5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール(100g、0.221モル)の懸濁液に加えた。得られた混合物を60~70℃に3時間加熱した。追加の亜硝酸t-ブチル(84ml、0.662モル)を加え、混合物をさらに2.5時間60~70℃で加熱した。次に、それを冷却し、ヘキサン、ヘキサントルエンで洗浄し、ろ過した。固体をペンタンで洗浄し、真空乾燥して5-ブロモ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-シアノ-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールを黄色の固体として得た(96.69g、収率79%)。融点142℃。

#### 【0095】

次の表I~XIIに示される好ましい化合物もまた本発明の一部を形成し、上記実施例1~7または上記一般法に従って、または同様にして製造した、または製造することができる。

表中、Etはエチルを意味し、i-Prはイソプロピルを意味し、n-Buはn-ブチルを意味し、t-Buはt-ブチルを意味し、Phはフェニルを意味し、そして2-THFは2-テトラヒドロフリルを意味する。原子の後の下付きが省略されている場合、それらは意図的なものであり、例えばCH3はCH<sub>3</sub>を意味する。19F-NMRスペクトルのシフト値はppmで示す。化合物番号は単に参考のために付与する。

#### 【0096】

置換基が次の意味を有する式(I)の化合物：

【表1】

表 I :  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{水素}$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$

| 化合物番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点(°C),または<br>NMR(ppm) |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|------------------------|
| 1-1   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                        |
| 1-2   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 105-106                |
| 1-3   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                        |
| 1-4   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 161-164                |
| 1-5   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 1 | 190-191                |
| 1-6   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                        |
| 1-7   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                        |
| 1-8   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 121-122                |
| 1-9   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 140-141                |
| 1-10  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 183-184                |
| 1-11  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                        |
| 1-12  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                        |
| 1-13  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |                        |
| 1-14  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 80                     |

10

20

【0097】

【表 2】

(表 I 続き)

| 化合物番号 | A                                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点(°C),または<br>NMR(ppm)        |
|-------|-----------------------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|-------------------------------|
| 1-15  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 118                           |
| 1-16  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 | 油状物                           |
| 1-17  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 | 137                           |
| 1-18  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 1-19  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 86                            |
| 1-20  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 0 |                               |
| 1-21  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロヘキシル                         | 0 |                               |
| 1-22  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | i-Pr                            | 0 | 168.5                         |
| 1-23  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |                               |
| 1-24  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 1-25  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 1-26  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 1-27  | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 1-28  | CH <sub>2</sub>                                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 1-29  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 1-30  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 1-31  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 1-32  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | t-Bu                            | 2 |                               |
| 1-33  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | t-Bu                            | 2 |                               |
| 1-34  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Et                              | 2 | 132                           |
| 1-35  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 172                           |
| 1-36  | 3- テトラヒドロチエニル                                                   |                   |                                 | 2 | 130-135                       |
| 1-37  | 3- テトラヒドロチエニルスルホキシド                                             |                   |                                 | 2 | <sup>19</sup> F: -63.8, -79.8 |
| 1-38  | 3- テトラヒドロチエニルスルホン                                               |                   |                                 | 2 | <sup>19</sup> F: -63.2, -79.9 |
| 1-39  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 | 162                           |
| 1-40  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 | 156                           |
| 1-41  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 | 165                           |
| 1-42  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | Ph                              | 1 | <sup>19</sup> F: -64.2; -74.0 |
| 1-43  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | Ph                              | 0 | <sup>19</sup> F: -45.4; -63.6 |
| 1-44  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 1 | <sup>19</sup> F: -64.2; -74.0 |
| 1-45  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 1-46  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 1-47  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 1-48  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 2 |                               |
| 1-49  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | Ph                              | 2 |                               |
| 1-50  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | Ph                              | 0 |                               |
| 1-51  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | Ph                              | 1 |                               |
| 1-52  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | Ph                              | 2 |                               |
| 1-53  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 0 |                               |
| 1-54  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 1 |                               |
| 1-55  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph              | 0 |                               |
| 1-56  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph              | 1 |                               |
| 1-57  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロプロピル                         | 0 |                               |
| 1-58  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロブチル                          | 0 |                               |
| 1-59  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |                               |
| 1-60  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | アリル                             | 0 |                               |
| 1-61  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>                | 0 |                               |
| 1-62  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>                | 0 |                               |

【表 3】  
(表 I 続き)

| 化合物番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                 | n | 融点(°C),または<br>NMR(ppm) |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------|--------------------|---|------------------------|
| 1-63  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                        |
| 1-64  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                        |
| 1-65  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 0 |                        |
| 1-66  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                        |
| 1-67  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 2 |                        |
| 1-68  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 0 |                        |
| 1-69  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                        |
| 1-70  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 2 |                        |
| 1-71  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 0 |                        |
| 1-72  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 1 |                        |
| 1-73  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 2 |                        |
| 1-74  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 0 |                        |
| 1-75  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 1 |                        |
| 1-76  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 2 |                        |
| 1-77  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 0 |                        |
| 1-78  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 1 |                        |
| 1-79  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 2 |                        |
| 1-80  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 0 |                        |
| 1-81  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-82  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-83  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-84  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 0 |                        |
| 1-85  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 0 |                        |
| 1-86  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 0 |                        |
| 1-87  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 1 |                        |
| 1-88  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 1 |                        |
| 1-89  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 |                        |
| 1-90  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 2 |                        |
| 1-91  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                        |
| 1-92  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 2 |                        |
| 1-93  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | S                 | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-94  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | S                 | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-95  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | S                 | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |
| 1-96  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO                | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-97  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-98  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO                | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |
| 1-99  | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-100 | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-101 | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |
| 1-102 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-103 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-104 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |
| 1-105 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-106 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-107 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |
| 1-108 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                        |
| 1-109 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                        |
| 1-110 | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 2 |                        |

【表 4】  
(表 I 続き)

| 化合物番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                 | n | 融点(°C),または<br>NMR(ppm) |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------|--------------------|---|------------------------|
| 1-111 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 0 |                        |
| 1-112 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 1 |                        |
| 1-113 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 2 |                        |
| 1-114 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 1 |                        |
| 1-115 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                        |
| 1-116 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                        |
| 1-117 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 0 |                        |
| 1-118 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 |                        |
| 1-119 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 2 |                        |
| 1-120 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                        |
| 1-121 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                        |
| 1-122 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                        |
| 1-123 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                        |
| 1-124 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                        |
| 1-125 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                        |
| 1-126 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                        |
| 1-127 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                        |
| 1-128 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                        |

10

20

【0100】

【表 5】

表 II :  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{CH}_3$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$

| 化合物番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点 (°C);<br>NMR(ppm)          |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|-------------------------------|
| 2-1   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 2-2   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 81                            |
| 2-3   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 142                           |
| 2-4   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 148                           |
| 2-5   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 1 | 55.5                          |
| 2-6   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 2-7   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 2-8   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 94-95                         |
| 2-9   | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 106-107                       |
| 2-10  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 160-161                       |
| 2-11  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 2-12  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 2-13  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 2-14  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 89                            |
| 2-15  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | <sup>19</sup> F: -63.8, -78.7 |
| 2-16  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 2-17  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 | 103                           |
| 2-18  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 2-19  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 | 103                           |
| 2-20  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 0 |                               |
| 2-21  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | シクロヘキシル                         | 0 |                               |
| 2-22  | CH <sub>2</sub>                                 | S                 | i-Pr                            | 0 |                               |
| 2-23  | CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |                               |
| 2-24  | CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2 |                               |

10

20

【0 1 0 1】

30

【表 6】

(表II続き)

| 化合物番号 | A            | S(O) <sub>m</sub> | R5     | n | 融点 (°C);<br>NMR(ppm) |
|-------|--------------|-------------------|--------|---|----------------------|
| 2-25  | CH2          | S                 | CH3    | 0 | 19F: -43.9, -63.7    |
| 2-26  | CH2          | S                 | CH3    | 1 | 19F: -63.7, -71.9    |
| 2-27  | CH2          | S                 | CH3    | 2 | 19F: -63.8, -78.6    |
| 2-28  | CH2          | SO                | CH3    | 2 |                      |
| 2-29  | CH2CH2CH2CH2 | S                 | CH3    | 2 |                      |
| 2-30  | CH2CH2CH2CH2 | SO                | CH3    | 0 |                      |
| 2-31  | CH2CH2CH2CH2 | S                 | CH2CH3 | 1 |                      |
| 2-32  | CH2CH2CH2    | S                 | t-Bu   | 2 |                      |
| 2-33  | CH2CH2CH2    | SO                | t-Bu   | 2 |                      |
| 2-34  | CH2CH2       | SO                | CH2CH3 | 2 | 19F: -63.8, -78.6    |
| 2-35  | CH2CH2       | SO2               | CH2CH3 | 2 | 19F: -63.8, -78.7    |
| 2-36  | CH2CH2CH2    | SO2               | CH2CH3 | 2 | 19F: -63.8, -78.6    |
| 2-37  | CH2CH2       | SO2               | Ph     | 0 | 157                  |
| 2-38  | CH2CH2       | SO2               | Ph     | 1 | 19F: -64.1; -73.0    |
| 2-39  | CH2CH2       | SO2               | Ph     | 2 |                      |
| 2-40  | CH2CH2       | S                 | Ph     | 0 |                      |
| 2-41  | CH2CH2       | S                 | Ph     | 1 |                      |
| 2-42  | CH2CH2       | S                 | Ph     | 2 |                      |
| 2-43  | CH2CH2       | SO                | Ph     | 0 |                      |
| 2-44  | CH2CH2       | SO                | Ph     | 1 |                      |
| 2-45  | CH2CH2       | SO                | Ph     | 2 |                      |
| 2-46  | CH2CH2       | SO2               | CH2Ph  | 0 |                      |
| 2-47  | CH2CH2       | SO2               | CH2Ph  | 1 |                      |
| 2-48  | CH2CH2       | SO2               | CH2Ph  | 2 |                      |
| 2-49  | CH2CH2       | SO                | CH2Ph  | 0 |                      |
| 2-50  | CH2CH2       | SO                | CH2Ph  | 1 |                      |
| 2-51  | CH2CH2       | SO                | CH2Ph  | 2 |                      |
| 2-52  | CH2CH2       | S                 | CH2Ph  | 0 |                      |
| 2-53  | CH2CH2       | S                 | CH2Ph  | 1 |                      |
| 2-54  | CH2CH2       | S                 | CH3    | 1 |                      |
| 2-55  | CH2CH2       | SO                | CH3    | 0 | 88                   |
| 2-56  | CH2CH2       | SO2               | CH3    | 0 | 118-120              |
| 2-57  | CH2CH2       | SO2               | CH3    | 1 | 130-132              |
| 2-58  | CH2CH2CH2    | SO                | CH3    | 1 |                      |
| 2-59  | CH2CH2CH2    | SO2               | CH3    | 0 |                      |
| 2-60  | CH2CH2CH2    | SO2               | CH3    | 1 |                      |
| 2-61  | CH(CH3)CH2   | S                 | CH3    | 0 |                      |
| 2-62  | CH(CH3)CH2   | S                 | CH3    | 1 |                      |
| 2-63  | CH(CH3)CH2   | S                 | CH3    | 2 |                      |
| 2-64  | CH(CH3)CH2   | SO                | CH3    | 0 |                      |
| 2-65  | CH(CH3)CH2   | SO                | CH3    | 1 |                      |
| 2-66  | CH(CH3)CH2   | SO                | CH3    | 2 |                      |
| 2-67  | CH(CH3)CH2   | SO2               | CH3    | 0 |                      |
| 2-68  | CH(CH3)CH2   | SO2               | CH3    | 1 |                      |
| 2-69  | CH(CH3)CH2   | SO2               | CH3    | 2 |                      |
| 2-70  | CH2CH(CH3)   | S                 | CH3    | 0 |                      |
| 2-71  | CH2CH(CH3)   | S                 | CH3    | 1 |                      |
| 2-72  | CH2CH(CH3)   | S                 | CH3    | 2 |                      |

【表 7】  
(表II続き)

| 化合物番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                 | n | 融点 (°C);<br>NMR(ppm) |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------|--------------------|---|----------------------|
| 2-73  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 0 |                      |
| 2-74  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                      |
| 2-75  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 2 |                      |
| 2-76  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                      |
| 2-77  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                      |
| 2-78  | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 2 |                      |
| 2-79  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 0 |                      |
| 2-80  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 0 |                      |
| 2-81  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                      |
| 2-82  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                      |
| 2-83  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 0 |                      |
| 2-84  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                      |
| 2-85  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 2 |                      |
| 2-86  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 0 | 19F: -44.40, -63.71  |
| 2-87  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                      |
| 2-88  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 2 |                      |
| 2-89  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 0 |                      |
| 2-90  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 1 |                      |
| 2-91  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 2 |                      |
| 2-92  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 0 |                      |
| 2-93  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 1 |                      |
| 2-94  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 2 |                      |
| 2-95  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 0 |                      |
| 2-96  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 1 |                      |
| 2-97  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 2 |                      |
| 2-98  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 0 |                      |
| 2-99  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 1 |                      |
| 2-100 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 2 |                      |
| 2-101 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 0 |                      |
| 2-102 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 1 |                      |
| 2-103 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 2 |                      |
| 2-104 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 1 |                      |
| 2-105 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                      |
| 2-106 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                      |
| 2-107 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 0 |                      |
| 2-108 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 |                      |
| 2-109 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 2 |                      |
| 2-110 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                      |
| 2-111 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                      |
| 2-112 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                      |
| 2-113 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                      |
| 2-114 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                      |
| 2-115 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                      |
| 2-116 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                      |
| 2-117 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                      |
| 2-118 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                      |

10

20

30

40

【表 8】

表III:  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$ 

| 化合物<br>番号 | A                                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                                | n | 融点 (°C) NMR(ppm)                            |
|-----------|-----------------------------------------------------------------|-------------------|-----------------------------------|---|---------------------------------------------|
| 3-1       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 0 | <sup>19</sup> F: -41.8; -63.8               |
| 3-2       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | <sup>19</sup> F: -63.8; -77.7               |
| 3-3       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | <sup>19</sup> F: -63.8, -63.9, -77.4, -77.6 |
| 3-4       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 152                                         |
| 3-5       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H | 1 |                                             |
| 3-6       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-7       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 |                                             |
| 3-8       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 82                                          |
| 3-9       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | <sup>19</sup> F: -63.7; -63.8; -77.5        |
| 3-10      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 124-127                                     |
| 3-11      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-12      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 0 |                                             |
| 3-13      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 1 |                                             |
| 3-14      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 2 | <sup>19</sup> F: -63.9; -77.9               |
| 3-15      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 2 |                                             |
| 3-16      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 0 |                                             |
| 3-17      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph                | 2 |                                             |
| 3-18      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 0 |                                             |
| 3-19      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 2 | <sup>19</sup> F: -63.8; -77.7               |
| 3-20      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                                | 0 |                                             |
| 3-21      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロヘキシル                           | 0 |                                             |
| 3-22      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | i-Pr                              | 0 |                                             |
| 3-23      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | シクロペンチル                           | 0 |                                             |
| 3-24      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | 2 |                                             |
| 3-25      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-26      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 |                                             |
| 3-27      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 |                                             |
| 3-28      | CH <sub>2</sub>                                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 2 |                                             |
| 3-29      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 |                                             |
| 3-30      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-31      | CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>               | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | 1 |                                             |
| 3-32      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | t-Bu                              | 2 |                                             |
| 3-33      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | t-Bu                              | 2 |                                             |
| 3-34      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 134-136                                     |
| 3-35      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 0 | <sup>19</sup> F: -41.9; -63.8               |
| 3-36      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 152-154                                     |
| 3-37      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 0 | 132-135                                     |
| 3-38      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | <sup>19</sup> F: -63.8; -70.8               |
| 3-39      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 1 |                                             |
| 3-40      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-41      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                   | 1 |                                             |
| 3-42      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>                             | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |
| 3-43      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>                             | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 |                                             |
| 3-44      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>                             | S                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 |                                             |
| 3-45      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>                             | SO                | CH <sub>3</sub>                   | 0 |                                             |

【表 9】  
(表III続き)

| 化合物<br>番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                 | n | 融点 (°C) NMR(ppm) |
|-----------|-------------------------------------------------|-------------------|--------------------|---|------------------|
| 3-46      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                  |
| 3-47      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO                | CH <sub>3</sub>    | 2 |                  |
| 3-48      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                  |
| 3-49      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                  |
| 3-50      | CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>             | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 2 |                  |
| 3-51      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 0 |                  |
| 3-52      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 1 |                  |
| 3-53      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | S                 | CH <sub>3</sub>    | 2 |                  |
| 3-54      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 0 |                  |
| 3-55      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 1 |                  |
| 3-56      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO                | CH <sub>3</sub>    | 2 |                  |
| 3-57      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 0 |                  |
| 3-58      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 1 |                  |
| 3-59      | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )            | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>    | 2 |                  |
| 3-60      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 0 |                  |
| 3-61      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 0 |                  |
| 3-62      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                  |
| 3-63      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                  |
| 3-64      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 0 |                  |
| 3-65      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 1 |                  |
| 3-66      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NMe <sub>2</sub>   | 2 |                  |
| 3-67      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 0 |                  |
| 3-68      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 1 |                  |
| 3-69      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | NEt <sub>2</sub>   | 2 |                  |
| 3-70      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 0 |                  |
| 3-71      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 1 |                  |
| 3-72      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-iPr <sub>2</sub> | 2 |                  |
| 3-73      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 0 |                  |
| 3-74      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 1 |                  |
| 3-75      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-nBu <sub>2</sub> | 2 |                  |
| 3-76      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 0 |                  |
| 3-77      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 1 |                  |
| 3-78      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピロリジニル           | 2 |                  |
| 3-79      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 0 |                  |
| 3-80      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 1 |                  |
| 3-81      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | N-ピペリジニル           | 2 |                  |
| 3-82      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 0 |                  |
| 3-83      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 1 |                  |
| 3-84      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | Ph                 | 2 |                  |
| 3-85      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 1 |                  |
| 3-86      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                  |
| 3-87      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | Ph                 | 2 |                  |
| 3-88      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 0 |                  |
| 3-89      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 |                  |
| 3-90      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 2 |                  |
| 3-91      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                  |
| 3-92      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                  |
| 3-93      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                  |

【表 10】

(表III続き)

| 化合物<br>番号 | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                 | n | 融点 (°C) NMR(ppm)              |
|-----------|-------------------------------------------------|-------------------|--------------------|---|-------------------------------|
| 3-94      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                               |
| 3-95      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                               |
| 3-96      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                               |
| 3-97      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                               |
| 3-98      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                               |
| 3-99      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                               |
| 3-100     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 |                               |
| 3-101     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 2 |                               |
| 3-102     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | Ph                 | 0 | <sup>19</sup> F: -42.4; -64.2 |
| 3-103     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | Ph                 | 1 |                               |
| 3-104     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | Ph                 | 2 |                               |
| 3-105     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | Ph                 | 0 |                               |
| 3-106     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | Ph                 | 1 |                               |
| 3-107     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | Ph                 | 2 |                               |
| 3-108     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                               |
| 3-109     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                 | 1 | <sup>19</sup> F: -63.7; -70.8 |
| 3-110     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                               |
| 3-111     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                               |
| 3-112     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                               |
| 3-113     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> Ph | 2 |                               |
| 3-114     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 0 |                               |
| 3-115     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph | 1 |                               |

10

20

【0106】

【表 1 1】

表 IV :  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$

| 化合物<br>番号 | A                                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点 (°C) または<br>NMR(ppm) -     |
|-----------|-----------------------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|-------------------------------|
| 4-1       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 4-2       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | <sup>19</sup> F: -63.7; -78.6 |
| 4-3       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-4       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-5       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 4-6       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 4-7       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 4-8       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-9       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 | <sup>19</sup> F: -63.7, -78.6 |
| 4-10      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-11      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 4-12      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 4-13      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 4-14      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 4-15      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 4-16      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 4-17      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 |                               |
| 4-18      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 4-19      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 4-20      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 0 |                               |
| 4-21      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロヘキシル                         | 0 |                               |
| 4-22      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | i-Pr                            | 0 |                               |
| 4-23      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |                               |
| 4-24      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 4-25      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 4-26      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |                               |
| 4-27      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-28      | CH <sub>2</sub>                                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-29      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |                               |
| 4-30      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |                               |
| 4-31      | CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>               | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 4-32      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | t-Bu                            | 2 |                               |
| 4-33      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | t-Bu                            | 2 |                               |

【表 1 2】

表 V :  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{H}$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{OCF}_3$ 

| 化合物<br>番号 | A                                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|--------|
| 5-1       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |        |
| 5-2       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 93     |
| 5-3       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-4       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-5       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 1 |        |
| 5-6       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |        |
| 5-7       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |        |
| 5-8       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 80     |
| 5-9       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-10      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-11      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |        |
| 5-12      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |        |
| 5-13      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |        |
| 5-14      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |        |
| 5-15      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |        |
| 5-16      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |        |
| 5-17      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 |        |
| 5-18      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |        |
| 5-19      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |        |
| 5-20      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 0 |        |
| 5-21      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロヘキシル                         | 0 |        |
| 5-22      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | i-Pr                            | 0 |        |
| 5-23      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |        |
| 5-24      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2 |        |
| 5-25      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |        |
| 5-26      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |        |
| 5-27      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-28      | CH <sub>2</sub>                                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-29      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |        |
| 5-30      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |        |
| 5-31      | CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>               | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |        |
| 5-32      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | t-Bu                            | 2 |        |
| 5-33      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | t-Bu                            | 2 |        |

【表 1 3】

表 VI :  $R^1 = \text{CN}$ ,  $R^6 = \text{CF}_3$ ,  $R^4 = \text{CH}_3$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{OCF}_3$ 

| 化合物<br>番号 | A                                                               | S(O) <sub>m</sub> | R5                              | n | 融点 (°C) |
|-----------|-----------------------------------------------------------------|-------------------|---------------------------------|---|---------|
| 6-1       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |         |
| 6-2       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 98      |
| 6-3       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-4       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-5       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 1 |         |
| 6-6       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |         |
| 6-7       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |         |
| 6-8       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 | 79      |
| 6-9       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-10      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-11      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |         |
| 6-12      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |         |
| 6-13      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |         |
| 6-14      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |         |
| 6-15      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |         |
| 6-16      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |         |
| 6-17      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> Ph              | 2 |         |
| 6-18      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0 |         |
| 6-19      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2 |         |
| 6-20      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO <sub>2</sub>   | Ph                              | 0 |         |
| 6-21      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S                 | シクロヘキシル                         | 0 |         |
| 6-22      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | i-Pr                            | 0 |         |
| 6-23      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | シクロペンチル                         | 0 |         |
| 6-24      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2 |         |
| 6-25      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 0 |         |
| 6-26      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 1 |         |
| 6-27      | CH <sub>2</sub>                                                 | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-28      | CH <sub>2</sub>                                                 | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-29      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub>                 | 2 |         |
| 6-30      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub>                 | 0 |         |
| 6-31      | CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>               | S                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1 |         |
| 6-32      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | t-Bu                            | 2 |         |
| 6-33      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | t-Bu                            | 2 |         |

【表 1 4】

表VII :  $R^5 = \text{Me}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $W = \text{C-Cl}$ ;  $R^3 = \text{CF}_3$ 

| 化合物No. | $R^1$           | $R^6$              | $R^4$           | n | A                                               | $S(O)_m$ | 融点 (°C) |
|--------|-----------------|--------------------|-----------------|---|-------------------------------------------------|----------|---------|
| 7-1    | CN              | CClF <sub>2</sub>  | H               | 2 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        |         |
| 7-2    | CN              | CCl <sub>2</sub> F | H               | 1 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S        |         |
| 7-3    | CN              | CHF <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S        |         |
| 7-4    | CN              | CBrF <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | 0 | CH <sub>2</sub>                                 | S        |         |
| 7-5    | CF <sub>3</sub> | CClF <sub>2</sub>  | H               | 2 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        |         |
| 7-6    | CF <sub>3</sub> | CCl <sub>2</sub> F | H               | 1 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S        |         |
| 7-7    | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S        |         |
| 7-8    | CF <sub>3</sub> | CBrF <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | 0 | CH <sub>2</sub>                                 | S        |         |
| 7-9    | CN              | CH <sub>3</sub>    | CH <sub>3</sub> | 1 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        |         |
| 7-10   | CN              | CH <sub>3</sub>    | H               | 1 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        |         |

10

【0 1 1 0】

【表 1 5】

表VIII :  $R^1 = \text{CN}$ ;  $R^2 = \text{Cl}$ ;  $W = \text{C-Cl}$ ;  $R^3 = \text{CF}_3$ ;  $R^5 = \text{CH}_3$ 

| 化合物<br>番号 | $R^4$                                            | A                                                               | $S(O)_m$ | n | $R^6$           | 融点 (°C)<br>NMR    |
|-----------|--------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------|----------|---|-----------------|-------------------|
| 8-1       | CO <sub>2</sub> Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 135               |
| 8-2       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 98                |
| 8-3       | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.6, -78.1 |
| 8-4       | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.7, -77.4 |
| 8-5       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -67.7, -78.3 |
| 8-6       | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -64.1, -78.7 |
| 8-7       | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | Solid             |
| 8-8       | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.9, -78.2 |
| 8-9       | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -64.1, -78.9 |
| 8-10      | シクロプロピル                                          | CH <sub>2</sub>                                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 134               |
| 8-11      | シクロプロピル                                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 151               |
| 8-12      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.7, -78.3 |
| 8-13      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 147               |
| 8-14      | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -64.1, -78.7 |
| 8-15      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.7, -78.3 |
| 8-16      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 124               |
| 8-17      | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -64.1, -78.7 |
| 8-18      | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                          | CH <sub>2</sub>                                                 | S        | 0 | CF <sub>3</sub> | 19F: -43.3, -63.9 |
| 8-19      | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 1 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.7, -71.9 |
| 8-20      | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                          | CH <sub>2</sub>                                                 | S        | 2 | CF <sub>3</sub> | 19F: -64.7, -78.6 |
| 8-21      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 1 | CF <sub>3</sub> | 101               |
| 8-22      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | S        | 1 | CF <sub>3</sub> | 19F: -63.7, -72.1 |
| 8-23      | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                                 | SO       | 2 | CF <sub>3</sub> | 152               |

20

30

40

【0 1 1 1】

【表 16】

(表VIII続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                                  | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | n | R <sup>6</sup>     | 融点(°C)<br>NMR   |
|-----------|-------------------------------------------------|-------------------------------------------------|-------------------|---|--------------------|-----------------|
| 8-24      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 1 | CF <sub>3</sub>    | 19F:-63.6,-78.3 |
| 8-25      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 103-106         |
| 8-26      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 117-120         |
| 8-27      | シクロブチル                                          | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-28      | CH <sub>2</sub> C≡CH                            | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-29      | CH <sub>2</sub> C≡CH                            | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 89-92           |
| 8-30      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | 2 | CF <sub>2</sub> H  |                 |
| 8-31      | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>2</sub> Cl |                 |
| 8-32      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | 1 | CFCI <sub>2</sub>  |                 |
| 8-33      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 0 | CF <sub>2</sub> Br |                 |
| 8-34      | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | 2 | CF <sub>2</sub> Cl |                 |
| 8-35      | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>2</sub> Cl |                 |
| 8-36      | CH <sub>2</sub> シクロプロピル                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>2</sub> H  |                 |
| 8-37      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>2</sub> Br |                 |
| 8-38      | CH <sub>2</sub> C≡CH                            | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | 1 | CF <sub>2</sub> Cl |                 |
| 8-39      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 2 | CF <sub>2</sub> Cl |                 |
| 8-40      | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 2 | CF <sub>3</sub>    | 19F:-64.2,-78.8 |
| 8-41      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 2 | CF <sub>3</sub>    | 155             |
| 8-42      | シクロプロピル                                         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | 2 | CF <sub>3</sub>    | 164-166         |
| 8-43      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 0 | CF <sub>3</sub>    | 135             |
| 8-44      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 127             |
| 8-45      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 19F:-64.2,-80.9 |
| 8-46      | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-47      | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    | 140             |
| 8-48      | OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 135             |
| 8-49      | OPh                                             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-50      | O(3-ピリジル)                                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-51      | CO(2-THF)                                       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-52      | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 1 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-53      | OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | 2 | CF <sub>3</sub>    | 137             |
| 8-54      | OCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 2 | CF <sub>3</sub>    | 159             |
| 8-55      | COCH <sub>2</sub> OEt                           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 1 | CF <sub>3</sub>    | 52              |
| 8-56      | COCH <sub>2</sub> OEt                           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 2 | CF <sub>3</sub>    | 19F:-64.3,-81.0 |
| 8-57      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 2 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-58      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | 0 | CF <sub>3</sub>    |                 |
| 8-59      | COCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | 0 | CF <sub>3</sub>    | ゴム状物            |
| 8-60      | CO-(2-THF)                                      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | 2 | CF <sub>3</sub>    |                 |

【0112】

【表 17】

表IX :  $R^1 = \text{CN}$ ;  $R^2 = \text{Cl}$ ;  $W = \text{C-Cl}$ ;  $R^3 = \text{CF}_3$ ;  $R^6 = \text{CF}_3$ :

| 化合物<br>番号 | $R^4$                              | A                                   | $\text{S(O)}_m$ | $R^5$         | n | 融点 ( $^{\circ}\text{C}$ ); または<br>NMR (ppm) |
|-----------|------------------------------------|-------------------------------------|-----------------|---------------|---|---------------------------------------------|
| 9-1       | $\text{COOnC}_4\text{H}_9$         | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | Ph            | 0 | $^{19}\text{F}$ : -42.2;-63.7               |
| 9-2       | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | Ph            | 0 | $^{19}\text{F}$ : -42.5;-64.2               |
| 9-3       | $\text{COOPh}$                     | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | Ph            | 1 |                                             |
| 9-4       | $\text{COO-(4-OMe-Ph)}$            | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 2 | $^{19}\text{F}$ : -63.7;-77.5               |
| 9-5       | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-6       | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-7       | $\text{CH}_2$ シクロプロピル              | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-8       | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-9       | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-10      | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 | 141                                         |
| 9-11      | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-12      | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-13      | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-14      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-15      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-16      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-17      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-18      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-19      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-20      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-21      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-22      | $\text{COOnPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-23      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-24      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-25      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-26      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-27      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-28      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-29      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-30      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-31      | $\text{COOiPr}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-32      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-33      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-34      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | S               | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-35      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-36      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-37      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | SO              | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-38      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-39      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |
| 9-40      | $\text{COOnBu}$                    | $\text{CH}_2\text{CH}_2$            | $\text{SO}_2$   | $\text{CH}_3$ | 2 |                                             |
| 9-41      | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ | S               | $\text{CH}_3$ | 0 |                                             |
| 9-42      | $\text{COOCH}_3$                   | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ | S               | $\text{CH}_3$ | 1 |                                             |

【表 18】

(表IX 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>        | A                                               | S(O) <sub>m</sub> | R <sup>5</sup>  | n | 融点 (°C); または<br>NMR (ppm) |
|-----------|-----------------------|-------------------------------------------------|-------------------|-----------------|---|---------------------------|
| 9-43      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-44      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-45      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-46      | CH <sub>2</sub> C≡CH  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-47      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-48      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-49      | COOCH <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-50      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-51      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-52      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-53      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-54      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-55      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-56      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-57      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-58      | COOnPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-59      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-60      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-61      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-62      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-63      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-64      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-65      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-66      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-67      | COOiPr                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-68      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-69      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-70      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-71      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-72      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-73      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-74      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-75      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-76      | COOnBu                | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-77      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-78      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-79      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-80      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-81      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-82      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-83      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |
| 9-84      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                           |
| 9-85      | COOPh                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                           |
| 9-86      | COOCH <sub>2</sub> Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>                 | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                           |

【表 19】

(表IX 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                     | A                               | S(O) <sub>m</sub> | R <sup>5</sup>  | n | 融点 (°C); または<br>NMR (ppm)     |
|-----------|------------------------------------|---------------------------------|-------------------|-----------------|---|-------------------------------|
| 9-87      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-88      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-89      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 9-90      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-91      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-92      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 9-93      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-94      | COOCH <sub>2</sub> Ph              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-95      | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 9-96      | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-97      | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-98      | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 9-99      | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-100     | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-101     | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 0 |                               |
| 9-102     | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-103     | COCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 |                               |
| 9-104     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 | <sup>19</sup> F: -44.2, -64.1 |
| 9-105     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-106     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 | 65                            |
| 9-107     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-108     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 0 | 72                            |
| 9-109     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 1 |                               |
| 9-110     | シクロブチル                             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | S                 | CH <sub>3</sub> | 2 | 116                           |
| 9-111     | シクロブチル                             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO                | CH <sub>3</sub> | 2 | 150                           |
| 9-112     | シクロブチル                             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | SO <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | 2 | 167                           |

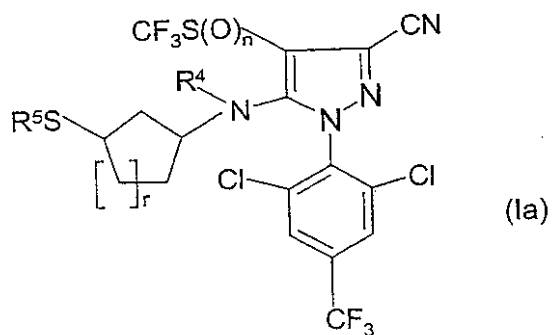
10

20

30

【表 20】

表 X : 式 (la) の化合物 :



| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                     | r | n | 融点(°C) |
|-----------|------------------------------------|------------------------------------|---|---|--------|
| 10-1      | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-2      | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-3      | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-4      | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-5      | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-6      | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-7      | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 1 | 0 |        |
| 10-8      | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 1 | 1 |        |
| 10-9      | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 1 | 2 |        |
| 10-10     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 1 | 0 |        |
| 10-11     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 1 | 1 |        |
| 10-12     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 1 | 2 |        |
| 10-13     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> Ph                 | 1 | 1 |        |
| 10-14     | CH <sub>3</sub>                    | Ph                                 | 1 | 1 |        |
| 10-15     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-16     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-17     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-18     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-19     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-20     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-21     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-22     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-23     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-24     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-25     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-26     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-27     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 0 |        |
| 10-28     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 1 |        |
| 10-29     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 1 | 2 |        |
| 10-30     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-31     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-32     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |

【表 2 1】

(表 X 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                     | r | n | 融点(°C) |
|-----------|------------------------------------|------------------------------------|---|---|--------|
| 10-33     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-34     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-35     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-36     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 2 | 0 |        |
| 10-37     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 2 | 1 |        |
| 10-38     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 2 | 2 |        |
| 10-39     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 2 | 0 |        |
| 10-40     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 2 | 1 |        |
| 10-41     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 2 | 2 |        |
| 10-42     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> Ph                 | 2 | 1 |        |
| 10-43     | CH <sub>3</sub>                    | Ph                                 | 2 | 1 |        |
| 10-44     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-45     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-46     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-47     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-48     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-49     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-50     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-51     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-52     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-53     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-54     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-55     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-56     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 0 |        |
| 10-57     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 1 |        |
| 10-58     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub>                    | 2 | 2 |        |
| 10-59     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 0 |        |
| 10-60     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 1 |        |
| 10-61     | H                                  | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 2 |        |
| 10-62     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 0 |        |
| 10-63     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 1 |        |
| 10-64     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 2 |        |
| 10-65     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 3 | 0 |        |
| 10-66     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 3 | 1 |        |
| 10-67     | CH <sub>3</sub>                    | Et                                 | 3 | 2 |        |
| 10-68     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3 | 0 |        |
| 10-69     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3 | 1 |        |
| 10-70     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-71     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>2</sub> Ph                 | 3 | 1 |        |
| 10-72     | CH <sub>3</sub>                    | Ph                                 | 3 | 1 |        |
| 10-73     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 0 |        |
| 10-74     | Et                                 | CH <sub>3</sub>                    | 3 | 1 |        |

10

20

30

40

【表 2 2】

(表 X 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | r | n | 融点(°C) |
|-----------|------------------------------------|-----------------|---|---|--------|
| 10-75     | Et                                 | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-76     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 10-77     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 10-78     | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-79     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 10-80     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 10-81     | CH <sub>2</sub> C≡CH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-82     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 10-83     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 10-84     | C(O)OEt                            | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-85     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 10-86     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 10-87     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル            | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 10-88     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | 4 | 0 |        |
| 10-89     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | 4 | 1 |        |
| 10-90     | CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | 4 | 2 |        |
| 10-91     | CH <sub>3</sub>                    | Et              | 4 | 0 |        |
| 10-92     | CH <sub>3</sub>                    | Et              | 4 | 1 |        |
| 10-93     | CH <sub>3</sub>                    | Et              | 4 | 2 |        |

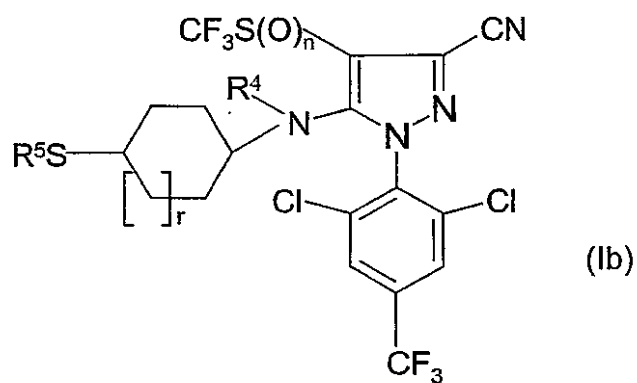
10

20

【0 1 1 8】

【表 2 3】

表XI：式 (Ib) の化合物：



| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>                    | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------------------------|---|---|--------|
| 11-1      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-2      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-3      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-4      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-5      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-6      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-7      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 0 |        |
| 11-8      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 1 |        |
| 11-9      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 2 |        |
| 11-10     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 0 |        |
| 11-11     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 1 |        |
| 11-12     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 2 |        |
| 11-13     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 1 | 1 |        |
| 11-14     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 1 | 1 |        |
| 11-15     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-16     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-17     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-18     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-19     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-20     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |

【0119】

【表 2 4】

(表XI 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>                    | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------------------------|---|---|--------|
| 11-21     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-22     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-23     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-24     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-25     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-26     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-27     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 11-28     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 11-29     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 11-30     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-31     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-32     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-33     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-34     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-35     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-36     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 0 |        |
| 11-37     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 1 |        |
| 11-38     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 2 |        |
| 11-39     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 0 |        |
| 11-40     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 1 |        |
| 11-41     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 2 |        |
| 11-42     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 2 | 1 |        |
| 11-43     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 2 | 1 |        |
| 11-44     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-45     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-46     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-47     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-48     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-49     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-50     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-51     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-52     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-53     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-54     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-55     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-56     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 11-57     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 11-58     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 11-59     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-60     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-61     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-62     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-63     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-64     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |

【表 2 5】

(表XI 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>                    | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------------------------|---|---|--------|
| 11-65     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 0 |        |
| 11-66     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 1 |        |
| 11-67     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 2 |        |
| 11-68     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 0 |        |
| 11-69     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 1 |        |
| 11-70     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 2 |        |
| 11-71     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 3 | 1 |        |
| 11-72     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 3 | 1 |        |
| 11-73     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-74     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-75     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-76     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-77     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-78     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-79     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-80     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-81     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-82     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-83     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-84     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-85     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 11-86     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 11-87     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 11-88     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 4 | 0 |        |
| 11-89     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 4 | 1 |        |
| 11-90     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 4 | 2 |        |
| 11-91     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 4 | 0 |        |
| 11-92     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 4 | 1 |        |
| 11-93     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 4 | 2 |        |

10

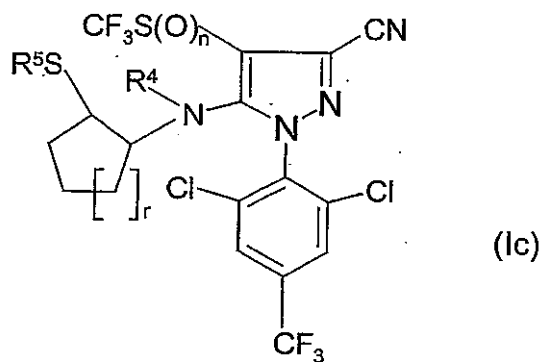
20

30

【0 1 2 1】

【表 2 6】

表XII：式 (Ic) の化合物：



| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>                    | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------------------------|---|---|--------|
| 12-1      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-2      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-3      | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-4      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-5      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-6      | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-7      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 0 |        |
| 12-8      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 1 |        |
| 12-9      | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 1 | 2 |        |
| 12-10     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 0 |        |
| 12-11     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 1 |        |
| 12-12     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 1 | 2 |        |
| 12-13     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 1 | 1 |        |
| 12-14     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 1 | 1 |        |
| 12-15     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-16     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-17     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-18     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-19     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-20     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-21     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-22     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-23     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-24     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-25     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-26     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-27     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 0 |        |
| 12-28     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 1 |        |
| 12-29     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 1 | 2 |        |
| 12-30     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-31     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-32     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |

【表 2 7】

表XII 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>                    | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------------------------|---|---|--------|
| 12-33     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-34     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-35     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-36     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 0 |        |
| 12-37     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 1 |        |
| 12-38     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 2 | 2 |        |
| 12-39     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 0 |        |
| 12-40     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 1 |        |
| 12-41     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 2 | 2 |        |
| 12-42     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 2 | 1 |        |
| 12-43     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 2 | 1 |        |
| 12-44     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-45     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-46     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-47     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-48     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-49     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-50     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-51     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-52     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-53     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-54     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-55     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-56     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 0 |        |
| 12-57     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 1 |        |
| 12-58     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub>                   | 2 | 2 |        |
| 12-59     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 12-60     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 12-61     | H                                 | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 12-62     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 12-63     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 12-64     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 12-65     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 0 |        |
| 12-66     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 1 |        |
| 12-67     | CH <sub>3</sub>                   | Et                                | 3 | 2 |        |
| 12-68     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 0 |        |
| 12-69     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 1 |        |
| 12-70     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | 3 | 2 |        |
| 12-71     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>2</sub> Ph                | 3 | 1 |        |
| 12-72     | CH <sub>3</sub>                   | Ph                                | 3 | 1 |        |
| 12-73     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |
| 12-74     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 1 |        |
| 12-75     | Et                                | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 2 |        |
| 12-76     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub>                   | 3 | 0 |        |

【表 28】

(表XII 続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>4</sup>                    | R <sup>5</sup>  | r | n | 融点(°C) |
|-----------|-----------------------------------|-----------------|---|---|--------|
| 12-77     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 12-78     | CH <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 12-79     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 12-80     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 12-81     | CH <sub>2</sub> CCH               | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 12-82     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 12-83     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 12-84     | C(O)OEt                           | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 12-85     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub> | 3 | 0 |        |
| 12-86     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub> | 3 | 1 |        |
| 12-87     | CH <sub>2</sub> シクロプロピル           | CH <sub>3</sub> | 3 | 2 |        |
| 12-88     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | 4 | 0 |        |
| 12-89     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | 4 | 1 |        |
| 12-90     | CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | 4 | 2 |        |
| 12-91     | CH <sub>3</sub>                   | Et              | 4 | 0 |        |
| 12-92     | CH <sub>3</sub>                   | Et              | 4 | 1 |        |
| 12-93     | CH <sub>3</sub>                   | Et              | 4 | 2 |        |

10

20

## 【0124】

下記で使用される「本発明の化合物」なる用語は上記で定義されたような式(I)の5-置換-アルキルアミノピラゾールおよびその農薬的に許容しうる塩を包含する。本発明の好ましい態様において、式(I)の化合物は動物の寄生虫を防除するために使用される。好ましくは、処置される動物はイヌまたはネコのような家庭のペットである。

## 【0125】

本発明の別の態様において、式(I)の化合物、その塩または組成物は好ましくは寄生虫、特に動物の体内外にいる外部および内部寄生虫を防除するための獣医用薬剤の製造において使用される。

30

## 【0126】

本発明の化合物およびその使用法は家畜にとって有害な、または家畜の病気を蔓延させる、すなわちそれを媒介する生物として働く節足動物または蠕虫、例えば前記で挙げたものの防除において、さらに詳しくはマダニ、ダニ、シラミ、ノミ、小昆虫、あるいは噛み付く害虫またはハエウジ症のハエの防除において特に有用である。本発明の化合物は宿主家畜の体内に存在する、あるいは皮膚で餌をとる、または動物の血液を吸う節足動物または蠕虫の防除において特に有用であり、そのためにこれらは経口的、非経口的、経皮的または局所的に投与することができる。

40

## 【0127】

下記で説明される組成物は一般に節足動物または蠕虫が寄生した、あるいはそれらの侵襲に暴露した動物に、活性成分が例えば餌料または好適で経口摂取可能な医薬製剤、食餌、塩塊、栄養補助食品、プアオン剤、噴霧剤、浴用剤、浸漬剤、シャワー、ジェット噴流、粉剤、グリース、シャンプー、クリーム、油性ワックスまたは家畜の自己処理システムに加えることにより節足動物または蠕虫に対してある期間にわたって速効性および/または持効性作用を示す組成物の非経口的、経口的または局所的施用により使用することができる。

## 【0128】

式(I)の化合物は経口的に投与すると動物の寄生虫の防除に対して特に有用であり、さ

50

らに本発明の好ましい態様において、式(I)の化合物は経口投与により動物の寄生虫を防除するのに使用される。式(I)の化合物またはその塩は食事前、その間または食後に投与することができる。式(I)の化合物またはその塩は担体および／または食料と混合することができる。

#### 【0129】

式(I)の化合物またはその塩は一般に動物の体重1kgにつき0.1~500mg/kgの式(I)の化合物またはその塩の投与量範囲(mg/kg)で動物に経口投与される。

式(I)の化合物またはその塩により処置される動物、好ましくは家畜の処置回数は一般に週に約1回~年に約1回、好ましくは2週間に約1回~3ヶ月に1回である。

#### 【0130】

本発明の化合物は他の殺寄生生物的に有効な物質、例えば殺内部寄生虫剤、および／または殺外部寄生虫剤、および／または殺毛内外寄生虫剤(endectoparasiticide)と一緒に最も有利に投与することができる。例えば、このような化合物はアベルメクチンまたはミルベマイシン、例えばイベルメクチン、ピランテルのような大環状ラクトン、あるいはルフェヌロンまたはメトプレンのような昆虫成長制御剤である。

#### 【0131】

本発明の別の特徴によれば、有効量の式(I)の化合物またはその塩を施用することからなる所定領域の害虫を防除する方法が提供される。このために、前記化合物は例えば下記のように、通常は農薬組成物(すなわち農薬組成物で使用するのに適した相溶性希釈剤または担体および／または界面活性剤と混合した)形態で使用される。

#### 【0132】

上記で定義されたような本発明の一態様は所定領域の害虫を防除する方法である。所定領域とは例えば害虫そのもの；害虫が存在する、または餌をとる場所(植物、田畑、森林、果樹園、水路、土壌、作物など)、あるいは将来的に害虫による侵襲を受けやすい場所である。したがって、本発明の化合物は直接害虫に、害虫が存在する、または餌をとる場所に、あるいは将来的に害虫による侵襲を受けやすい場所に施用することができる。前記の農薬用途から明らかなように、本発明は農薬的に活性な化合物、および節足動物、特に昆虫またはダニ、あるいは植物線虫を含む幾つかの害虫を防除するために前記化合物を使用する方法を提供する。したがって、本発明の化合物は実用的に、例えば獣医用薬剤または家畜飼育、農作物または園芸作物、林業、あるいは公衆衛生で有利に使用することができる。

#### 【0133】

本発明の化合物は例えば次の用途で、また次の害虫に対して使用することができる：獣医用薬剤または家畜飼育の分野、あるいは公衆衛生の管理において脊椎動物、特に温血脊椎動物、例えば家畜、例えばウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、家禽、イヌまたはネコの内部または外部に寄生する節足動物、例えばマダニを含むダニ目、例えばヒメダニ科、例えばヒメダニ属およびオルニトドロス属(例えばOrnithodoros moubata)を含む軟体ダニ；Ixodidae属、例えばウシマダニ属、例えばオウシマダニ(Boophilus microplus)、リピセファルス属、例えば褐色ダニ(Rhipicephalus appendiculatus)およびイヌマダニ(Rhipicephalus sanguineus)を含む堅体ダニ；ダニ(例えばダマリニア属)；ノミ(例えばCtenocephalides属、例えばネコノミ(Ctenocephalides felis)およびイヌノミ(Ctenocephalides canis)；シラミ、例えばメノポン属；双翅目(例えばヤブ蚊属、ハマダラカ属、ムスカ属、ヒポデルマ属)；半翅目；網翅目(例えばペリプラネタ属、ゴキブリ属)；膜翅目に対して、あるいは例えば寄生線虫、例えば毛様線虫科の一員により引き起こされる胃腸管の感染症に対して使用することができる。

#### 【0134】

根切り虫、シロアリ(特に建造物保護のため)、根のウジムシ、コメツキムシの幼虫、根のゾウムシ、茎食い虫、ヨトウムシ、根のアブラムシまたは地虫のような土壌昆虫を防除するために使用することができる。これらはまた、植物の病原線虫、例えば根コブ線虫、シスト線虫、ダガー(dagger)線虫、根腐れ線虫、茎または球根の線虫、あるいはダニ

10

20

30

40

50

に対する活性を付与するために使用することができる。土壌害虫、例えば根切り虫を防除するために、本化合物は有利に作物が植えられた、または植えられる土壌に有効量が施用または注入され、あるいは種子または成長する植物の根に施用される。

#### 【0135】

公衆衛生分野において、本化合物は特に多くの昆虫、とりわけ汚物バエまたは他の双翅目害虫、例えば家バエ、サシバエ、兵士バエ、ノサシバエ、メクラアブ、ウマバエ、小ハエ、ヌカカ、ブヨまたは蚊の防除において有用である。

#### 【0136】

貯蔵生産物、例えば穀物または小麦粉を含む穀類、落花生、動物飼料、木材または家財道具、例えばカーペットおよび織物の保護において、本発明の化合物は節足動物、さらに詳しくはゾウムシ、蛾またはダニ、例えばEphestia属（スジコナマダラメイガ）、Anthrenus属（カツオブシムシ）、Tribolium属（コクヌストモドキ）、Sitophilus属（穀物ゾウムシ）またはAcarus属（ダニ）を含む甲虫による攻撃に対して有用である。

#### 【0137】

ゴキブリ、アリまたはシロアリ、あるいは住宅または産業用建物に発生する同様の節足動物害虫の防除において、あるいは水路、井戸、貯水池または他の流水または貯留水での蚊幼虫の防除において有用である。

#### 【0138】

建造物に対するシロアリ、例えばReticulitermes属、Heterotermes属、Coptotermes属の攻撃を防止するために土台、構造または土壌を処理するのに有用である。

#### 【0139】

農業において、鱗翅目（チョウおよび蛾）の成虫、幼虫および卵、例えばHeliothis属、例えばHeliothis virescens（タバコの葉を食う害虫）、Heliothis armigeraおよびHeliothis zea；鞘翅目（甲虫）の成虫および幼虫、例えばAnthonomus属、例えばオオゾウムシ（綿花ゾウムシ）、コロラドハムシ（コロラドポテトビートル）、ウリハムシ（Diabrotica属）（根切り虫）；異翅目（半翅目および同翅目）、例えばキジラミ（Psylla属）、コナジラミ（Bemisia属）、コナジラミ（Trialeurodes属）、アブラムシ（Aphis属）、アブラムシ（Myzus属）、Megoura viciae、葡萄根アブラムシ（Phylloxera属）、Nephotettix属（稲ヨコバイ）、ウンカ（Nilaparvata属）；双翅目、例えばムスカ属；総翅目、例えばネギアザミウマ（Thrips tabaci）；直翅目、例えばLocusta属およびSchistocerca属（バッタおよびコオロギ）、例えばGryllus属およびAcheta属、例えばコバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、チャバネゴキブリ、ワタリバッタおよびサバクトビバッタ；トビムシ目、例えばPeriplaneta属およびBlattella属（ゴキブリ）；農業的に重要な節足動物、例えばダニ目（ダニ）、例えばTetranychus属およびPanonychus属；農業、林業または園芸で重要な植物または樹木を直接、あるいは植物の細菌、ウイルス、マイコプラズマまたは真菌性疾患を蔓延させることにより攻撃する線虫、例えば根コブ線虫、例えばMeloidogyne属（例えばサツマイモネコブセンチュウ）に対して有用である。

#### 【0140】

節足動物、特に昆虫またはダニ、あるいは植物線虫を防除するための実際的な使用において、方法は例えば植物またはそれらが成長する培地に有効な量の本発明の化合物を施用することからなる。このような方法では、本発明の化合物は一般に節足動物または線虫の発生を防除する場所に処理領域1ヘクタールにつき約2g～約1kgの活性化合物の範囲の有効量で施用される。最適条件下、防除する害虫に応じて低い施用量でも十分に保護することができる。他方では、悪天候、害虫の耐性または他の要因が活性成分を高い施用量で使用することを求める場合もある。最適施用量は通常、幾つかの要因、例えば防除する害虫の種類、被害植物の種類または成長段階、種の列の間隔、さらに施用法に依存する。好ましくは、活性化合物の有効な施用量の範囲は約10g/ヘクタール～約400g/ヘクタール、より好ましくは約50g/ヘクタール～約200g/ヘクタールである。害虫が土壌由来である場合、一般に配合組成物中の活性化合物は処理する領域全体に何れかの慣用方法（例えば全面散布または帯状散布）により均一に分布され、約10g/ヘクタール～約400g/ヘクタール、

好ましくは約50g/ヘクタール～約200g/ヘクタールの量が施用される。苗根部の浸漬または植物への点滴灌水として施用される場合、液剤溶液または懸濁液は約0.075～約1000mg/lの活性成分、好ましくは約25～約200mg/Lの活性成分を含有する。所望により、田畑または一般に作物が成長する領域、あるいは攻撃から保護する種子または植物のすぐ近くに施用することができる。本発明の化合物は領域全体に水を散布することにより土壤に洗い流され、または降雨による自然の作用に委ねられる。所望により、施用の間またはその後配合化合物を機械的に、例えば掘り起こし、ディスキング、またはドラッグチェーンの使用により土壤に分布することができる。施用は播種前に、播種時に、播種後であるが萌芽前に、または萌芽後に行なうことができる。

#### 【0141】

本発明の化合物およびそれを使用して害虫を防除する方法は田畑、飼料、農園、温室、果樹園またはブドウ園の収穫物、観賞植物、あるいは農園または森林の木：例えば穀類（例えば小麦または米）、綿、野菜（例えばコショウ）、農作物（例えば甜菜、大豆または菜種）、草原または飼料作物（例えばトウモロコシまたはモロコシ）、果樹園または木立（例えば石果または核果または柑橘類）、観賞植物、ハウス栽培または庭園や公園の花または野菜または低木、あるいは森林、農園または苗圃の木（落葉性および常緑性）の保護において特に有用である。

#### 【0142】

これらはまた、例えばハバチまたは甲虫またはシロアリによる攻撃からの材木（立ち木、倒木、用材、貯蔵木材または構造木材）の保護において有用である。

これらは丸ごと、破碎または混合して製品化される穀物、果実、木の実、スパイスまたはタバコのような貯蔵生産物を蛾、甲虫、ダニまたは穀物ゾウムシの攻撃から保護するのに施用される。貯蔵される肉、魚または穀物が甲虫、ダニまたはハエの攻撃から保護されるように、天然または転換形態（例えばカーペットまたは織物）の皮膚、毛髪、羊毛または羽毛のような貯蔵畜産物もまた、蛾または甲虫の攻撃から保護される。

#### 【0143】

成長する作物または作物が成長する場所に、あるいは種子被覆剤として施用するための下記組成物は一般に貯蔵生産物、家財道具、不動産、または一般的な環境の領域を保護するのに使用することができる。本発明の化合物を施用するための適当な手段は成長する作物に葉面散布剤（例えば溝（in-furrow）散布剤）、粉剤、粒剤、煙霧剤または泡剤（foam）、さらに水浸剤（liquid drenches）、粉剤、粒剤、燻蒸剤または泡剤による土壤または根部の処理のように微粉碎または封入した組成物の懸濁液として；作物の種子にスラリー液または粉剤による種子被覆剤施用として；一般的な環境または害虫が潜んでいる特定の場所、例えば貯蔵生産物、材木、家財道具、あるいは住宅または産業用建物に散布剤、煙霧剤、粉剤、燻蒸剤、油性ワックス、ラッカー、粒剤または餌として、あるいは水路、井戸、貯水池または他の流水または貯留水に点滴給液（tricklefeeds）として施用することである。

#### 【0144】

式(I)の化合物はまた、既知の遺伝子操作された植物またはまだ発達していない遺伝子操作された植物の作物において有害生物を防除するのに使用することができる。一般に、トランスジェニック植物は特に有利な性質、例えば特定の作物保護剤に対する耐性、植物の病気または植物の病気の病原体、例えば特定の昆虫、あるいは真菌、細菌またはウイルスのような微生物に対する耐性を特徴とする。他の特定の性質は例えば収穫物の量、品質、貯蔵性、組成および特殊な構成成分に関する。すなわち、トランスジェニック植物は澱粉含量が高い、または澱粉の性質が変化している、または収穫物が異なる脂肪酸組成を有することが知られている。

#### 【0145】

有用な植物および観賞植物の経済的に重要なトランスジェニック作物、例えば小麦、大麦、ライ麦、オート麦、キビ、イネ、カッサバおよびトウモロコシのような穀類、または他の作物の甜菜、綿、大豆、菜種、ジャガイモ、トマト、エンドウおよび他のタイプの野

10

20

30

40

50

菜における使用が好ましい。

#### 【0146】

トランスジェニック作物、特に昆虫に対して耐性を有するものにおいて使用される場合、他の作物で観察される有害生物に対する効果の他に、当該トランスジェニック作物への施用における特異的な効果、例えば防除することができる害虫の範囲の変化または拡大、あるいは施用に使用される施用量の変化がしばしば観察される。

したがって、本発明はまた、トランスジェニック作物における有害生物を防除するための式(I)の化合物の使用に関する。

#### 【0147】

本発明の別の特徴によれば、上記で定義されたような1種またはそれ以上の本発明の化合物を1種またはそれ以上の農業的に許容しうる相溶性希釈剤または担体および／または界面活性剤〔すなわち農業組成物で使用するのに適当であり、本発明の化合物と相溶性である、一般に当該技術分野で許容されるタイプの希釈剤または担体および／または界面活性剤〕と混合した、好ましくは均一に分散させた農業組成物が提供される。

#### 【0148】

実際に、本発明の化合物は最も頻繁に組成物の一部を形成する。これらの組成物は節足動物、特に昆虫、あるいは植物の線虫またはダニを防除するのに使用することができる。本組成物は何れかの場所、すなわち屋内または屋外の領域で所望の害虫に施用するのに適した当該技術分野で知られているタイプのものであってよい。これらの組成物は活性成分として少なくとも1種の本発明の化合物を1種またはそれ以上の他の農学的または医学的に許容しうる相溶性成分、例えば使用目的に適した固体または液体の担体または希釈剤、補助剤、界面活性剤などと組合せて、または混合して含有する。当該技術分野で知られている何れかの方法により製造することができるこれらの組成物もまた本発明の一部を形成する。

#### 【0149】

商業的に入手できる製剤およびこれらの製剤から調製した使用形態において、本発明の化合物は殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生長調整物質または除草剤のような他の活性物質との混合物として存在することができる。

#### 【0150】

農業には例えばリン酸エステル、カルバメート、カルボン酸エステル、ホルムアミジン、スズ化合物および微生物が産生した物質が含まれる。

#### 【0151】

混合物中の好ましい成分は：

##### 1. リン化合物群から

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(F-67825)、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス－メチル、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、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファミファー、フェナミホス、フェニトリオチオン、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、サリチオン、メピンホス、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、パラチオン、パラチオン－メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ(BAS-301)、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス－エチル、ピリミホス－メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、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、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン；

#### 【0152】

10

20

30

40

50

## 2. カルバメート群から

アラニカルブ(OK-135)、アルジカルブ、2-sec-ブチルフェニルメチルカルバメート(BPMC)、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、ベンフラカルブ、エチオフエンカルブ、フラチオカルブ、HCN-801、イソプロカルブ、メトミル、5-メチル- $\alpha$ -クロロニルブチリル(メチル)カルバメート、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスール、チオジカルブ、チオファノクス、1-メチルチオ(エチリデンアミノ)-N-メチル-N-(モルホリノチオ)カルバメート(UC 51717)、トリアザメート;

## 【0153】

## 3. カルボン酸エステル群から

アクリナトリン、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)-シス-2,2-ジメチル-3-(2-オキソチオラン-3-イリデンメチル)シクロプロパンカルボキシレート、ベーターシフルトリン、アルファシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、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、ピフェントリン、(RS)-1-シアノ-1-(6-フェノキシ-2-ピリジル)メチル(1RS)-トランス-3-(4- $\alpha$ -ブチルフェニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート(NCI 85193)、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シチトリン、シペルメトリン、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、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(S-41311)、ラムダーシハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン(<sup>R</sup>異性体)、プラレトリン、ピレトリンス(天然生成物)、レスメトリン、テフルトリン、テトラメトリン、シーターシペルメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、ゼーターシペルメトリン(F-56701);

## 【0154】

## 4. アミジン群から

アミトラズ、クロルジメホルム;

## 5. スズ化合物群から

シヘキサチン、フェンブタチンオキシド;

## 【0155】

## 6. その他

アバメクチン、ABG-9008、アセタミプリド、アナグラファファルシテラ、AKD-1022、AKD-3059、ANS-118、アザジラクチン、バシラス・チュリンジエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、白きょう病菌(*Beauveria bassiana*)、ベンスルタップ、ピフェナゼート、ピナバクリル、BJL-932、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、ブプロフェジン、カンフェクロール、カルタップ、クロロベンジレート、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、2-(4-クロロフェニル)-4,5-ジフェニルチオフエン(UBI-T 930)、クロルフェンテジン、クロルプロキシフェン、クロマフェノジド、クロチアニジン、2-ナフチルメチルシクロプロパンカルボキシレート(Ro12-0470)、シロマジン、ジアクロデン(チアメトキサム)、ジアフェンチウロン、DBI-3204、エチル2-クロロ-N-(3,5-ジクロロ-4-(1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-プロピルオキシ)フェニル)カルバモイル)-2-カルボキシイミデート、DDT、ジコホル、ジフルベンズロン、N-(2,3-ジヒドロ-3-メチル-1,3-チアゾール-2-イリデン)-2,4-キシリジン、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、ジオフェノラン、エマメクチンベンゾエート、エンドスルファン、エチプロール(スルフェチプロール)、エトフェンプロクス、エトキサゾール、フェナザキン、フェノキシカルブ、フィプロニル、フルアズロン、フルミテ(フルフェンジン、SZI-121)、2-フルオロ-5-(4-(4-エトキシフェニル)-4-メチル-1-ペンチル)ジフェニルエーテル(MTI 800)、顆粒病および核多角体病ウイルス、フェンピロキシメート、フェンチオカルブ、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシスリネート、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、フルフェンジン、フルフェンプロクス、フルプロキシフェン、ガンマーHCH、ハロフェノジド、ハロフェンプロクス、ヘキサフルムロン(DE\_473)、ヘキシチアゾクス、HOI-9004、ヒドラメチルノン(AC 217300)、IKI-2

20、インドキサカルブ、イベルメクチン、L-14165、イミダクロプリド、インドキサカルブ(DPX-MP062)、カネミテ(AKD-2023)、ルフェヌロン、M-020、M-020、メトキシフェノジド、ミルベメクチン、NC-196、ニームガルド、ニジノテルフラン、ニテンピラム、2-ニトロメチル-4,5-ジヒドロ-6H-チアジン(DS 52618)、2-ニトロメチル-3,4-ジヒドロチアゾール(SD 35651)、2-ニトロメチレン-1,2-チアジナン-3-イルカルバムアルデヒド(WL 108477)、ノバルロン、ピリダリル、プロパルギト、プロトリフェンブテ、ピメトロジン、ピリダベン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、NC-196、NC-1111、NNI-9768、ノバルロン(MCW-275)、OK-9701、OK-9601、OK-9602、OK-9802、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(CG-177)、スピノサッド、スピロジクロフェン、SU-9118、テブフェノジド、テブフェンピラッド、テフルベンズロン、テトラジホン、テトラスル、チアクロプリッド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラッド、トリアザメート、トリエトキシスピノシンA、トリフルムロン、ベルブチン、ベルタレック(ミコタール)、YI-5301である。

10

#### 【0156】

配合される上記成分は知られている活性物質であり、その多くはCh.R Worthing、S.B.W alkerの「The Pesticide Manual」,第12版, British Crop Protection Council, Farnham (2000年)に記載されている。

#### 【0157】

本発明で使用される化合物の有効な施用量は特に排除する害虫の性質または例えばこれらの害虫による作物の被害の程度に応じて広い範囲内で変動する。一般に、本発明の組成物は通常、約0.05～約95重量%の1種またはそれ以上の本発明の活性成分、約1～約95重量%の1種またはそれ以上の固体または液体の担体、場合により約0.1～約50重量%の1種またはそれ以上の他の相溶性成分、例えば界面活性剤などを含有する。これに関して、「担体」なる用語は天然または合成の有機または無機成分を意味し、それを活性成分と混合すると例えば植物、種子または土壌への施用が容易になる。したがって、この担体は一般に不活性であり、許容される(例えば特に処理する植物に対して農学的に許容される)ものでなければならない。

20

#### 【0158】

担体は固体、例えばクレー、天然または合成のケイ酸塩、シリカ、樹脂、ワックス、固体肥料(例えばアンモニウム塩)、粉碎された天然鉱物、例えばカオリン、クレー、タルク、白亜、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト、ベントナイトまたは珪藻土、あるいは粉碎された合成鉱物、例えばシリカ、アルミナまたはケイ酸塩、特にケイ酸アルミニウムまたはマグネシウムである。粒剤用の固体状担体として次のものが好適である: 破砕または断片化された天然岩、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイト; 無機または有機飼料の合成粒剤; おがくず、ココナッツの殻、トウモロコシの穂軸、トウモロコシの皮またはタバコの茎のような有機物の粒剤; 珪藻土、リン酸三カルシウム、粉末コルクまたは吸収性カーボンブラック; 水溶性ポリマー、樹脂、ワックス; あるいは固体肥料。所望により、このような固体組成物は1種またはそれ以上の相溶性湿潤剤、分散剤、乳化剤または着色剤を含有し、それらは固体である場合、希釈剤としても働くことがある。

30

40

#### 【0159】

担体は液体であってもよく、例えば水; アルコール、特にブタノールまたはグリコール、それらのエーテルまたはエステル、特にメチルグリコールアセテート; ケトン、特にアセトン、シクロヘキサノン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはイソホロン; パラフィン系または芳香族炭化水素のような石油留分、特にキシレンまたはアルキルナフタレン; 鉱油または植物油; 脂肪族塩素化炭化水素、特にトリクロロエタンまたは塩化メチレン; 芳香族塩素化炭化水素、特にクロロベンゼン; 水溶性または強力な極性溶媒、例えばジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドまたはN-メチルピロリドン; 液化ガスなど、またはこれらの混合物である。

50

## 【0160】

界面活性剤はイオン性または非イオン性の乳化剤、分散剤または湿潤剤、あるいはこのような界面活性剤の混合物である。これらの中には例えばポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールまたは脂肪酸または脂肪酸エステルまたは脂肪アミンの重縮合物、置換フェノール（特にアルキルフェノールまたはアリールフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（特にアルキルタウレート）、アルコールまたはエチレンオキシドとフェノールの重縮合物のリン酸エステル、脂肪酸とポリオールのエステル、あるいは上記化合物の硫酸塩、スルホン酸塩またはリン酸塩官能誘導体がある。少なくとも1種の界面活性剤の存在は一般に活性成分および／または不活性担体が少しだけ水溶性であるか、または水溶性ではなく、施用組成物の担体物質が水である場合に絶対必要である。

## 【0161】

本発明の組成物はさらに接着剤または着色剤のような他の添加剤を含有することができる。カルボキシメチルセルロース、あるいは粉末、顆粒または格子形態の天然または合成ポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコールまたは酢酸ポリビニル、天然リン脂質、例えばセファリンまたはレシチン、あるいは合成リン脂質のような接着剤を製剤に使用することができる。無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンまたはプルシアンブルー；有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料または金属フタロシアニン染料；あるいは微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンまたは亜鉛の塩のような着色剤を使用することができる。

## 【0162】

農業で使用する場合、本発明の化合物は一般に様々な固体または液体形態である組成物形態である。使用することができる固体形態の組成物は散布剤（本発明の化合物の含有量は80%以下）、湿潤性粉末または顆粒剤（水分散性顆粒剤を含む）、特に粒状担体の押出、圧縮、含浸、または粉末の粒状化により得られるもの（これらの湿潤性粉末または顆粒剤において本発明の化合物の含有量は約0.5～約80%）である。1種以上の本発明の化合物を含有する固体の均質なまたは不均質な組成物、例えば顆粒剤、ペレット剤、ブリケット剤またはカプセル剤を使用して貯留水または流水を一定期間処理することができる。同様の効果はここで記載したような水分散性濃縮物の点滴または間断給液を使用して達成することができる。

## 【0163】

液体組成物には例えば水性または非水性の溶液または懸濁液（例えば乳化性濃縮物、エマルジョン、フロアブル剤、分散液または液剤）またはエアゾル剤がある。さらに詳しくは、液体組成物には液体である、または施用時に液体組成物を生成する組成物形態、例えば水性散布剤（少量および微量散布剤を含む）、煙霧剤またはエアゾル剤として乳化性濃縮物、分散液、エマルジョン、フロアブル剤、エアゾル剤、湿潤性粉末（または散布用粉末）、ドライフロアブル剤またはペースト剤がある。

## 【0164】

例えば乳化性または可溶性濃縮物形態の液体組成物は最も頻繁に約5～約80重量%の活性成分を含有し、この場合、施用時のエマルジョンまたは液剤は約0.01～約20重量%の活性成分を含有する。溶剤の他に、乳化性または可溶性濃縮物は必要に応じて約2～約50重量%の適当な添加剤、例えば安定剤、界面活性剤、浸透剤、腐食防止剤、着色剤または接着剤を含有する。例えば植物に施用するのに適した必要な濃度のエマルジョンはこれらの濃縮物を水で希釈することにより得られる。これらの組成物は本発明で使用するすることができる組成物の範囲内に含まれる。エマルジョンは油中水型または水中油型の形態であり、高い稠度を有する。

## 【0165】

本発明の液体組成物は通常の農業への使用の他に、例えば不動産、屋内または屋外の貯蔵または加工領域、コンテナまたは装置、貯留水または流水を含む節足動物（または本発明の化合物により防除される他の害虫）が発生した、またはそれらが発生しやすい基材ま

たは場所を処理するために使用することができる。

#### 【0166】

すべてのこれらの水性分散液またはエマルションまたは散布混合物は例えば適当な手段により、主として散布することにより作物に施用することができ、その施用量は一般に1ヘクタールあたり約100～約1,200リットルの散布混合物であるが、必要性または施用法に応じて高めまたは低め(例えば少量または微量)であってもよい。本発明の化合物または組成物は好都合には植物、特に除去すべき害虫を有する根または葉に施用される。本発明の化合物または組成物を施用する他の方法は化学溶液灌水、すなわち活性成分を含有する製剤を灌漑用水に加えることである。この灌漑は葉面農薬のスプリンクラー灌漑であるか、あるいは土壌への、または浸透性農薬の地上灌漑または地下灌漑である。

10

#### 【0167】

散布により施用することができる濃縮懸濁液は沈降しない(微粉碎)、通常は約10～約75重量%の活性成分、約0.5～約30重量%の界面活性剤、約0.1～約10重量%のチキソトロップ剤、約0～約30重量%の適当な添加剤、例えば消泡剤、腐食防止剤、安定剤、浸透剤、接着剤、さらに担体として水、あるいは活性成分が溶解しにくい、または不溶性である有機液体を含有する安定した液体製剤をもたらしように製造される。ある有機固体または無機塩を担体中に溶解して沈降防止または水の凍結防止を促すことができる。

#### 【0168】

湿潤性粉末(または散布用粉末)は通常、それらが約10～約80重量%の活性成分、約20～約90重量%の固体担体、約0～約5重量%の湿潤剤、約3～約10重量%の分散剤、さらに必要に応じて約0～約80重量%の1種またはそれ以上の安定剤および/または他の添加剤、例えば浸透剤、接着剤、固化防止剤、着色剤などを含有するように製造される。これらの湿潤性粉末を得るために、活性成分は適当なブレンダーで多孔性充填剤に含浸させることができる追加の物質と完全に混合され、ミルまたは他の適当な粉碎機を使用して粉碎される。これにより、その湿潤性および懸濁性が有利である湿潤性粉末が得られる。これらを水中で懸濁して所望の濃度とし、この懸濁液を特に植物の茎葉散布において非常に有利に使用することができる。

20

#### 【0169】

「水分散性顆粒剤(WG)」(容易に水に分散する顆粒剤)は実質的に湿潤性粉末に近い組成を有する。これらは湿潤性粉末について記載した配合物の顆粒化により、すなわち湿式法(微細な活性成分を不活性充填剤および少量、例えば1～20重量%の水、あるいは分散剤または結合剤の水溶液と接触させ、その後乾燥し、スクリーニングする)、または乾式法(圧縮し、その後粉碎し、スクリーニングする)により製造することができる。

30

#### 【0170】

配合される組成物の割合および濃度は施用法、組成物の性質またはその使用に応じて変動する。一般に、節足動物または植物線虫のような害虫を防除するために施用される組成物は通常、約0.00001重量%～約95重量%、特に約0.0005重量%～約50重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物、あるいは全活性成分(すなわち本発明の化合物と節足動物または植物線虫に対して毒性のある他の物質、共力剤、微量元素または安定剤)を含有する。使用される実際の組成物およびそれらの施用量は農業従事者、畜産業者、開業医または獣医、害虫駆除業者または他の当業者により所望の効果を達成するように選択される。

40

#### 【0171】

動物、材木、貯蔵生産物または家財道具に局所施用される固体または液体組成物は通常、約0.00005重量%～約90重量%、特に約0.001重量%～約10重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。動物に固体または液体組成物を経口的または非経口的、例えば経皮的に投与する場合、これらは通常、約0.1重量%～約90重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。

#### 【0172】

薬剤添加飼料は通常、約0.001重量%～約3重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。飼料と混合される濃縮物または補給剤は通常、約5重量%～約90重量%、好ま

50

しくは約5重量%～約50重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。鉱塩塊は通常、約0.1重量%～約10重量%の1種またはそれ以上の式(I)の化合物またはその農薬的に許容しうる塩を含有する。

#### 【0173】

家畜、家財、不動産または屋外領域に施用される粉剤または液体組成物は約0.0001重量%～約15重量%、特に約0.005重量%～約2.0重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。

#### 【0174】

処理される水での適当な濃度は約0.0001ppm～約20ppm、特に約0.001ppm～約5.0ppmの1種またはそれ以上の本発明の化合物であり、養殖において適当な暴露時間で治療的に使用することができる。食餌は約0.01重量%～約5重量%、好ましくは約0.01重量%～約1.0重量%の1種またはそれ以上の本発明の化合物を含有する。

#### 【0175】

脊椎動物に非経口的、経口的、経皮的に、または他の手段により投与される場合、本発明の化合物の投与量は脊椎動物の種類、年齢または健康状態、さらに節足動物または蠕虫のような害虫による実際の、または潜在的な発生の性質または程度に依存する。継続的に投薬する場合、一般に経口または非経口投与により動物の体重1kgあたり約0.1～約100mg、好ましくは約2.0～約20.0mgを単回投与する、または1日につき動物の体重1kgあたり約0.01～約20.0mg、好ましくは約0.1～約5.0mgを複数回投与するのが好適である。徐放性製剤またはデバイスの使用により、数ヶ月にわたって必要な1日の投与量を合わせて1回で動物に投与することができる。

#### 【0176】

次の製剤例2A～2Mにより、活性成分として上記実施例に記載したような本発明の化合物を含有し、節足動物、特にダニ類または昆虫、または植物線虫に対して使用される組成物を説明する。製剤例2A～2Mに記載の組成物をそれぞれ希釈して田畑で使用するのに適した濃度の散布組成物を得ることができる。下記に例示した製剤例2A～2Mで使用される各成分の一般的な化学的説明（下記の百分率はすべて重量%である）は次の通りである：

| 商品名                    | 化学的説明                         |
|------------------------|-------------------------------|
| Ethylan BCP            | ノニルフェノールエチレンオキシド縮合物           |
| Soprophor BSU          | トリスチリルフェノールエチレンオキシド縮合物        |
| Arylan CA              | カルシウムドデシルベンゼンスルホネートの70% w/v溶液 |
| Solvesso 150           | 軽質C <sub>10</sub> 芳香族溶媒       |
| Arylan S               | ナトリウムドデシルベンゼンスルホネート           |
| Darvan NO <sub>2</sub> | ナトリウムリグノスルホネート                |
| Celite PF              | 合成ケイ酸マグネシウム担体                 |
| Sopropo T36            | ポリカルボン酸のナトリウム塩                |
| Rhodigel 23            | ポリサッカリドキサンタンゴム                |
| Bentone 38             | マグネシウムモンモリロナイトの有機誘導体          |
| Aerosil                | 微細二酸化ケイ素                      |

#### 【0177】

##### 製剤例2A

水溶性濃縮物は次の組成で製造される：

|             |     |
|-------------|-----|
| 活性成分        | 7%  |
| Ethylan BCP | 10% |
| N-メチルピロリドン  | 83% |

N-メチルピロリドンの一部に溶解したEthylan BCPの溶液に、活性成分を加熱攪拌しながら加えて溶解する。得られる溶液に残りの溶媒を加えて所定の容量にする。

#### 【0178】

##### 製剤例2B

乳化性濃縮物(EC)は次の組成で製造される：

10

20

30

40

50

|               |         |
|---------------|---------|
| 活性成分          | 25%(最大) |
| Soprophor BSU | 10%     |
| Arylan CA     | 5%      |
| N-メチルピロリドン    | 50%     |
| Solvesso 150  | 10%     |

最初の3つの成分をN-メチルピロリドンに溶解し、これにSolvesso 150を加えて最終容量にする。

#### 【0179】

##### 製剤例2C

湿潤性粉末(WP)は次の組成で製造される：

10

|                        |     |
|------------------------|-----|
| 活性成分                   | 40% |
| Arylan S               | 2%  |
| Darvan NO <sub>2</sub> | 5%  |
| Celite PF              | 53% |

各成分を混合し、ハンマーミルで粉砕して粒径が50ミクロン未満の粉末にする。

#### 【0180】

##### 製剤例2D

水性フロアブル剤は次の組成で製造される：

|               |        |
|---------------|--------|
| 活性成分          | 40.00% |
| Ethylan BCP   | 1.00%  |
| Sopropon T360 | 0.20%  |
| エチレングリコール     | 5.00%  |
| Rhodigel 230  | 0.15%  |
| 水             | 53.65% |

20

各成分をよく混合し、3ミクロン未満の平均粒径が得られるまでビードミルで粉砕する。

#### 【0181】

##### 製剤例2E

乳化性濃縮懸濁液は次の組成で製造される：

|              |       |
|--------------|-------|
| 活性成分         | 30.0% |
| Ethylan BCP  | 10.0% |
| Bentone 38   | 0.5%  |
| Solvesso 150 | 59.5% |

30

各成分をよく混合し、3ミクロン未満の平均粒径が得られるまでビードミルで粉砕する。

#### 【0182】

##### 製剤例2F

水分散性顆粒剤は次の組成で製造される：

|             |     |
|-------------|-----|
| 活性成分        | 30% |
| Darvan No 2 | 15% |
| Arylan S    | 8%  |
| Celite PF   | 47% |

40

各成分を混合し、流体エネルギーミルで超微粉砕し、次に水(10%まで)を吹き付けることにより回転ペレタイザーで顆粒化する。得られる顆粒を流動層乾燥機で乾燥して過剰の水を除去する。

#### 【0183】

##### 製剤例2G

散布剤は次の組成で製造される：

|          |        |
|----------|--------|
| 活性成分     | 1～10%  |
| 超微細タルク粉末 | 99～90% |

50

各成分をよく混合し、必要に応じてさらに粉碎して微細粉末を得る。この粉末を節足動物が発生する場所、例えばごみ捨て場、貯蔵生産物または家財道具、あるいは節足動物が発生した、または発生する恐れがある動物に施用して経口摂取により節足動物を防除することができる。節足動物が発生する場所に散布剤をまくための適当な手段には送風機、ハンドシェーカーまたは家畜用自己処理装置がある。

#### 【0184】

##### 製剤例 2 H

食餌は次の組成で製造される：

|      |          |
|------|----------|
| 活性成分 | 0.1～1.0% |
| 小麦粉  | 80%      |
| 糖蜜   | 19.9～19% |

10

各成分をよく混合し、必要に応じて餌形態に形成する。この食餌を節足動物、例えばアリ、バッタ、ゴキブリまたはハエが発生する場所、例えば住宅または産業用建物、例えば台所、病院または店、あるいは屋外領域にまいて経口摂取により節足動物を防除することができる。

#### 【0185】

##### 製剤例 2 I

液剤は次の組成で製造される：

|            |     |
|------------|-----|
| 活性成分       | 15% |
| ジメチルスルホキシド | 85% |

20

活性成分を必要に応じて混合および／または加熱しながらジメチルスルホキシドに溶解する。この溶液を節足動物が発生した家畜にプアオン剤として経皮的に、またはポリテトラフルオロエチレン膜(0.22ミクロンの細孔径)を通して滅菌濾過した後に注射により、動物の体重100kgあたり1.2～12mlの溶液の施用量で施用することができる。

#### 【0186】

##### 製剤例 2 J

湿潤性粉末は次の組成で製造される：

|             |     |
|-------------|-----|
| 活性成分        | 50% |
| Ethylan BCP | 5%  |
| Aerosil     | 5%  |
| Celite PF   | 40% |

30

Ethylan BCPをAerosilに吸収させ、それを他の成分と混合し、ハンマーミルで粉碎して湿潤性粉末を得る。それを水で希釈して0.001重量%～2重量%の活性化合物の濃度にし、そして節足動物、例えば双翅目幼虫または植物線虫が発生する場所に散布により、あるいは節足動物が発生した、または発生する恐れがある家畜に散布または浸漬により、または飲料水の経口投与により施用して節足動物を防除することができる。

#### 【0187】

##### 製剤例 2 K

徐放性丸剤は次の成分を必要に応じて様々な割合（前記組成物で記載したものと同様）で含有する顆粒から形成される：

40

|       |
|-------|
| 活性成分  |
| 密度調整剤 |
| 徐放性物質 |
| 結合剤   |

各成分をよく混合して顆粒に形成し、それを圧縮して比重が2以上の丸剤にする。これを反芻動物に経口投与すると蜂巢胃－前胃の中で保持し、長時間にわたって継続的に活性化合物をゆっくりと放出して反芻動物の節足動物による浸襲を防除することができる。

#### 【0188】

##### 製剤例 2 L

顆粒剤、ペレット剤、ブリケット剤などの形態の徐放性組成物は次の組成で製造される

50

:

|                |          |
|----------------|----------|
| 活性成分           | 0.5～25%  |
| 塩化ポリビニル        | 75～99.5% |
| フタル酸ジオクチル(可塑剤) |          |

各成分をブレンドし、溶融押出または成形により適当な形状に形成する。これらの組成物は持続放出により害虫を防除するために例えば貯留水への添加、あるいは家畜に取付ける首輪または耳標の製造において有用である。

## 【0189】

## 製剤例 2 M

水分散性顆粒剤は次の組成で製造される：

10

|             |         |
|-------------|---------|
| 活性成分        | 85%(最大) |
| ポリビニルピロリドン  | 5%      |
| アタパルジャイトクレー | 6%      |
| ラウリル硫酸ナトリウム | 2%      |
| グリセリン       | 2%      |

各成分を45%スラリーとして水と混合し、湿式粉碎して4ミクロンの粒径にし、噴霧乾燥して水を除去する。

## 【0190】

## 農薬の使用法

本発明の化合物を使用して次の典型的な試験法を行なって本発明の化合物の殺寄生生物および農薬活性を測定した。

20

方法A：ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対する本化合物の浸透性を試験するスクリーニング法

試験容器に10匹のネコノミ成虫を入れた。ガラスシリンダーの一端をパラフィルムで密閉し、試験容器の上部に置いた。次に、試験化合物の溶液をピペットでウシ血に入れ、それをガラスシリンダーに加えた。処理したネコノミをこの擬似イヌ試験(血液37℃、相対湿度40～60%；ネコノミ20～22℃、相対湿度40～60%)に付し、施用して24および48時間後に評価した。

化合物番号1-2、1-8、1-9、1-10、1-14、1-15、1-16、1-17、1-19、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、2-2、2-8、2-9、2-10、2-14、2-16、2-17、2-19、2-35、2-36および3-19は5ppm以下の試験濃度でネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を少なくとも90%防除した。

30

## 【0191】

方法B：根切り虫 (*Diabrotica undecimpunctata*；サザンコーンルートワーム) のスクリーニング

施用2日前、トウモロコシの種子を早い発芽を引き起こす暖かい条件下で水に浸漬した。施用1日前、根切り虫の卵をプラスチック製ペトリ皿に入れた日本製ろ紙の半分に移した。その後、発芽したトウモロコシの種子をろ紙の側にある湿ったパッドの上に置いた。3滴の200μlの試験化合物溶液を注意深くピペットで卵の上にかけた。残りの溶液をトウモロコシにかけてペトリ皿を密閉した。ペトリ皿の処理した卵を人工気候室に6日間置いた。施用して6日後に双眼顕微鏡を使用して化合物の効力(未処理の対照と比較した死んだ卵および／または幼虫の百分率)を評価した。

40

化合物番号1-17、1-19、1-35、1-36、1-38、1-39、2-9、2-19、2-35および2-36は10ppmの試験濃度で根切り虫 (*Diabrotica undecimpunctata*) を少なくとも90%防除した。

## 【0192】

方法C：イネツマグロヨコバイ (*Nephotettix Cinciceps*) のスクリーニング

8cmの茎長を有する12の稲苗の葉を配合した試験化合物の水溶液に5秒間浸漬した。溶液を流出させた後、このように処理した稲苗をペトリ皿に入れ、約20匹のツマグロヨコバイ幼虫(L3期)を生息させた。ペトリ皿を密閉し、人工気候室(16時間の照明/日、25℃、相対

50

湿度40～60%)で保存した。6日間の保存後、ツマグロヨコバイ幼虫の死亡率を測定した。

化合物番号1-8、1-9、1-19、1-35、1-37、2-2、2-8、2-19および2-36は100ppmの試験濃度でツマグロヨコバイ (*Nephotettix Cinciceps*) 幼虫に対して少なくとも98%の死亡率を示した。

【0193】

方法D：ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対する接触活性を試験するスクリーニング法

試験化合物の溶液をろ紙に滴下し、乾燥し、ろ紙を試験管に入れ、10匹のネコノミ成虫をたからせた。処理したネコノミを人工気候室(26℃、相対湿度80%)に入れ、施用して24および48時間後に有効率を未処理の対照と比較して評価した。

10

化合物番号1-2、8-2および8-10は1000ppmの試験濃度でネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して少なくとも70%の接触防除を示した。

【0194】

方法E：クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対する接触活性を試験するスクリーニング法

試験化合物の溶液をろ紙に滴下し、乾燥し、ろ紙を試験管に入れ、20～30匹のクリイロコイタマダニ幼虫(L1)をたからせ、試験管をクリップで密閉した。処理したクリイロコイタマダニを人工気候室(25℃、相対湿度90%)に入れ、施用して24時間後に有効率を未処理の対照と比較して評価した。

化合物番号1-2、3-3、8-8、8-10および8-22は100ppmの試験濃度でクリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して少なくとも70%の接触防除を示した。

20

## 【国際調査報告】

| INTERNATIONAL SEARCH REPORT                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                            | International Application No.<br>PCT/EP 03/02010                     |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------|
| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>IPC 7 C07D231/44 C07D409/12 C07D401/04 A01N43/56                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                            |                                                                      |
| According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                            |                                                                      |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>IPC 7 C07D A01N                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                            |                                                                      |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                            |                                                                      |
| Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                                                                                                            |                                                                      |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                            |                                                                      |
| Category *                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                         | Relevant to claim No.                                                |
| X                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | WO 98 28278 A (RHONE POULENC AGROCHEMIE)<br>2 July 1998 (1998-07-02)<br>page 41, line 30 -page 42, line 4<br>Reference example 14<br>----- | 5, 6, 9                                                              |
| <input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                            |                                                                      |
| * Special categories of cited documents :<br>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance<br>"E" earlier document but published on or after the international filing date<br>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)<br>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means<br>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed<br>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention<br>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone<br>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.<br>"&" document member of the same patent family |                                                                                                                                            |                                                                      |
| Date of the actual completion of the international search<br><br>14 May 2003                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                            | Date of mailing of the international search report<br><br>10. 07. 03 |
| Name and mailing address of the ISA<br>European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2<br>NL - 2280 HV Rijswijk<br>Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,<br>Fax: (+31-70) 340-2016                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                            | Authorized officer<br><br>Fort, M                                    |

## FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

## 1. Claims: 1-9

A method of controlling parasites in or on an animal comprising administering to the animal a parasitically amount of a 5-substituted-alkylaminoderivative of formula (I) as defined in claim 1, the use of compounds of formula (I) for the control of parasites in or on animals or for preparing a veterinary medicament, a pesticidal composition comprising a compound of formula (I) and 5-substituted-alkylaminopyrazole derivatives of formula (I) with the substituents R1, W, R2, R3, A, R5, R6 as defined in claims 4-6,

## 2. Claim : 10(partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to a)

## 3. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to b)

## 4. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to c)

## 5. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to d)

## 6. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to e)

## 7. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I) according to f)

## 8. Claim : 10 (partially)

International Application No. PCT /EP03/02010

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

A process for the preparation of a compound of formula (I)  
according to g)

9. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I)  
according to h)

10. Claim : 10 (partially)

A process for the preparation of a compound of formula (I)  
according to i)

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/EP 03/02010**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
  
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see additional sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
  
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
  
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-9

**Remark on Protest**

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/02010

| Patent document<br>cited in search report | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|-------------------------------------------|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 9828278 A                              | 02-07-1998          | AP 1039 A                  | 23-01-2002          |
|                                           |                     | AT 224877 T                | 15-10-2002          |
|                                           |                     | AU 745770 B2               | 28-03-2002          |
|                                           |                     | AU 5759998 A               | 17-07-1998          |
|                                           |                     | BG 103591 A                | 30-11-2000          |
|                                           |                     | BR 9714187 A               | 29-02-2000          |
|                                           |                     | CN 1316424 A               | 10-10-2001          |
|                                           |                     | CN 1245492 A ,B            | 23-02-2000          |
|                                           |                     | CZ 9902283 A3              | 17-11-1999          |
|                                           |                     | DE 69715911 D1             | 31-10-2002          |
|                                           |                     | DE 69715911 T2             | 28-05-2003          |
|                                           |                     | DK 948485 T3               | 03-02-2003          |
|                                           |                     | EE 9900322 A               | 15-06-2000          |
|                                           |                     | EG 21703 A                 | 27-02-2002          |
|                                           |                     | WO 9828278 A1              | 02-07-1998          |
|                                           |                     | EP 0948485 A1              | 13-10-1999          |
|                                           |                     | ES 2179386 T3              | 16-01-2003          |
|                                           |                     | HR 970704 A1               | 31-10-1998          |
|                                           |                     | HU 0000482 A2              | 28-06-2000          |
|                                           |                     | JP 2001507002 T            | 29-05-2001          |
|                                           |                     | NZ 336419 A                | 30-03-2001          |
|                                           |                     | PL 334282 A1               | 14-02-2000          |
|                                           |                     | SK 85999 A3                | 16-05-2000          |
|                                           |                     | TR 9901472 T2              | 22-11-1999          |
|                                           |                     | TW 476757 B                | 21-02-2002          |
|                                           |                     | US 2002045758 A1           | 18-04-2002          |
|                                           |                     | US 6350771 B1              | 26-02-2002          |
|                                           |                     | ZA 9711534 A               | 24-06-1998          |

## フロントページの続き

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

(72)発明者 ヘンリークス・マリーア・マーティース・バスティアーンズ  
ドイツ連邦共和国 6 1 2 5 0 ウージンゲン. パートロマエウス・アーノルディーシュトラッセ 3 5

(72)発明者 アンケ・クールマン  
ドイツ連邦共和国 6 5 8 2 4 シュヴァルバッハ・アム・タウヌス. アム・ブラーター 1 1

(72)発明者 マリーア・テレジア・ターネセン  
ドイツ連邦共和国 5 5 2 6 2 ハイデスハイム. フラウエンロープシュトラッセ 1 0

(72)発明者 シュテファン・シュナッテラー  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 9 5 ハッテルスハイム. シラーリング 1 0

(72)発明者 ウーヴェ・デラー  
ドイツ連邦共和国 6 3 1 1 0 ロートガウ. クリстіアン・モルゲンシュテルン・シュトラッセ 1 1

(72)発明者 ジャミン・フワーン  
アメリカ合衆国ノースカロライナ州 2 7 5 1 4. チャペルヒル・オールドフォレストクリークドライブ 2 3 3

(72)発明者 カール・ゼーガー  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム. タウヌス. シュヴァルベンヴェーク 9

(72)発明者 アンドルー・スクリプナー  
アメリカ合衆国ノースカロライナ州 2 7 7 0 5. ダラム・エリスフィールドドライブ 4 2 0 5

(72)発明者 アダルベルト・ア・ペレスデレオン  
アメリカ合衆国ノースカロライナ州 2 7 5 8 7. ウェイクフォレスト・サラトリッジコート 7 1 6

Fターム(参考) 4H011 AC01 AC02 AC03 AC04 BA01 BB09 BC03 BC18 BC19 BC20  
DA02 DA03 DA15 DD03 DD04 DD05 DD06 DD07 DF02 DH02