

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5285656号
(P5285656)

(45) 発行日 平成25年9月11日 (2013.9.11)

(24) 登録日 平成25年6月7日 (2013.6.7)

(51) Int.Cl.

F I

C O 7 C	57/72	(2006.01)	C O 7 C	57/72	C S P
C O 7 C	57/76	(2006.01)	C O 7 C	57/76	
C O 7 C	57/32	(2006.01)	C O 7 C	57/32	
C O 7 C	69/614	(2006.01)	C O 7 C	69/614	
C O 7 C	69/65	(2006.01)	C O 7 C	69/65	

請求項の数 3 (全 154 頁)

(21) 出願番号	特願2010-115238 (P2010-115238)
(22) 出願日	平成22年5月19日 (2010.5.19)
(62) 分割の表示	特願2000-533407 (P2000-533407) の分割
原出願日	平成11年2月17日 (1999.2.17)
(65) 公開番号	特開2010-174045 (P2010-174045A)
(43) 公開日	平成22年8月12日 (2010.8.12)
審査請求日	平成22年5月19日 (2010.5.19)
(31) 優先権主張番号	198 08 261.4
(32) 優先日	平成10年2月27日 (1998.2.27)
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)

(73) 特許権者	591063187 バイエル アクチエンゲゼルシャフト Bayer Aktiengesellschaft ドイツ連邦共和国レーフェルクゼン (番 地なし) D-51368 Leverkusen, Germany
(74) 代理人	110000741 特許業務法人小田島特許事務所
(72) 発明者	フオルカー・リープ ドイツ・デー-51375レーフェルク ゼン・アルフレートークビン-シュトラ セ1

最終頁に続く

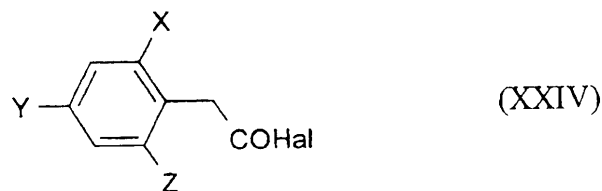
(54) 【発明の名称】 フェニル酢酸誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (XXIV)

【化 1】

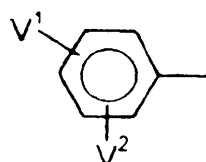


〔式中、

X はメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピルを表し、

Y は基

【化 2】



を表し、

V^1 は弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 $tert$ -ブチル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシを表し、

V^2 は水素、弗素、塩素、メチル、エチル、 n -プロピルまたはイソプロピルを表し、

Z はメチル、エチルまたは n -プロピルを表し、
そして

Halは塩素または臭素を表す]

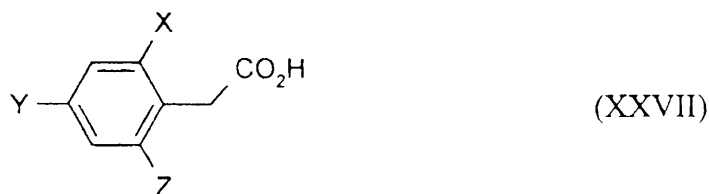
の化合物。

10

【請求項2】

式 (XXVII)

【化3】



20

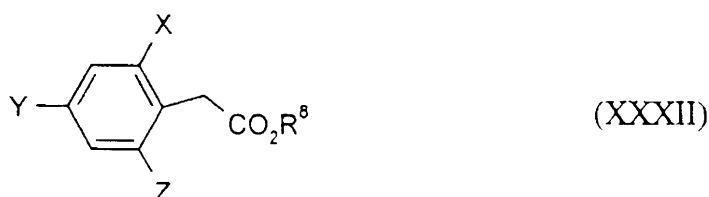
[式中、

X、YおよびZは各々請求項1で定義された通りである]
の化合物。

【請求項3】

式 (XXXII)

【化4】



30

[式中、

X、YおよびZは各々請求項1で定義された通りであり、そして
 R^8 はアルキルを表す]

の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

40

本発明は新規なアリールフェニル置換された環式ケトエノール類の製造のために有用な中間体化合物に関する。

【背景技術】

【0002】

3-アシルピロリジン-2, 4-ジオン類の薬学的性質はすでに記載されている (S. Suzuki et al. 非特許文献1)。さらに、 N -フェニルピロリジン-2, 4-ジオン類はR. SchmiereおよびH. Mildenerにより合成されている (非特許文献2)。これらの化合物の生物学的活性は記載されていない。

【0003】

特許文献1および特許文献2は同様な構造の化合物 (3-アリールピロリジン-2,

50

4-ジオン類)を開示しているが、それらの除草、殺昆虫または殺ダニ活性は知られていない。除草、殺昆虫または殺ダニ活性を有する未置換の二環式3-アリール-ピロリジン-2, 4-ジオン誘導体(特許文献3および特許文献4)並びに置換された単環式3-アリール-ピロリジン-2, 4-ジオン誘導体(特許文献5および特許文献6)は既知である。

【0004】

多環式3-アリールピロリジン-2, 4-ジオン誘導体(特許文献7)および1H-アリールピロリジン-ジオン誘導体も既知である(特許文献8、特許文献9、特許文献10、特許文献11、特許文献12、特許文献13、特許文献14、特許文献15、特許文献16、特許文献17、特許文献18、特許文献19、特許文献20および特許文献21、特許文献22)。

10

【0005】

ある種の置換された Δ^3 -ジヒドロフラン-2-オン誘導体が除草性を有することは既知である(特許文献23参照)。出発物質として使用されるテトロン酸(tetronic acid)誘導体(例えば、3-(2-メチルフェニル)-4-ヒドロキシ-5-(4-フルオロフェニル)- Δ^3 -ジヒドロフラン-2-オン)の合成も同様に特許文献23に記載されている。同様な構造の化合物は文献Campbell et al., 非特許文献3から既知であるが、殺昆虫および/または殺ダニ活性は述べられていない。さらに、除草、殺ダニおよび殺昆虫性を有する3-アリール- Δ^3 -ジヒドロフラン-2-オン誘導体は特許文献24、特許文献25、特許文献26、特許文献27、特許文献17、特許文献18、特許文献19、特許文献20および特許文献21、特許文献22から既知である。3-アリール- Δ^3 -ジヒドロチオフェン-2-オン誘導体も同様に既知である(特許文献26、特許文献17、特許文献19、特許文献20、特許文献21、特許文献22)。

20

【0006】

ある種の3H-ピラゾール-3-オン誘導体、例えば、1, 2-ジエチル-1, 2-ジヒドロ-5-ヒドロキシ-4-フェニル-3H-ピラゾール-3-オンまたは[5-オキソ-1, 2-ジフェニル-4-(p-スルホフェニル)-3-ピラゾリン-3-イル]-オキシ、二ナトリウム塩、またはp-(3-ヒドロキシ-5-オキソ-1, 2-ジフェニル-3-ピラゾリン-4-イル)-ベンゼンスルホン酸、も文献から既知である(非特許文献4または非特許文献5または非特許文献6参照)。しかしながら、これらの化合物の生物学的活性は記載されていない。

30

【0007】

さらに、4, 4', 4''-(5-ヒドロキシ-3-オキソ-1H-ピラゾール-1, 2, 4(3H)-トリイル)-トリス-ベンゼンスルホン酸が薬学的性質を有することも既知である(非特許文献7参照)。しかしながら、それが作物保護において使用されることは知られていない。

【0008】

さらに、特許文献28および特許文献29、特許文献30は除草、殺ダニおよび殺昆虫性を有する4-アリールピラゾリジン-3, 5-ジオン誘導体を記載している。さらに、4-アリールピラゾリジン類が知られ始めており、それらの殺菌・殺カビ性が記載されている(特許文献31、特許文献32、特許文献33、特許文献34)。

40

【0009】

フェニル環中で未置換のある種のフェニル-ピロン誘導体が知られ始めている(A. M. Chirazi, T. Kappe and E. Ziegler, 非特許文献8およびK.-H. Boltze and K. Heidenbluth, 非特許文献9参照)が、これらの化合物の有害生物防除剤としての可能性のある使用は述べられていない。フェニル環中で置換されそして除草、殺ダニおよび殺昆虫性を有するフェニル-ピロン誘導体は特許文献35、特許文献17、特許文献18、特許文献19、特許文献20、特許文献36、特許文献37および特許文献21、特許文献22に記載されている。

【0010】

50

フェニル環中で未置換のある種の5-フェニル-1, 3-チアジン誘導体はすでに知られ始めており(E. Ziegler and E. Steiner, 非特許文献10, R. Ketcham, T. Kappe and E. Ziegler, 非特許文献11参照)が、これらの化合物の有害生物防除剤としての可能性のある使用は述べられていない。フェニル環中で置換されそして除草、殺ダニおよび殺昆虫活性を有する5-フェニル-1, 3-チアジン誘導体は特許文献38、特許文献39、特許文献18、特許文献19、特許文献20、特許文献21に記載されている。

【0011】

ある種の置換された2-アリアルシクロペンタジオン類が除草および殺ダニ剤性を有することは既知である(例えば、特許文献40、特許文献41、特許文献42、特許文献43、特許文献44、特許文献45、特許文献46、特許文献47および特許文献48参照)。さらに、同様な構造を有する化合物も既知であり、3-ヒドロキシ-5, 5-ジメチル-2-フェニルシクロペンテ-2-エン-1-オンは文献Micklefield et al., 非特許文献12からそして天然生成物であるインボルチン(involute) (1-シス-5-(3, 4-ジヒドロキシフェニル)-3, 4-ジヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-シクロペンテ-2-エン-オンは文献Edwards et al., 非特許文献13から既知である。殺昆虫または殺ダニ活性は記載されていない。さらに、2-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1, 3-インダンジオンは文献非特許文献14および特許文献49から既知であり、除草および殺ダニ活性が述べられている。

【0012】

ある種の置換された2-アリアルシクロヘキサジオン類が除草および殺ダニ性を有することは既知である(例えば、特許文献50、特許文献51、特許文献52、特許文献53、特許文献54、特許文献55、特許文献56、特許文献57、特許文献58、特許文献59、特許文献60、特許文献61、特許文献62、特許文献63、特許文献64、およびWheeler, T. N., 非特許文献15参照)。

【0013】

しかしながら、これらの化合物の活性および活性範囲は、特に低い適用割合および濃度においては、必ずしも完全に満足のいくものではない。さらに、これらの化合物と植物との相容性も必ずしも常に満足のいくものではない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0014】

【特許文献1】EP-A-0 262 399

【特許文献2】GB-A-2 266 888

【特許文献3】EP-A-355 599

【特許文献4】EP-415 211

【特許文献5】EP-A-377 893

【特許文献6】EP-442 077

【特許文献7】EP-442 073

【特許文献8】EP-456 063

【特許文献9】EP-521 334

【特許文献10】EP-596 298

【特許文献11】EP-613 884

【特許文献12】EP-613 885

【特許文献13】WO 94/01 997

【特許文献14】WO 95/26 954

【特許文献15】WO 95/20 572

【特許文献16】EP-A-0 668 267

【特許文献17】WO 96/25 395

10

20

30

40

50

【特許文献18】	WO	96/35	664	
【特許文献19】	WO	97/01	535	
【特許文献20】	WO	97/02	243	
【特許文献21】	WO	97/36	868	
【特許文献22】	WO	98/05	638	
【特許文献23】	DE-A-4	014	420	
【特許文献24】	EP-A-5	28	156	
【特許文献25】	EP-A-0	647	637	
【特許文献26】	WO	95/26	345	
【特許文献27】	WO	96/20	196	10
【特許文献28】	EP-5	08	126	
【特許文献29】	WO	92/16	510	
【特許文献30】	WO	96/21	652	
【特許文献31】	WO	96/36	229	
【特許文献32】	WO	96/36	615	
【特許文献33】	WO	96/36	616	
【特許文献34】	WO	96/36	633	
【特許文献35】	EP-A-5	88	137	
【特許文献36】	WO	97/16	436	
【特許文献37】	WO	97/19	941	20
【特許文献38】	WO	94/14	785	
【特許文献39】	WO	96/02	539	
【特許文献40】	US-4	283	348	
【特許文献41】	4	338	122	
【特許文献42】	4	436	666	
【特許文献43】	4	526	723	
【特許文献44】	4	551	547	
【特許文献45】	4	632	698	
【特許文献46】	WO	96/01	798	
【特許文献47】	WO	96/03	366	30
【特許文献48】	WO	97/14	667	
【特許文献49】	Offenlegungsschrift	DE-2	361 084	
【特許文献50】	US-4	175	135	
【特許文献51】	4	209	432	
【特許文献52】	4	256	657	
【特許文献53】	4	256	658	
【特許文献54】	4	256	659	
【特許文献55】	4	257	858	
【特許文献56】	4	283	348	
【特許文献57】	4	303	669	40
【特許文献58】	4	351	666	
【特許文献59】	4	409	153	
【特許文献60】	4	436	666	
【特許文献61】	4	526	723	
【特許文献62】	4	613	617	
【特許文献63】	4	659	372	
【特許文献64】	DE-2	813	341	
【非特許文献】				
【0015】				
【非特許文献1】	Chem. Pharm. Bull.	15	1120 (1967)	50

【非特許文献2】Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095

【非特許文献3】J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76

【非特許文献4】J. Heterocycl. Chem., 25(5), 1301-1305, 1988

【非特許文献5】J. Heterocycl. Chem., 25(5), 1307-1310, 1988

【非特許文献6】Zh. Obshch. Khim., 34(7), 2397-2402, 1964

【非特許文献7】Farmakol. Toksikol. (Moscow), 38(2) 10, 180-186, 1976

【非特許文献8】Arch. Pharm. 309, 558 (1976)

【非特許文献9】Chem. Ber. 91, 2849

【非特許文献10】Monatsh. 95, 147 (1964)

【非特許文献11】J. Heterocycl. Chem 10, 223 (1973)

【非特許文献12】Tetrahedron, (1992), 7519-26

【非特許文献13】J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9

【非特許文献14】J. Economic Entomology, 66, (1973), 584

【非特許文献15】J. Org. Chem. 44, 4906 (1979) 20

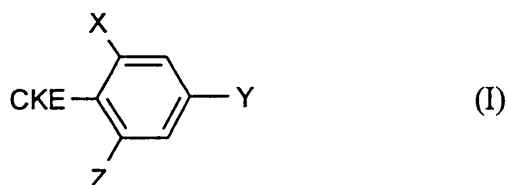
【発明の概要】

【0016】

本発明は、従って、式(I)

【0017】

【化1】



30

【0018】

[式中、

Xはハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ニトロ、シアノ、または各場合とも場合により置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルアルコキシもしくはフェニルアルキルチオを表し、

Yは各場合とも場合により置換されていてもよいシクロアルキル、アリールまたはヘタリールを表し、

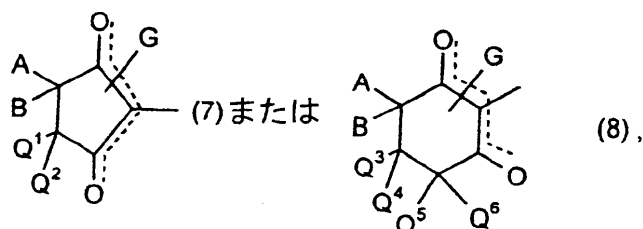
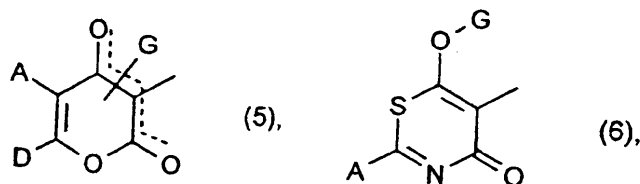
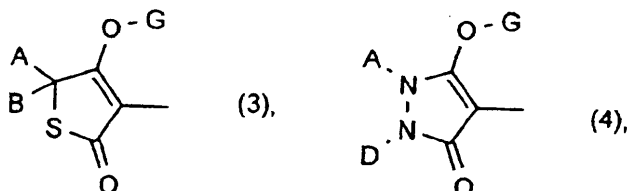
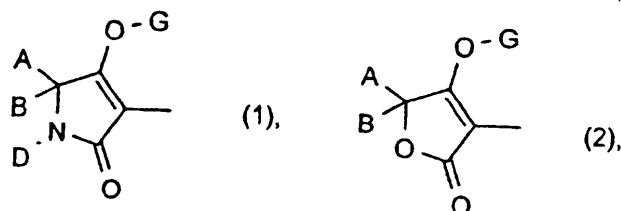
40

Zは水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、ハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルケニルオキシ、ニトロまたはシアノを表し、

C K Eは基

【0019】

【化 2】



【0020】

の1つを表し、
ここで

Aは水素、各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、ポリアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、場合により少なくとも1個の環原子がヘテロ原子により置換されていてもよい飽和もしくは不飽和の場合により置換されていてもよいシクロアルキル、または各場合とも場合によりハロゲン—アルキル、ハロゲノアルキル、アルコキシ、ハロゲノアルコキシ、シアノーもしくはニトロ—置換されていてもよいアリール、アリールアルキルもしくはヘタリールを表し、

Bは水素、アルキルまたはアルコキシアルキルを表し、或いは

AおよびBはそれらが結合している炭素原子と一緒に、場合により少なくとも1個のヘテロ原子を含有していてもよい飽和もしくは不飽和の未置換または置換された環を表し、

Dは水素、またはアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、ポリアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、1個もしくはそれ以上の環員が場合によりヘテロ原子により置換されていてもよい飽和もしくは不飽和のシクロアルキル、アリールアルキル、アリール、ヘタリールアルキルもしくはヘタリールよりなる系から選択される場合により置換されていてもよい基を表し、或いはAおよびDがそれらが結合している原子と一緒に、A、D部分で未置換であるかまたは置換されており且つ (CKE = (4) で

ある場合には) 場合により少なくとも 1 個の別のヘテロ原子を含有してもよい飽和もしくは不飽和の環を表し、或いは

A および Q^1 は一緒になって、アルカンジイルまたはアルケンジイルを表し、それらの各々は場合により各場合とも場合により置換されていてもよいアルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルチオ、シクロアルキル、ベンジルオキシまたはアリールにより置換されていてもよく、或いは

Q^1 は水素またはアルキルを表し、

Q^2 、 Q^4 、 Q^5 および Q^6 は互いに独立して各々が水素またはアルキルを表し、

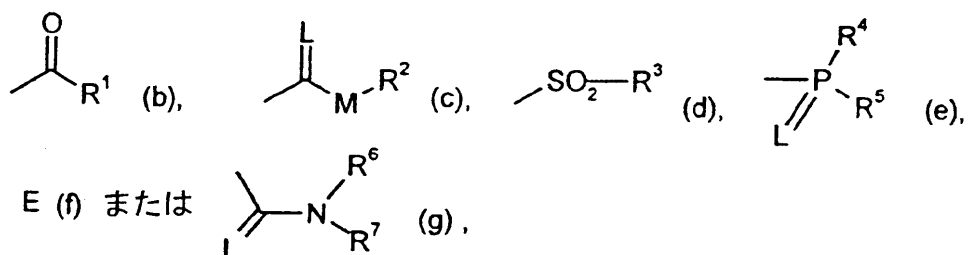
Q^3 は水素、アルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、場合により置換されていてもよいシクロアルキル (ここで場合により 1 個のメチレン基は酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい) または場合により置換されていてもよいフェニルを表し、或いは

Q^3 および Q^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に場合によりヘテロ原子を含有してもよい飽和もしくは不飽和の未置換または置換された環を表し、

G は水素 (a) を表すかまたは基

【0021】

【化3】



【0022】

の 1 つを表し、

ここで

E は金属イオンまたはアンモニウムイオンを表し、

L は酸素または硫黄を表し、

M は酸素または硫黄を表し、

R^1 は各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、ポリアルコキシアルキル、または 1 個もしくはそれ以上のメチレン基がヘテロ原子で置換されていることができる場合によりハロゲン—、アルキル—もしくはアルコキシ—置換されていてもよいシクロアルキル、各場合とも場合により置換されていてもよいフェニル、フェニルアルキル、ヘタリール、フェノキシアルキルもしくはヘタリールオキシアルキルを表し、

R^2 は各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、ポリアルコキシアルキルを表し、或いは各場合とも場合により置換されていてもよいシクロアルキル、フェニルまたはベンジルを表し、

R^3 、 R^4 および R^5 は互いに独立して各々が各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、アルケニルチオ、シクロアルキルチオを表し、そして各場合とも場合により置換されていてもよいフェニル、ベンジル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、

R^6 および R^7 は互いに独立して各々が水素、各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルコキシ、アルコキシアルキルを表し、場合により置換されていてもよいフェニルを表し、場合により置換されていてもよいベンジルを表し、或いはそれらが結合している窒素原子と一緒に場合により酸素または硫黄により中断されていてもよい環を表す]

の新規な化合物を提供する。

【0023】

とりわけ、置換基の性質により、式（I）の化合物は幾何学のおよび／もしくは光学的異性体または種々の組成の異性体の混合物として存在することができ、それらは、所望するなら、一般的方法で分離することができる。本発明は純粋な異性体および異性体混合物の両者、それらの製造および使用、並びにそれらを含んでなる組成物を提供する。しかしながら、以下では、簡単にするために式（I）の化合物と常に称するが、純粋な化合物および、適宜、種々の割合の異性体化合物を有する混合物の両者が意図される。

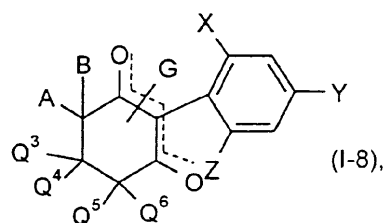
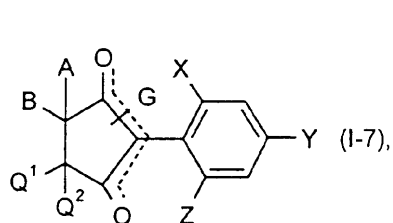
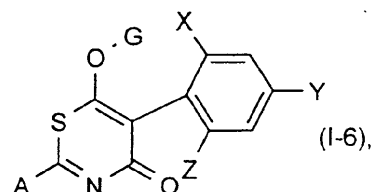
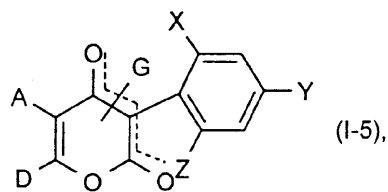
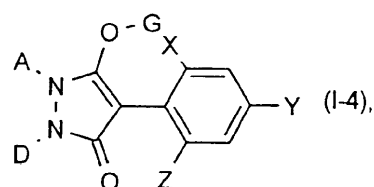
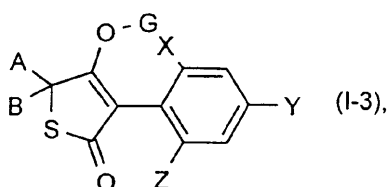
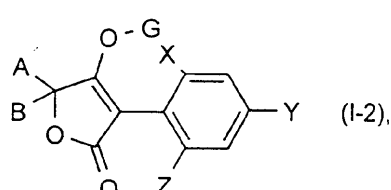
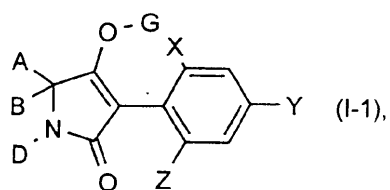
【発明を実施するための形態】

【0024】

基CKEの意味（1）～（8）を含み、下記の主な構造（I-1）～（I-8）が生ずる：

【0025】

【化4】



【0026】

〔式中、

A、B、D、G、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕。

【0027】

基Gの種々の意味（a）、（b）、（c）、（d）、（e）、（f）および（g）を含み、CKEが基（1）を表す場合には、下記の主な構造（I-1-a）～（I-1-g）を生ずる：

10

20

30

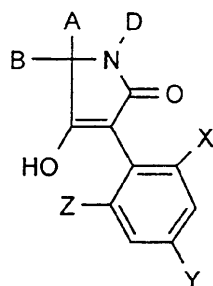
40

50

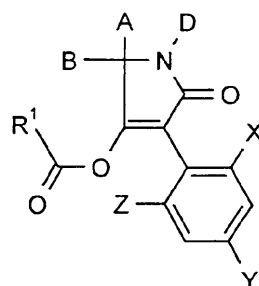
【 0 0 2 8 】

【化 5】

(I-1-a):

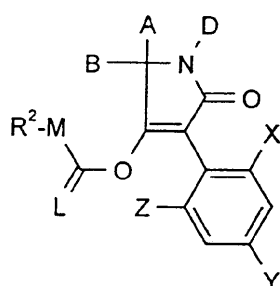


(I-1-b):

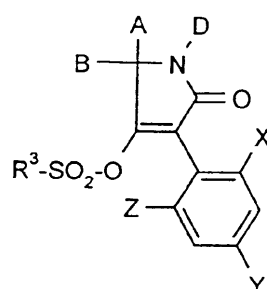


10

(I-1-c):

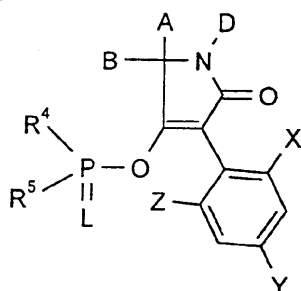


(I-1-d):

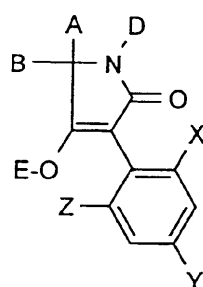


20

(I-1-e):

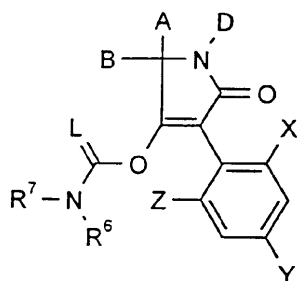


(I-1-f):



30

(I-1-g):



40

【 0 0 2 9 】

〔式中、

A、B、D、E、L、M、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は各々上記で定義されている通りである〕。

【 0 0 3 0 】

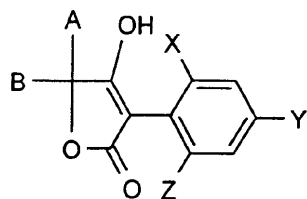
基Gの種々の意味 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) および (g) を含み、CKEが基(2)を表す場合には、下記の主な構造 (I-2-a) ~ (I-2-g) を生ずる：

50

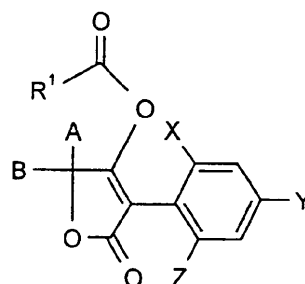
【 0 0 3 1 】

【 化 6 】

(I-2-a):

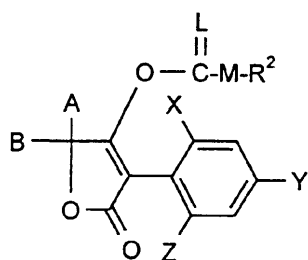


(I-2-b):

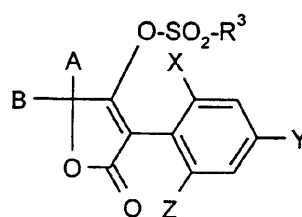


10

(I-2-c):

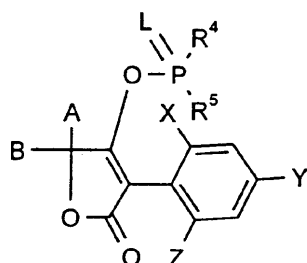


(I-2-d):

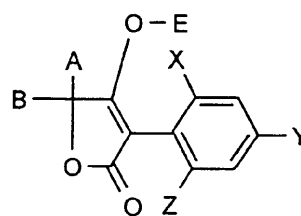


20

(I-2-e):

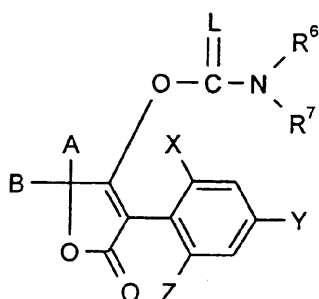


(I-2-f):



30

(I-2-g):



in which

40

【 0 0 3 2 】

〔 式中、

A、B、E、L、M、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は各々上記で定義されている通りである〕。

【 0 0 3 3 】

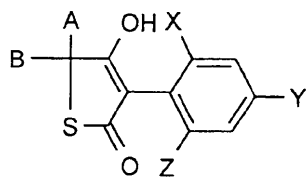
基Gの種々の意味 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) および (g) を含み、CKEが基(3)を表す場合には、下記の主な構造 (I-3-a) ~ (I-3-g) を生ずる：

50

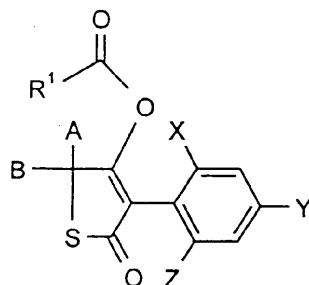
【 0 0 3 4 】

【 化 7 】

(I-3-a):

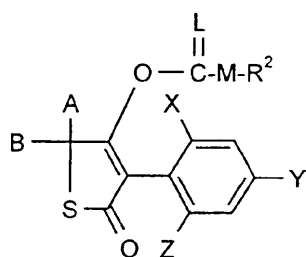


(I-3-b):

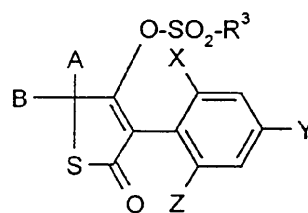


10

(I-3-c):

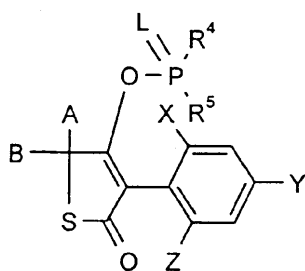


(I-3-d):

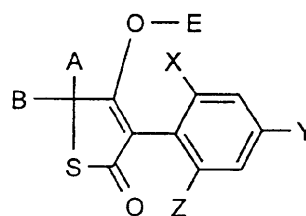


20

(I-3-e):

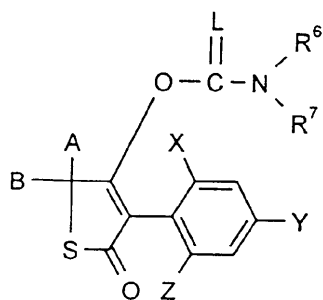


(I-3-f):



30

(I-3-g):



40

【 0 0 3 5 】

〔 式中、

A、B、E、L、M、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は各々上記で定義されている通りである〕。

50

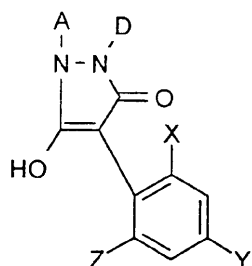
【0036】

基Gの種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)および(g)を含み、CKEが基(4)を表す場合には、下記の主な構造(I-4-a)～(I-4-g)を生ずる：

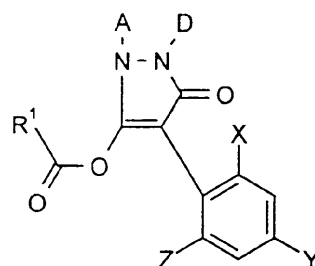
【0037】

【化8】

(I-4-a):

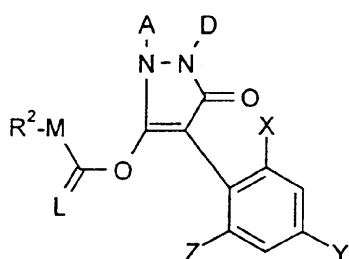


(I-4-b):

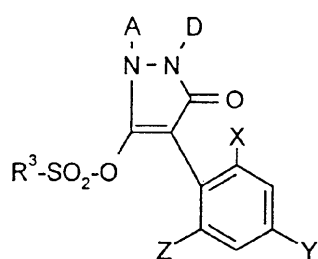


10

(I-4-c):

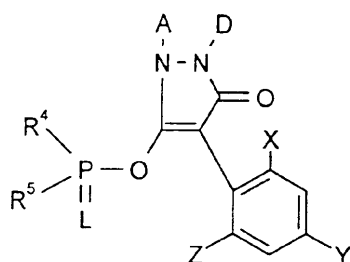


(I-4-d):

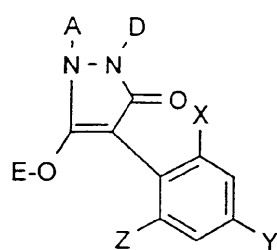


20

(I-4-e):

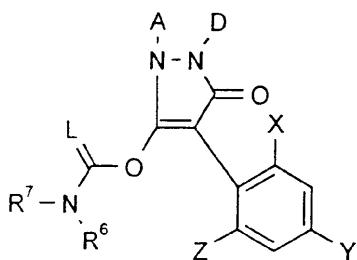


(I-4-f):



30

(I-4-g):



40

【0038】

〔式中、

A、D、E、L、M、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は各々上記で定義されている通りである〕。

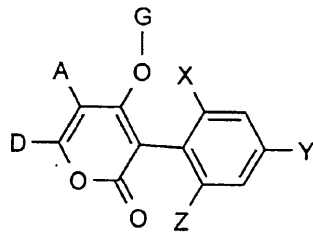
50

【0039】

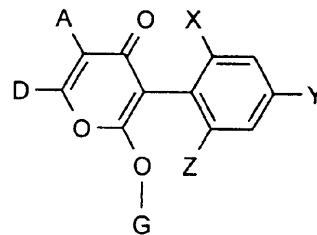
置換基 G の位置により、式 (I-5) の化合物は式 (I-5-A) および (I-5-B)

【0040】

【化9】



(I-5-A)



(I-5-B)

10

【0041】

の2種の異性体形態で存在することができ、これは式 (I-5) において点線により示されることを意味する。

【0042】

式 (I-5-A) および (I-5-B) の化合物は混合物としておよびそれらの純粋な異性体の形態の両方で存在することができる。式 (I-5-A) および (I-5-B) の化合物の混合物は、所望するなら、それ自体は既知である方法で、物理的方法により、例えばクロマトグラフィー方法により分離することができる。

20

【0043】

平明にするために、以下では各場合とも可能な異性体の1種だけが示される。これはこの化合物が、適宜、異性体混合物の形態または各々の他の異性体形態で存在できることを除外するものではない。

【0044】

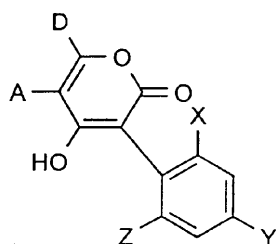
基 G の種々の意味 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) および (g) を含み、CKE が基 (5) を表す場合には、下記の主な構造 (I-5-a) ~ (I-5-g) を生ずる：

30

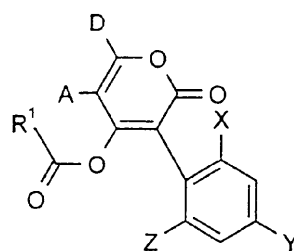
【0045】

【化 10】

(I-5-a):

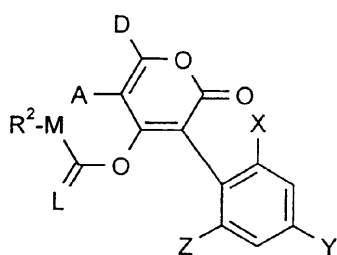


(I-5-b):

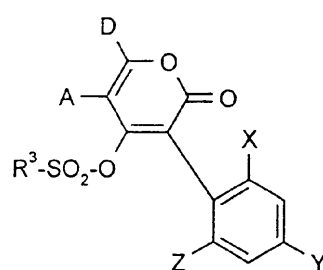


10

(I-5-c):

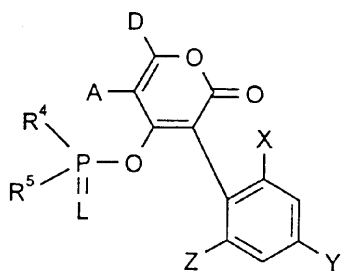


(I-5-d):

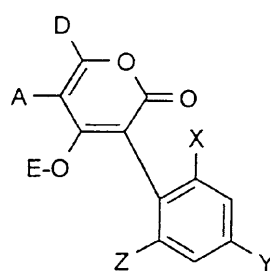


20

(I-5-e):

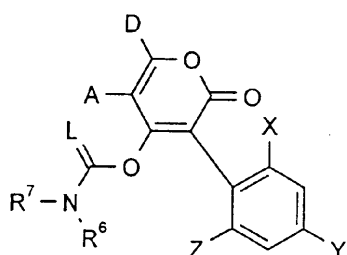


(I-5-f):



30

(I-5-g):



40

【0046】

〔式中、

A、D、E、L、M、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は各々上記で定義されている通りである〕。

【0047】

基Gの種々の意味 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f) および (g) を含み、CKEが基(6)を表す場合には、下記の主な構造 (I-6-a) ~ (I-6-g)

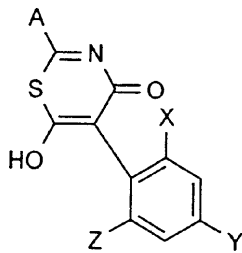
50

を生ずる：

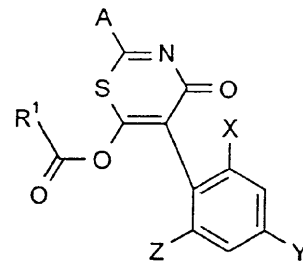
【 0 0 4 8 】

【 化 1 1 】

(I-6-a):

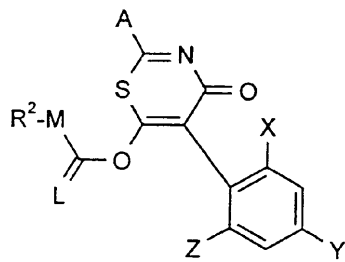


(I-6-b):

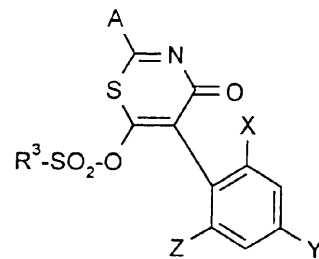


10

(I-6-c):

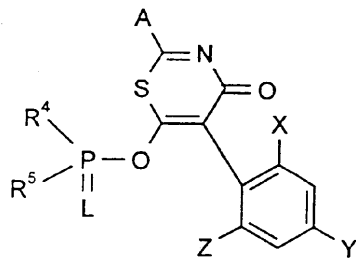


(I-6-d):

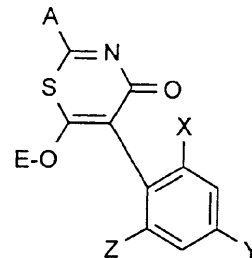


20

(I-6-e):

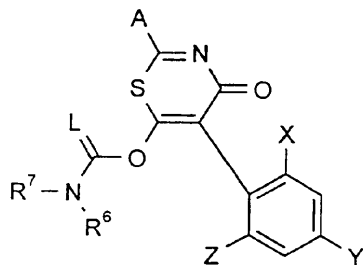


(I-6-f):



30

(I-6-g):



40

【 0 0 4 9 】

[式中、

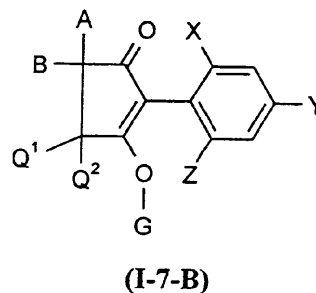
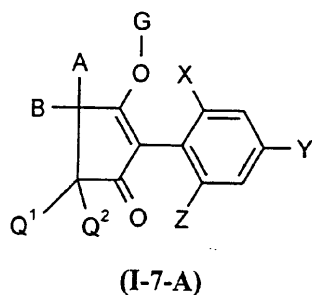
A、E、L、M、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は各々上記で定義されている通りである]。

【 0 0 5 0 】

置換基 G の位置により、式 (I-7) の化合物は式 (I-7-A) および (I-7-B)

【 0 0 5 1 】

【化 1 2】



10

【0052】

の2種の異性体形態で存在することができ、これは式(1)において点線により示されることを意味する。

【0053】

式(I-7-A)および(I-7-B)の化合物は混合物としておよびそれらの純粋な異性体の形態の両方で存在することができる。式(I-7-A)および(I-7-B)の化合物の混合物は、所望するなら、物理的方法により、例えばクロマトグラフィー方法により分離することができる。

【0054】

平明にするために、以下では各場合とも可能な異性体の1種だけが示される。これはこの化合物が、適宜、異性体混合物の形態または各々の他の異性体形態で存在できることを除外するものではない。

20

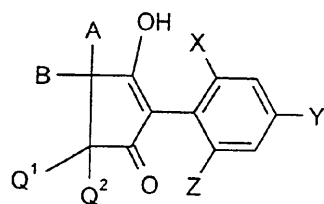
【0055】

基Gの種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)および(g)を含み、下記の主な構造(I-7-a)～(I-7-g)を生ずる：

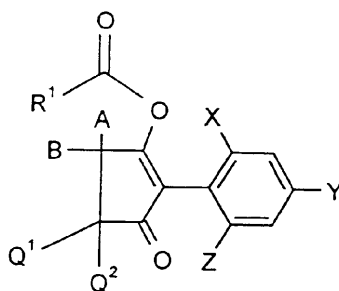
【0056】

【化 1 3】

(I-7-a):

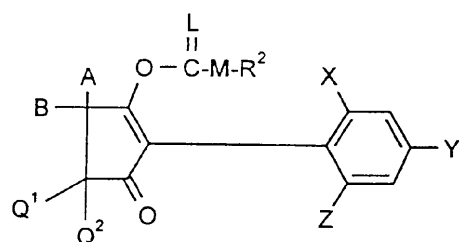


(I-7-b):

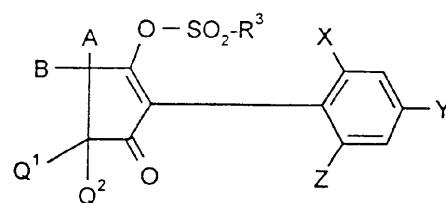


10

(I-7-c):

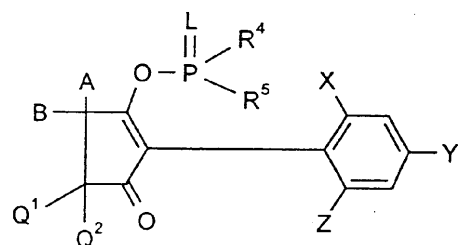


(I-7-d):

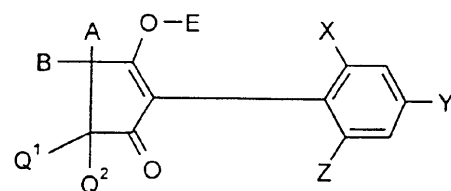


20

(I-7-e):

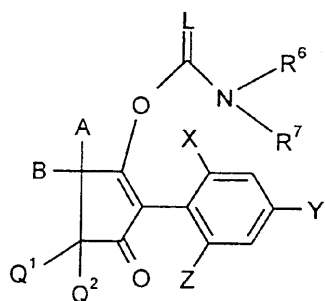


(I-7-f):



30

(I-7-g):



40

【0057】

〔式中、

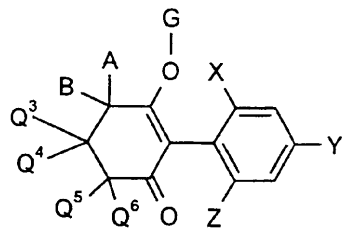
A、B、Q¹、Q²、E、L、M、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は各々上記で定義されている通りである〕。

【0058】

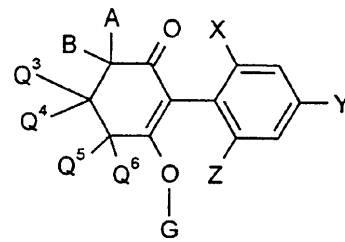
置換基Gの位置により、式(I-8)の化合物は式(I-8-A)および(I-8-B)

【0059】

【化 1 4】



(I-8-A)



(I-8-B)

10

【0060】

の2種の異性体形態で存在することができ、これは式(1)において点線により示されることを意味する。

【0061】

式(I-8-A)および(I-8-B)の化合物は混合物としておよびそれらの純粋な異性体の形態の両方で存在することができる。式(I-8-A)および(I-8-B)の化合物の混合物は、所望するなら、物理的方法により、例えばクロマトグラフィー方法により分離することができる。

【0062】

20

平明にするために、以下では各場合とも可能な異性体の1種だけが示される。これはこれらの化合物が異性体混合物の形態または各々の他の異性体形態で存在できることを除外するものではない。

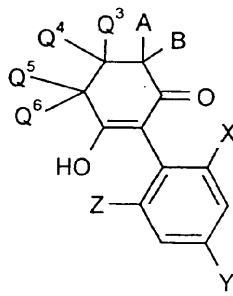
【0063】

基Gの種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)および(g)を含み、下記の主な構造(I-8-a)～(I-8-g)を生ずる：

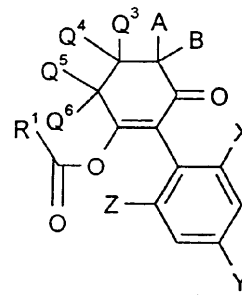
【0064】

【化 1 5】

(I-8-a):

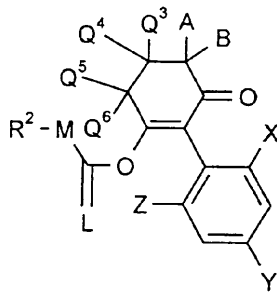


(I-8-b):

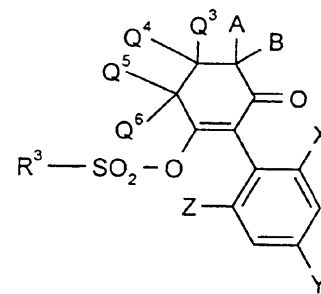


10

(I-8-c):

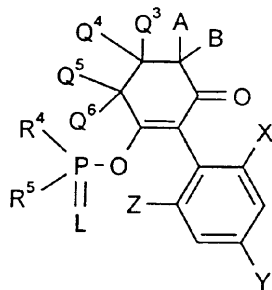


(I-8-d):

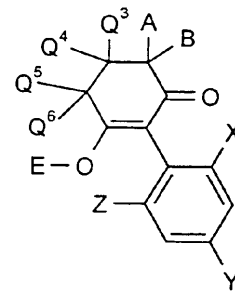


20

(I-8-e):

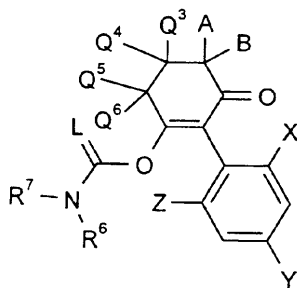


(I-8-f):



30

(I-8-g):



40

【0065】

〔式中、

A、B、E、L、M、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は各々上記で定義されている通りである〕。

【0066】

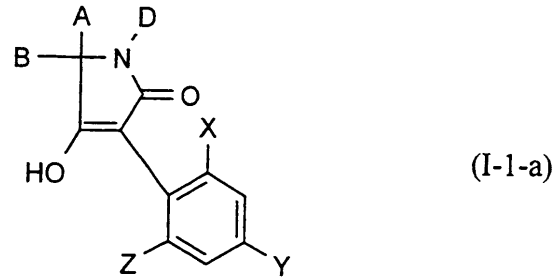
さらに、式 (I) の新規な化合物が下記の方法の 1 つにより得られることも見いだされた：

(A) 式 (I-1-a)

【0067】

50

【化 1 6】



10

【0068】

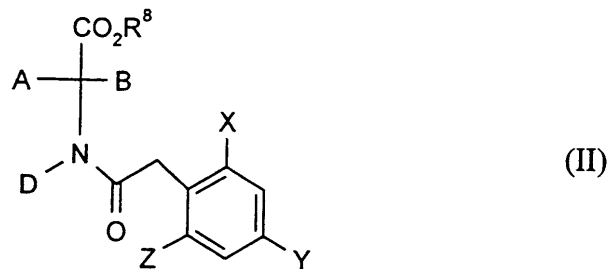
〔式中、

A、B、D、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕

の置換された3-フェニルピロリジン-2, 4-ジオン類またはそれらのエノール類は、希釈剤の存在下および塩基の存在下で式 (I I)

【0069】

【化 1 7】



20

【0070】

〔式中、

A、B、D、X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、

そして

R⁸はアルキル（好ましくはC₁-C₆-アルキル）を表す〕

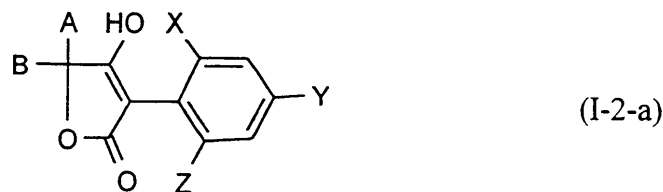
30

のN-アシルアミノ酸エステル類を分子間縮合させる時に得られる。

(B) さらに、式 (I-2-a)

【0071】

【化 1 8】



40

【0072】

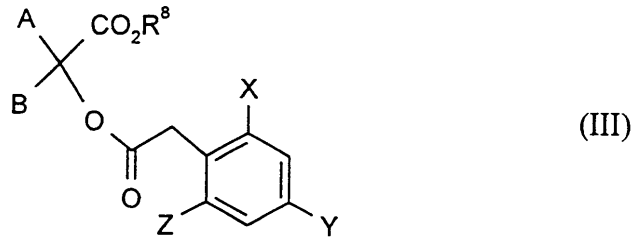
〔式中、

A、B、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕

の置換された3-フェニル-4-ヒドロキシ-Δ³-ジヒドロフラノン誘導体は、希釈剤の存在下および塩基の存在下で式 (I I I)

【0073】

【化 1 9】



【0074】

10

〔式中、

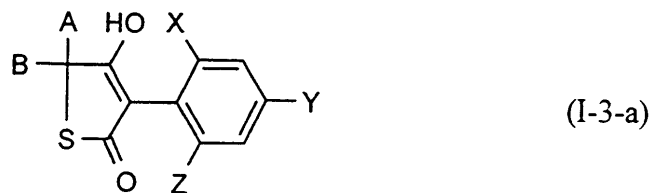
A、B、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義された通りである〕

のカルボン酸エステル類を分子間縮合させる時に得られることが見いだされた。

(C)さらに、式(I-3-a)

【0075】

【化 2 0】



20

【0076】

〔式中、

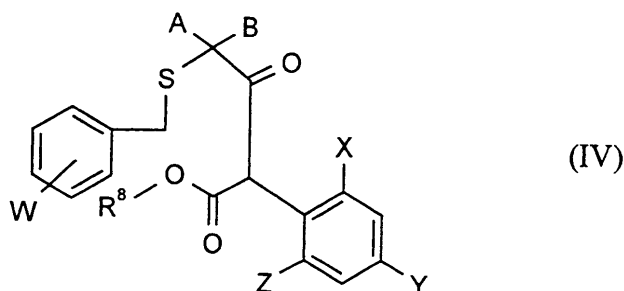
A、B、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕

の置換された3-フェニル-4-ヒドロキシ- Δ^3 -ジヒドロチオフェノン誘導体は、適宜希釈剤の存在下および酸の存在下で式(I V)

【0077】

【化 2 1】

30



【0078】

40

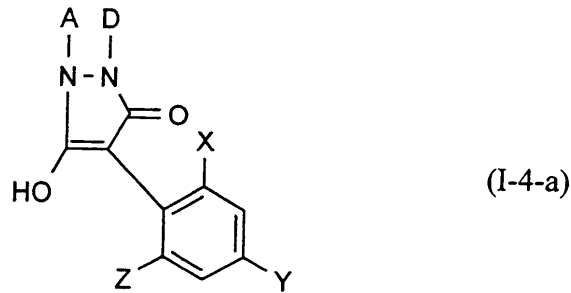
〔式中、

A、B、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義された通りであり、そしてWは水素、ハロゲン（好ましくは弗素、塩素、臭素）、アルキル（好ましくはC₁-C₆-アルキル）またはアルコキシ（好ましくはC₁-C₈-アルコキシ）を表す〕の β -ケトカルボン酸エステル類を分子間環化させる時に得られることが見いだされた。

(D)さらに、式(I-4-a)

【0079】

【化 2 2】



10

【0080】

〔式中、

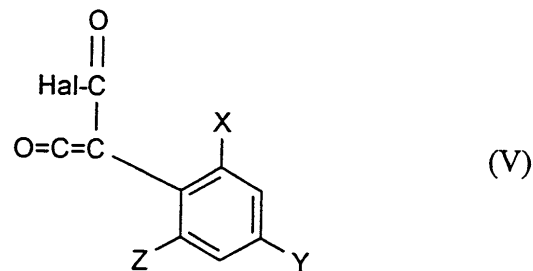
A、D、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕

の置換された3-ヒドロキシ-4-フェニル-5-オキソ-ピラズリン類は、適宜希釈剤の存在下でそして適宜塩基の存在下で、

(α) 式 (V)

【0081】

【化 2 3】



20

【0082】

〔式中、

X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、

そして

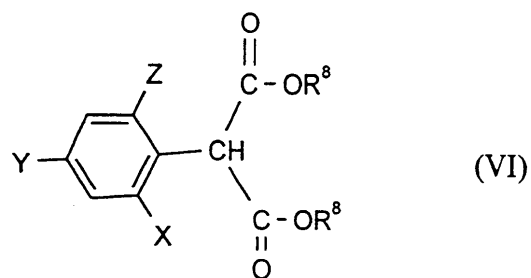
Halはハロゲン（特に塩素または臭素）を表す〕

のハロゲノカルボニルケテン類を、または

(β) 式 (VI)

【0083】

【化 2 4】



40

【0084】

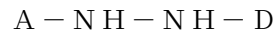
〔式中、

R⁸、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕

のマロン酸誘導体を、

式 (VII)

50



(V I I)

[式中、

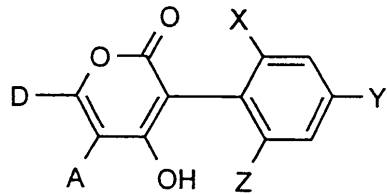
AおよびDは各々上記で定義された通りである]

のヒドラジン類と反応させる時に得られることが見いだされた。

(E)さらに、式(I-5-a)

【0085】

【化25】



(I-5-a)

10

【0086】

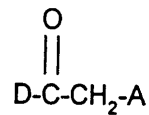
[式中、

A、D、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである]

の新規な置換された3-フェニルピロン誘導体は、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸受容体の存在下で、式(V I I I)

【0087】

【化26】



(VIII)

20

【0088】

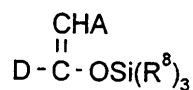
[式中、

AおよびDは各々上記で定義された通りである]

のカルボニル化合物または式(V I I I a)

【0089】

【化27】



(VIIIa)

30

【0090】

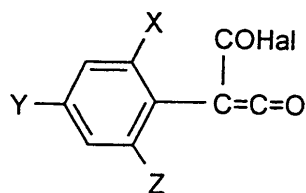
[式中、

A、DおよびR⁸は各々上記で定義された通りである]

のそれらのシリルエノールエーテル類を式(V)

【0091】

【化28】



(V)

40

【0092】

[式中、

X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、そして

50

H a l はハロゲンを表す（好ましくは塩素または臭素を表す）]
 のケテン酸ハライド類と反応させる時に得られることが見いだされた。

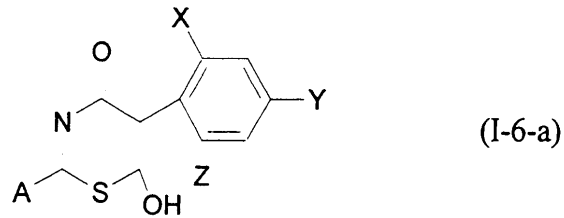
【0093】

さらに、

(F) 式 (I-6-a)

【0094】

【化29】



10

【0095】

[式中、

A、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである]

の新規な置換されたフェニル-1, 3-チアジン誘導体が、適宜希釈剤の存在下でそして
 適宜酸受容体の存在下で、式 (IX)

【0096】

【化30】

20



【0097】

[式中、

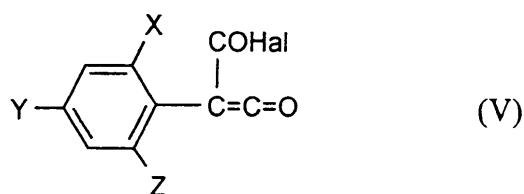
Aは上記で定義された通りである]

のチオアミド類を式 (V)

【0098】

【化31】

30



【0099】

[式中、

H a l、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである]

のケテン酸ハライド類と反応させる時に得られることが見いだされた。

【0100】

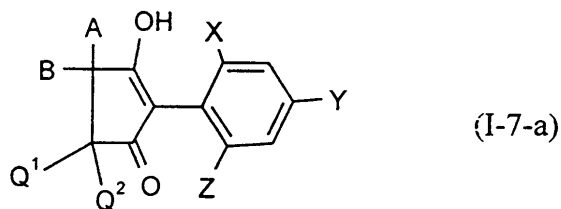
さらに、

(G) 式 (I-7-a)

【0101】

40

【化 3 2】



(I-7-a)

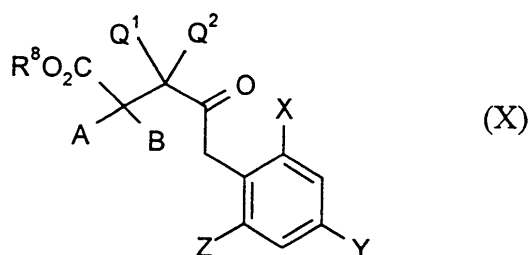
【0102】

〔式中、

A、B、Q¹、Q²、W、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕
 の化合物が、適宜希釈剤の存在下および塩基の存在下で式 (X)

【0103】

【化 3 3】



(X)

【0104】

〔式中、

A、B、Q¹、Q²、X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、そして
 R⁸ はアルキル（特にC₁－C₈－アルキル）を表す〕
 のケトカルボン酸エステル類を分子間環化させる時に得られることが見いだされた。

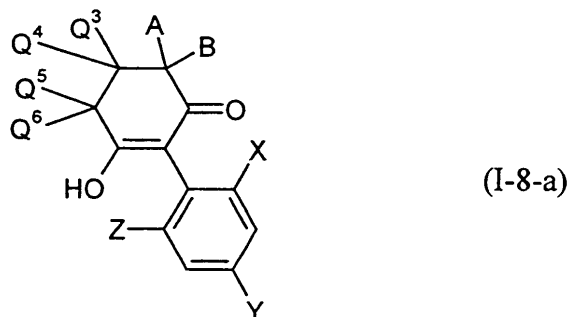
【0105】

さらに、

(H) 式 (I-8-a)

【0106】

【化 3 4】



(I-8-a)

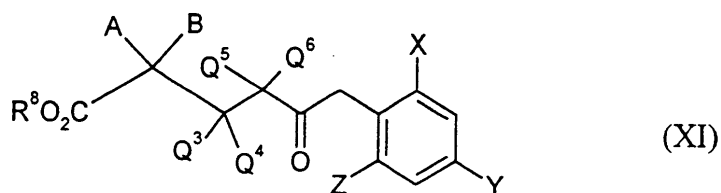
【0107】

〔式中、

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZは各々上記で定義された通りである〕
 の化合物が、希釈剤の存在下および塩基の存在下で式 (XI)

【0108】

【化 3 5】



【 0 1 0 9 】

〔式中、

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、
そして

R⁸はアルキル（特にC₁－C₆－アルキル）を表す〕

の6－アリーール－5－ケト－ヘキサン酸エステル類を分子間縮合させる時に得られること、

または

（I）A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式（I－1－a）～（I－8－a）の化合物が、溶媒、塩基および触媒、適切には特にパラジウム錯体の存在下で式（I－1'－a）～（I－8'－a）

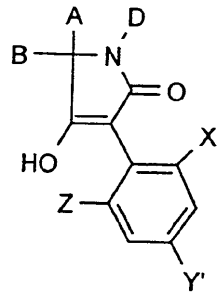
【 0 1 1 0 】

10

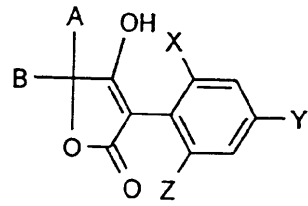
20

【化 3 6】

(I-1'-a):

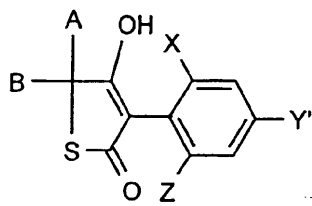


(I-2'-a):

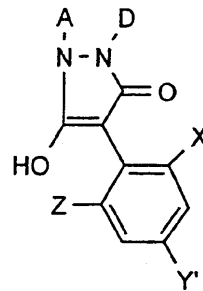


10

(I-3'-a):

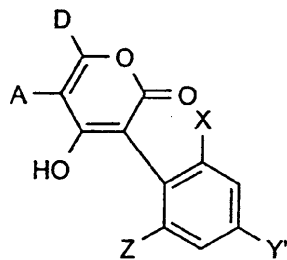


(I-4'-a):

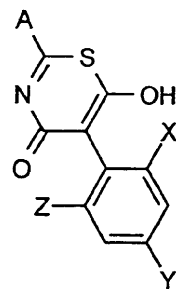


20

(I-5'-a):

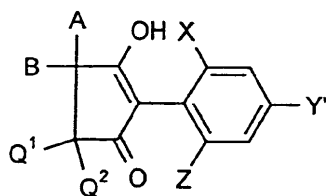


(I-6'-a):

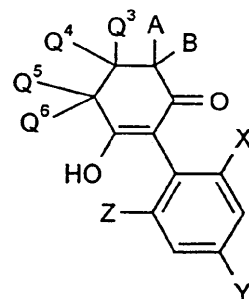


30

(I-7'-a):



(I-8'-a):



40

【0111】

〔式中、

A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZは各々上記で定義された通りであり、そして

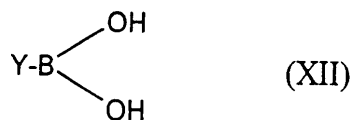
Y'は塩素、臭素またはヨウ素を表し、好ましくは臭素を表す]

50

の化合物を式 (X I I)

【0 1 1 2】

【化 3 7】



【0 1 1 3】

[式中、

Yは以上で定義された通りである]

のボロン酸 (b o r o n i c a c i d) と反応させる時に得られることが見いだされた。

【0 1 1 4】

さらに、

(J) A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^1 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式 (I-1-b) ~ (I-8-b) の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式 (I-1-a) ~ (I-8-a) の化合物を、各場合とも、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、

(α) 式 (X I I I)

【0 1 1 5】

【化 3 8】



【0 1 1 6】

[式中、

R^1 は上記で定義された通りであり、そして

H a l はハロゲン (特に塩素または臭素) を表す]

のアシルハライド類と、

または

(β) 式 (X I V)



[式中、

R^1 は上記で定義された通りである]

の無水カルボン酸類と反応させる時に得られること、

(K) A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、X、YおよびZが各々上記で定義された通りでありそしてLが酸素を表す上記で示された式 (I-1-c) ~ (I-8-c) の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式 (I-1-a) ~ (I-8-a) の化合物を各場合とも適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で式 (X V)



[式中、

R^2 およびMは各々上記で定義された通りである]

のクロロ蟻酸エステル類またはクロロ蟻酸チオエステル類と反応させる時に得られること、

(L) A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^2 、M、X、YおよびZが各々上記で定義された通りでありそしてLが酸素を表す上記で示された式 (I-1-c)

～(I-8-c)の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を各場合とも適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で式(XVI)

【0117】

【化39】



10

【0118】

[式中、

Mおよび R^2 は各々上記で定義された通りである]

のクロモノチオ蟻酸エステル類またはクロジチオ蟻酸エステル類と反応させる時に得られること、並びに

(M) A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^3 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-d)～(I-8-d)の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を各場合とも適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で式(XVII)

20



[式中、

R^3 は上記で定義された通りである]

のスルホニルクロリド類と反応させる時に得られること、

(N) A、B、D、L、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、 R^4 、 R^5 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-e)～(I-8-e)の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を各場合とも適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で式(XVIII)

【0119】

【化40】



30

【0120】

[式中、

L、 R^4 および R^5 は各々上記で定義された通りであり、そして

Halはハロゲン(特に塩素または臭素)を表す]

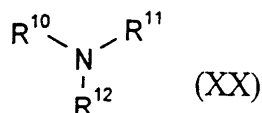
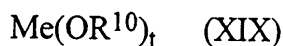
40

の燐化合物と反応させる時に得られること、

(O) A、B、D、E、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-f)～(I-8-f)の化合物が、A、B、D、 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZが各々上記で定義された通りである上記で示された式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を各場合とも適宜希釈剤の存在下で式(XX)または(XX)

【0121】

【化 4 1】



【0 1 2 2】

〔式中、

Me は 1 ーまたは 2 価の金属（好ましくはアルカリ金属またはアルカリ土類金属、例えばリチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウムもしくはカルシウム）を表し、

t は数 1 または 2 を表し、そして

R¹⁰、R¹¹、R¹² は互いに独立して各々が水素またはアルキル（好ましくは C₁ーC₈ーアルキル）を表す]

の金属化合物またはアミン類と反応させる時に得られること、

（P）A、B、D、L、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、R⁶、R⁷、X、Y および Z が各々上記で定義された通りである上記で示された式（I-1-g）～（I-8-g）の化合物が、A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y および Z が各々上記で定義された通りである上記で示された式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を、各場合とも

（α）適宜希釈剤の存在下でそして適宜触媒の存在下で式（XXI）



〔式中、

R⁶ および L は各々上記で定義された通りである]

のイソシアナート類またはイソチオシアナート類と、或いは

（β）適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で式（XXII）

【0 1 2 3】

【化 4 2】



【0 1 2 4】

〔式中、

L、R⁶ および R⁷ は各々上記で定義された通りである]

のカルバモイルクロリド類またはチオカルバモイルクロリド類と

反応させる時に得られることが見いだされた。

【0 1 2 5】

さらに、式（I）の新規な化合物が有害生物防除剤として、好ましくは殺昆虫剤、殺ダニ剤として、並びに除草剤として、非常に良好な活性を有することも見いだされた。

【0 1 2 6】

式（I）は本発明に従う化合物の一般的な定義を与える。以上および以下で挙げられる式における好ましい置換基または基の範囲を以下に示す：

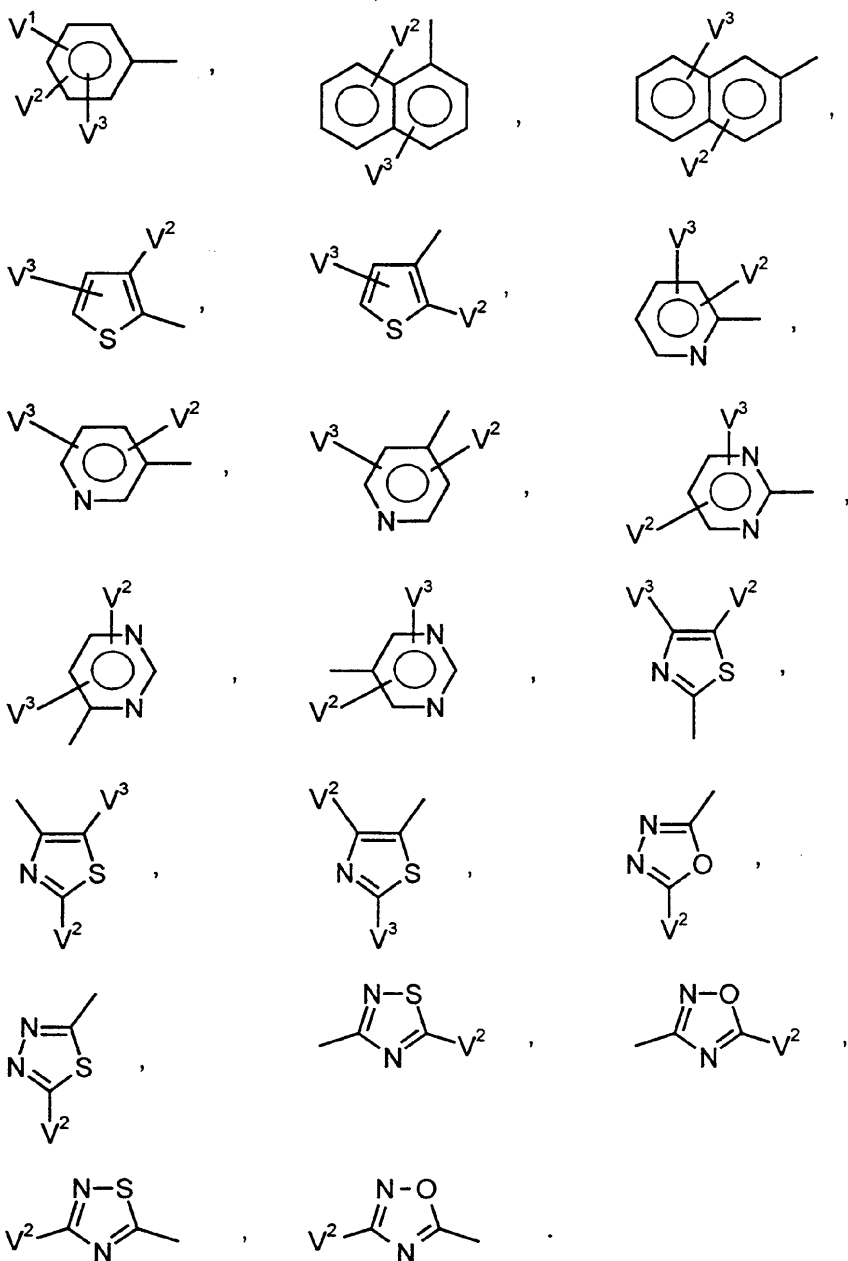
X は好ましくはハロゲン、C₁ーC₆ーアルキル、C₁ーC₆ーハロゲノアルキル、C₁ーC₆ーアルコキシ、C₃ーC₆ーアルケニルオキシ、C₁ーC₆ーアルキルチオ、C₁ーC₆ーアルキルスルフィニル、C₁ーC₆ーアルキルスルホニル、C₁ーC₆ーハロゲノアルコキシ、C₃ーC₆ーハロゲノアルケニルオキシ、ニトロ、シアノ、または各場合とも場合によりハロゲンー、C₁ーC₆ーアルキルー、C₁ーC₆ーアルコキシー、C₁ーC₄ーハロゲノアルキルー、C₁ーC₄ーハロゲノアルコキシー、ニトローもしくはシアノー置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシもしくはベンジルチオを表す。

【0127】

Yは好ましくは基

【0128】

【化43】



10

20

30

【0129】

の1つを表す。

【0130】

V¹は好ましくは水素、ハロゲン、C₁–C₁₂–アルキル、C₁–C₆–アルコキシ、C₁–C₄–ハロゲノアルキル、C₁–C₄–ハロゲノアルコキシ、ニトロ、シアノ、またはフェニル、フェノキシ、フェノキシ–C₁–C₄–アルキル、フェニル–C₁–C₄–アルコキシ、フェニルチオ–C₁–C₄–アルキルもしくはフェニル–C₁–C₄–アルキルチオを表し、それらの各々は場合によりハロゲン、C₁–C₆–アルキル、C₁–C₆–アルコキシ、C₁–C₄–ハロゲノアルキル、C₁–C₄–ハロゲノアルコキシ、ニトロもしくはシアノによりモノーもしくはポリ置換されていてもよい。

【0131】

40

50

V^2 および V^3 は互いに独立して各々が好ましくは水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキルまたは C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシを表す。

【0132】

Z は好ましくは水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロゲノアルコキシ、ニトロまたはシアノを表す。

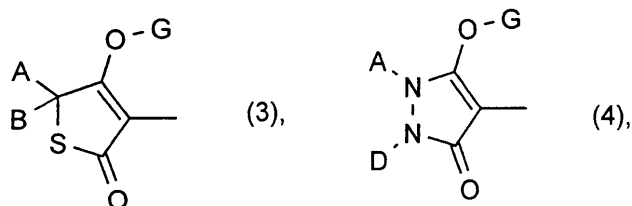
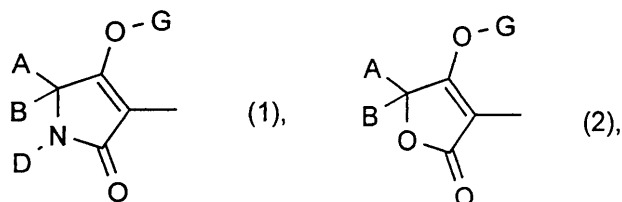
【0133】

C K E は好ましくは基

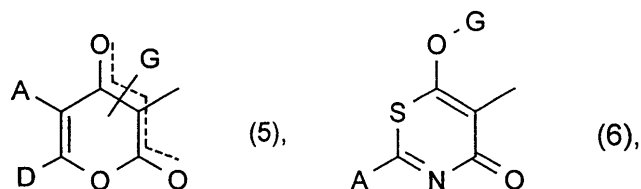
【0134】

【化44】

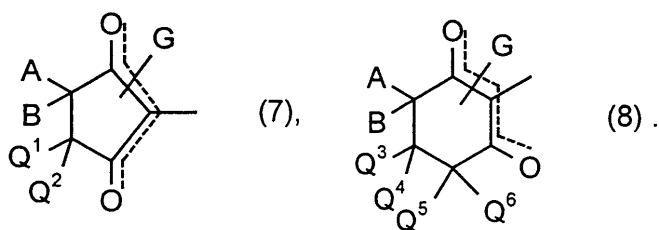
10



20



30



【0135】

の1つを表す。

【0136】

A は好ましくは水素、または各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよい C_1-C_{12} -アルキル、 C_3-C_8 -アルケニル、 C_1-C_{10} -アルコキシ— C_1-C_8 -アルキル、ポリ— C_1-C_8 -アルコキシ— C_1-C_8 -アルキル、 C_1-C_{10} -アルキルチオ— C_1-C_6 -アルキル、場合により1個もしくは2個の直接隣接していない環員が酸素および／もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりハロゲン—、 C_1-C_6 -アルキル—もしくは C_1-C_6 -アルコキシ—置換されていてもよい C_3-C_8 -シクロアルキルを表し、或いは各場合とも場合によりハロゲン—、 C_1-C_6 -アルキル—、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキル—、 C_1-C_6 -アルコキシ—、 C_1-C_6 -

40

50

ハロゲノアルコキシ-、シアノ-もしくはニトロ-置換されていてもよい C_6 -もしくは C_{10} -アリール（フェニルもしくはナフチル）、5もしくは6個の環原子を有するヘタリール（例えばフラニル、ピリジル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、チアゾリルもしくはチエニル）または C_6 -もしくは C_{10} -アリール- C_1 - C_6 -アルキル（フェニル- C_1 - C_6 -アルキルもしくはナフチル- C_1 - C_6 -アルキル）を表す。

【0137】

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

A、Bおよびそれらが結合している炭素原子は好ましくは、場合により1個の環員が酸素または硫黄により置換されていてもよくそして場合により C_1 - C_8 -アルキル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_1 - C_8 -ハロゲノアルキル、 C_1 - C_8 -アルコキシ、 C_1 - C_8 -アルキルチオ、ハロゲンもしくはフェニルによりモノ-もしくはジ置換されていてもよい飽和 C_3 - C_{10} -シクロアルキルまたは不飽和 C_5 - C_{10} -シクロアルキルを表し、或いは

A、Bおよびそれらが結合している炭素原子は好ましくは、場合により1個もしくは2個の直接隣接していない酸素および／もしくは硫黄原子を含有してもよいアルキレンジイル基により、またはアルキレンジオキシル基もしくはアルキレンジチオイル基により置換された C_3 - C_6 -シクロアルキルを表し、それはそれが結合している炭素原子と一緒にあって別の5〜8員環を形成し、或いは

A、Bおよびそれらが結合している炭素原子は好ましくは、 C_3 - C_8 -シクロアルキルまたは C_5 - C_8 -シクロアルケニルを表し、ここで2個の置換基はそれらが結合している炭素原子と一緒にあって各場合とも場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により C_1 - C_6 -アルキル-、 C_1 - C_6 -アルコキシ-もしくはハロゲン-置換されていてもよい C_2 - C_6 -アルカンジイル、 C_2 - C_6 -アルケンジイルまたは C_4 - C_6 -アルカンジェンジイルを表す。

【0138】

Dは好ましくは水素、各場合とも場合によりハロゲン-置換されていてもよい C_1 - C_{12} -アルキル、 C_3 - C_8 -アルケニル、 C_3 - C_8 -アルキニル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ- C_2 - C_8 -アルキル、ポリ- C_1 - C_8 -アルコキシ- C_2 - C_8 -アルキル、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ- C_2 - C_8 -アルキル、場合により1個の環員が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりハロゲン-、 C_1 - C_4 -アルキル-、 C_1 - C_4 -アルコキシ-もしくは C_1 - C_4 -ハロゲノアルキル-置換されていてもよい C_3 - C_8 -シクロアルキル、または各場合とも場合によりハロゲン-、 C_1 - C_6 -アルキル-、 C_1 - C_6 -ハロゲノアルキル-、 C_1 - C_6 -アルコキシ-、 C_1 - C_6 -ハロゲノアルコキシ-、シアノ-もしくはニトロ-置換されていてもよいフェニル、5もしくは6個の環原子を有するヘタリール（例えばフラニル、イミダゾリル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピロリル、チエニルもしくはトリアゾリル）、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルまたは5もしくは6個の環原子を有するヘタリール- C_1 - C_6 -アルキル（例えばフラニル-、イミダゾリル-、ピリジル-、チアゾリル-、ピラゾリル-、ピリミジル-、ピロリル-、チエニル-もしくはトリアゾリル- C_1 - C_6 -アルキル）を表し、或いは

AおよびDは一緒になって好ましくは、場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい各場合とも場合により置換されていてもよい C_3 - C_6 -アルカンジイルまたは C_3 - C_6 -アルケンジイルを表し、

各場合とも可能な置換基はハロゲン、ヒドロキシル、メルカプトまたは各場合とも場合によりハロゲン-置換されていてもよい C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_7 -シクロアルキル、フェニルもしくはベンジロキシであり、

或いは場合により C_1 - C_6 -アルキルにより置換されていてもよくまたは場合により2

10

20

30

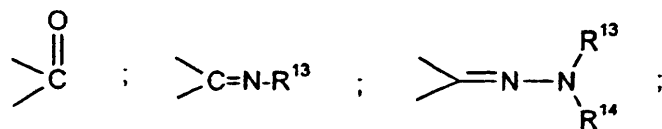
40

50

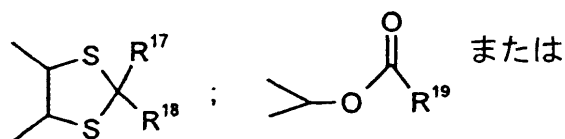
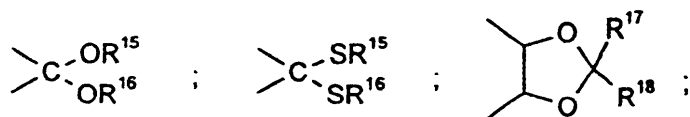
個の隣接する置換基がそれらが結合している炭素原子と一緒にあって酸素もしくは硫黄を含有してもよくまたは場合以下の基

【0139】

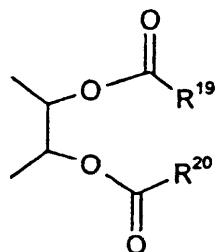
【化45】



10



20



【0140】

の1つを含有してもよい5もしくは6個の環原子を有する別の飽和もしくは不飽和環を形成する（式（I-1）の化合物の場合には、AおよびDはそれらが結合している原子と一緒にあって例えば以下でさらに挙げられている基AD-1～AD-10を表す）別のC₃－C₆－アルカンジイル基、C₃－C₆－アルケンジイル基もしくはブタジエニル基を表し、

30

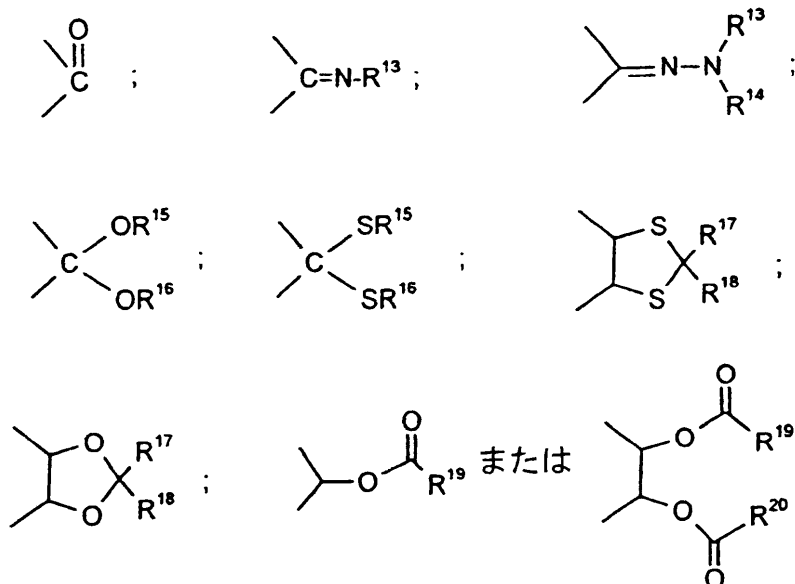
或いは

AおよびQ¹は一緒になって好ましくは、C₃－C₆－アルカンジイルまたはC₄－C₆－アルケンジイルを表し、それらの各々は場合によりハロゲン、ヒドロキシル；各々が場合により同一もしくは相異なるハロゲンによりモノないしトリ置換されていてもよいC₁－C₁₀－アルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₃－C₇－シクロアルキル；並びに各々が場合によりハロゲン、C₁－C₆－アルキルまたはC₁－C₆－アルコキシよりなる群から選択される同一もしくは相異なる置換基によりモノないしトリ置換されていてもよいベンジルオキシおよびフェニルよりなる群から選択される同一もしくは相異なる置換基によりモノもしくはジ置換されていてもよく、そしてさらに場合により以下の基

40

【0141】

【化 4 6】



10

【0142】

の1つを含有していてもよいまたはC₁ - C₂ - アルカンジイルによりもしくは酸素原子により架橋結合されていてもよく、或いは

Q¹ は好ましくは水素またはC₁ - C₄ - アルキルを表す。

【0143】

Q²、Q⁴、Q⁵ および Q⁶ は互いに独立して各々が好ましくは水素またはC₁ - C₄ - アルキルを表し、

Q³ は好ましくは水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルチオ - C₁ - C₂ - アルキル、場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりC₁ - C₄ - アルキルもしくはC₁ - C₄ - アルコキシ - 置換されていてもよいC₃ - C₈ - シクロアルキル、または場合によりハロゲン - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、シアノ - もしくはニトロ - 置換されていてもよいフェニルを表し、或いは

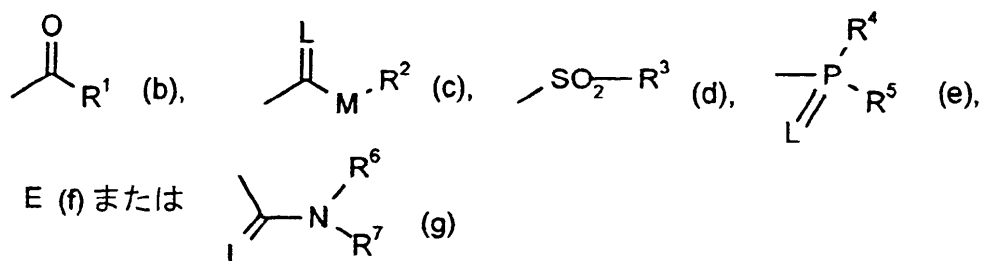
Q³ および Q⁴ はそれらが結合している炭素原子と一緒に、場合により1個の環員が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりC₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシもしくはC₁ - C₂ - ハロゲノアルキル - 置換されていてもよいC₃ - C₇ - シクロアルキルを表す。

【0144】

G は好ましくは水素 (a) を表すかまたは基

【0145】

【化 4 7】



40

50

【0146】

の1つを表し、特に(a)、(b)または(c)を表し、
ここで

Eは金属イオンまたはアンモニウムイオンを表し、

Lは酸素または硫黄を表し、そして

Mは酸素または硫黄を表す。

【0147】

R^1 は好ましくは各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよい C_1-C_{20} —アルキル、 C_2-C_{20} —アルケニル、 C_1-C_8 —アルコキシ— C_1-C_8 —アルキル、 C_1-C_8 —アルキルチオ— C_1-C_8 —アルキル、ポリ— C_1-C_8 —アルコキシ— C_1-C_8 —アルキル、または場合により1個もしくはそれ以上の(好ましくは1個もしくは2個の)直接隣接していない環員が酸素および/もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりハロゲン—、 C_1-C_6 —アルキル—もしくは C_1-C_6 —アルコキシ—置換されていてもよい C_3-C_8 —シクロアルキルを表し、

場合によりハロゲン—、シアノー、ニトロ—、 C_1-C_6 —アルキル—、 C_1-C_6 —アルコキシ—、 C_1-C_6 —ハロゲノアルキル—、 C_1-C_6 —ハロゲノアルコキシ—、 C_1-C_6 —アルキルチオ—もしくは C_1-C_6 —アルキルスルホニル—置換されていてもよいフェニルを表し、

場合によりハロゲン—、シアノー、ニトロ—、 C_1-C_6 —アルキル—、 C_1-C_6 —アルコキシ—、 C_1-C_6 —ハロゲノアルキル—もしくは C_1-C_6 —ハロゲノアルコキシ—置換されていてもよいフェニル— C_1-C_6 —アルキルを表し、

場合によりハロゲン—もしくは C_1-C_6 —アルキル—置換されていてもよい5—もしくは6—員のヘタリール(例えばピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニルまたはチエニル)を表し、

場合によりハロゲン—もしくは C_1-C_6 —アルキル—置換されていてもよいフェノキシ— C_1-C_6 —アルキルを表し、或いは

場合によりハロゲン—、アミノ—もしくは C_1-C_6 —アルキル—置換されていてもよい5—もしくは6—員のヘタリールオキシ— C_1-C_6 —アルキル(例えばピリジルオキシ— C_1-C_6 —アルキル、ピリミジルオキシ— C_1-C_6 —アルキルまたはチアゾリルオキシ— C_1-C_6 —アルキル)を表す。

【0148】

R^2 は好ましくは各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよい C_1-C_{20} —アルキル、 C_2-C_{20} —アルケニル、 C_1-C_8 —アルコキシ— C_2-C_8 —アルキル、ポリ— C_1-C_8 —アルコキシ— C_2-C_8 —アルキルを表し、

場合によりハロゲン—、 C_1-C_6 —アルキル—もしくは C_1-C_6 —アルコキシ—置換されていてもよい C_3-C_8 —シクロアルキルを表し、或いは

各場合とも場合によりハロゲン—、シアノー、ニトロ—、 C_1-C_6 —アルキル—、 C_1-C_6 —アルコキシ—、 C_1-C_6 —ハロゲノアルキル—もしくは C_1-C_6 —ハロゲノアルコキシ—置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。

【0149】

R^3 は好ましくは場合によりハロゲン—置換されていてもよい C_1-C_8 —アルキルを表し、或いは各場合とも場合によりハロゲン—、 C_1-C_6 —アルキル—、 C_1-C_6 —アルコキシ—、 C_1-C_4 —ハロゲノアルキル—、 C_1-C_4 —ハロゲノアルコキシ—、シアノーもしくはニトロ—置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。

【0150】

R^4 および R^5 は互いに独立して各々が好ましくは各場合とも場合によりハロゲン—置換されていてもよい C_1-C_8 —アルキル、 C_1-C_8 —アルコキシ、 C_1-C_8 —アルキルアミノ、ジ—(C_1-C_8 —アルキル)アミノ、 C_1-C_8 —アルキルチオ、 C_2-C_8 —アルケニルチオ、 C_3-C_7 —シクロアルキルチオを表し、或いは各場合とも場合によりハロゲン—、ニトロ—、シアノー、 C_1-C_4 —アルコキシ—、 C_1-C_4 —ハロ

10

20

30

40

50

ゲノアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキル-もしくは C_1-C_4 -ハロゲノアルキル-置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

【0151】

R^6 および R^7 は互いに独立して各々が好ましくは水素を表し、各場合とも場合によりハロゲン-置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_8 -アルコキシ、 C_3-C_8 -アルケニル、 C_1-C_8 -アルコキシ- C_1-C_8 -アルキルを表し、場合によりハロゲン-、 C_1-C_8 -ハロゲノアルキル-、 C_1-C_8 -アルキル-もしくは C_1-C_8 -アルコキシ-置換されていてもよいフェニル、場合によりハロゲン-、 C_1-C_8 -アルキル-、 C_1-C_8 -ハロゲノアルキル-もしくは C_1-C_8 -アルコキシ-置換されていてもよいベンジルを表し、或いは一緒になって場合により1個の炭素原子が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により C_1-C_4 -アルキル-置換されていてもよい C_3-C_6 -アルキレン基を表す。

10

【0152】

R^{13} は好ましくは水素を表し、各場合とも場合によりハロゲン-置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキルもしくは C_1-C_8 -アルコキシを表し、場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-もしくは C_1-C_4 -アルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_8 -シクロアルキルを表し、或いは各場合とも場合によりハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキル-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ-、ニトロ-もしくはシアノ-置換されていてもよいフェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキルまたはフェニル- C_1-C_4 -アルコキシを表す。

20

【0153】

R^{14} は好ましくは水素または C_1-C_8 -アルキルを表し、或いは R^{13} および R^{14} が一緒になって C_4-C_6 -アルカンジイルを表す。

【0154】

R^{15} および R^{16} は同一もしくは相異なりそして各々が好ましくは C_1-C_6 -アルキルを表し、或いは

R^{15} および R^{16} は一緒になって好ましくは、場合により C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロゲノアルキルによりまたは場合によりハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ-、ニトロ-もしくはシアノ-置換されていてもよいフェニルにより置換されていてもよい C_2-C_4 -アルカンジイル基を表す。

30

【0155】

R^{17} および R^{18} は互いに独立して各々が好ましくは水素を表し、場合によりハロゲン-置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキルを表し、或いは場合によりハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキル-、 C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ-、ニトロ-もしくはシアノ-置換されていてもよいフェニルを表し、或いは

R^{17} および R^{18} はそれらが結合している炭素原子と一緒に好ましくはカルボニル基を表し、或いは場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-もしくは C_1-C_4 -アルコキシ-置換されていてもよい C_5-C_7 -シクロアルキルを表す。

40

【0156】

R^{19} および R^{20} は互いに独立して各々が好ましくは C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルアミノ、 C_3-C_{10} -アルケニルアミノ、ジ- (C_1-C_{10} -アルキル) アミノまたはジ- (C_3-C_{10} -アルケニル) アミノを表す。

【0157】

好ましい基の定義において、例えばハロゲノアルキル中のように置換基としてのものも

50

包含するハロゲンは弗素、塩素、臭素およびヨウ素を表しそして特に弗素および塩素を表す。

【0158】

Xは特に好ましくは弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_4 -アルケニルオキシ、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシ、 C_3-C_4 -ハロゲノアルケニルオキシ、ニトロまたはシアノを表す。

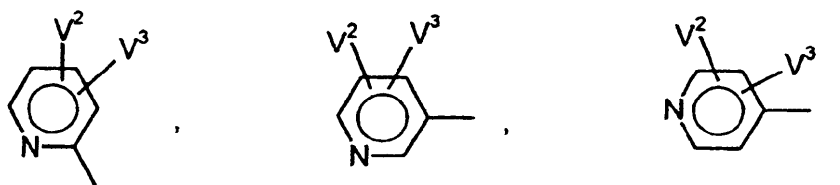
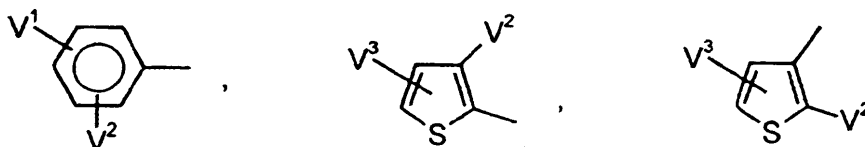
【0159】

Yは特に好ましくは基

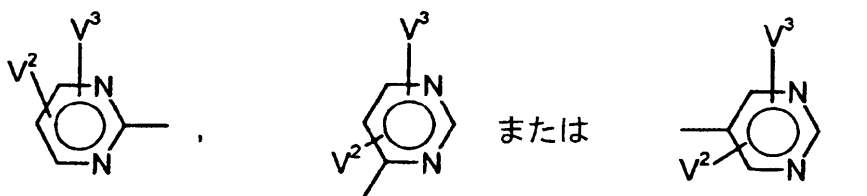
【0160】

【化48】

10



20



30

【0161】

の1つを表す。

【0162】

V^1 は特に好ましくは水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_2 -ハロゲノアルコキシ、ニトロ、シアノまたはフェニル、フェノキシ、フェノキシ- C_1-C_2 -アルキル、フェニル- C_1-C_2 -アルコキシ、フェニルチオ- C_1-C_2 -アルキルもしくはフェニル- C_1-C_2 -アルキルチオを表し、それらの各々は場合により弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_2 -ハロゲノアルコキシ、ニトロもしくはシアノによりモノーもしくはジ置換されていてもよい。

40

【0163】

V^2 および V^3 は互いに独立して各々が特に好ましくは水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロゲノアルキルまたは C_1-C_2 -ハロゲノアルコキシを表す。

【0164】

Zは特に好ましくは水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロゲノアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロゲノアルコキシを表す。

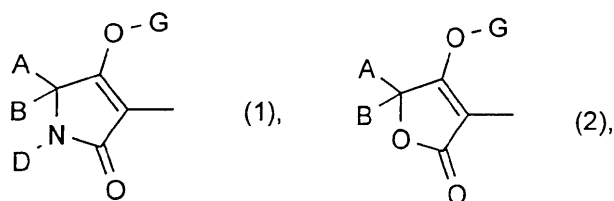
50

【0165】

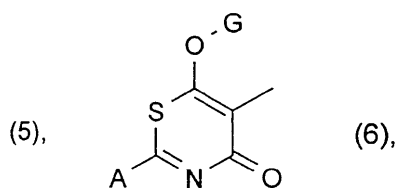
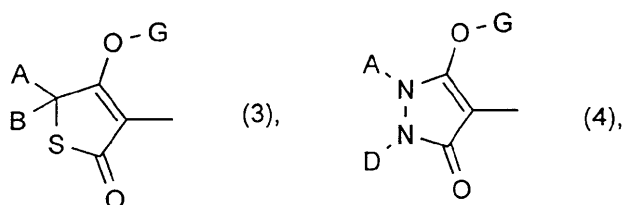
C K Eは特に好ましくは基

【0166】

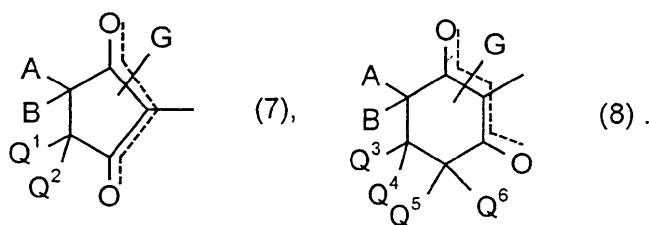
【化49】



10



20



30

【0167】

の1つを表す。

【0168】

Aは特に好ましくは水素、各場合とも場合により弗素もしくは塩素一置換されていてもよいC₁ - C₁₀ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、場合により1個の環員が酸素により置換されていてもよい場合により弗素一、塩素一、C₁ - C₄ - アルキル - もしくはC₁ - C₄ - アルコキシ - 置換されていてもよいC₃ - C₇ - シクロアルキルを表し、或いは(式(I-5)、(I-7)および(I-8)の化合物の場合でないが)各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、C₁ - C₄ - アルキル - 、C₁ - C₄ - ハロゲノアルキル - 、C₁ - C₄ - アルコキシ - もしくはC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ - 置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、イミダゾリル、トリアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、チアゾリル、チエニルまたはフェニル - C₁ - C₄ - アルキルを表す。

40

【0169】

Bは特に好ましくは水素またはC₁ - C₆ - アルキルを表し、或いはA、Bおよびそれらが結合している炭素原子は特に好ましくは、場合により1個の環員が酸素または硫黄により置換されていてもよくそして場合によりC₁ - C₆ - アルキル、C₅ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₃ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、

50

弗素、塩素もしくはフェニルによりモノー置換されていてもよい飽和もしくは不飽和 C_5 - C_7 - シクロアルキルを表し、或いは

A、Bおよびそれらが結合している炭素原子は特に好ましくは、場合により1個もしくは2個の直接隣接していない酸素もしくは硫黄原子を含有してもよいアルキレンジイル基により、またはアルキレンジオキシ基もしくはアルキレンジチオイル基により置換された C_5 - C_6 - シクロアルキルを表し、それはそれが結合している炭素原子と一緒にあって別の5-もしくは6-員環を形成し、或いは

A、Bおよびそれらが結合している炭素原子は特に好ましくは、 C_3 - C_6 - シクロアルキルまたは C_5 - C_6 - シクロアルケニルを表し、ここで2個の置換基がそれらが結合している炭素原子と一緒にあって場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい各場合とも場合により C_1 - C_5 - アルキル、 C_1 - C_5 - アルコキシ、弗素、塩素もしくは臭素一置換されていてもよい C_2 - C_4 - アルカンジイル、 C_2 - C_4 - アルケンジイル、またはブタジエンジイルを表す。

【0170】

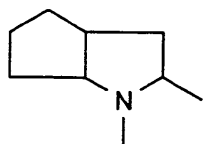
Dは特に好ましくは水素を表し、各場合とも場合により弗素もしくは塩素一置換されていてもよい C_1 - C_{10} - アルキル、 C_3 - C_6 - アルケニル、 C_1 - C_8 - アルコキシ - C_2 - C_6 - アルキルまたは C_1 - C_8 - アルキルチオ - C_2 - C_6 - アルキルを表し、場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により弗素、塩素、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシもしくは C_1 - C_2 - ハロゲノアルキル一置換されていてもよい C_3 - C_7 - シクロアルキルを表し、或いは(式(I-1)および(I-4)の化合物の場合でないが)各場合とも場合により弗素、塩素、臭素、 C_1 - C_4 - アルキル、 C_1 - C_4 - ハロゲノアルキル、 C_1 - C_4 - アルコキシもしくは C_1 - C_4 - ハロゲノアルコキシ一置換されていてもよいフェニル、フラニル、イミダゾリル、ピリジル、チアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、ピロリル、チエニル、トリアゾリルまたはフェニル - C_1 - C_4 - アルキルを表し、或いは

AおよびDは一緒にあって特に好ましくは、1個のメチレン基がカルボニル基、酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により置換されていてもよい C_3 - C_5 - アルカンジイルを表し、可能な置換基はヒドロキシル、 C_1 - C_6 - アルキルまたは C_1 - C_4 - アルコキシであり、或いは

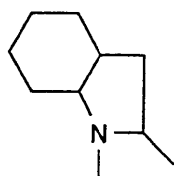
AおよびDは(式(I-1)の化合物の場合には)それらが結合している原子と一緒にあって、基AD-1 ~ AD-10:

【0171】

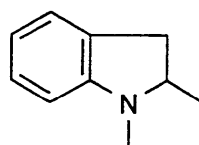
【化 5 0】



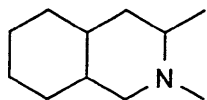
AD-1



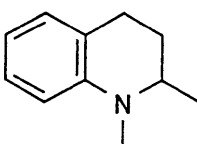
AD-2



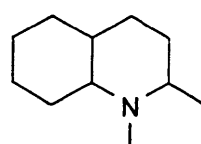
AD-3



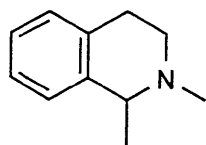
AD-4



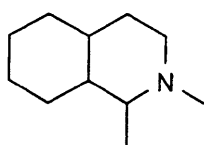
AD-5



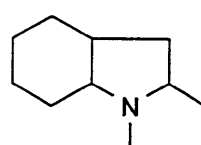
AD-6



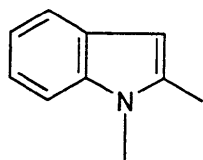
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

【0172】

の1つを表し、

或いは

Aおよび Q^1 は一緒になって特に好ましくは、 C_3-C_4 -アルカンジイルまたは C_3-C_4 -アルケンジイルを表し、それらの各々は場合により弗素、塩素、ヒドロキシル、並びに各々が場合により弗素によりモノーないしトリー置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルコキシよりなる群から選択される同一もしくは相異なる置換基によりモノーもしくはジ置換されていてもよく、或いは

Q^1 は特に好ましくは水素を表す。

【0173】

Q^2 は特に好ましくは水素を表す。

【0174】

Q^4 、 Q^5 および Q^6 は互いに独立して各々が特に好ましくは水素または C_1-C_3 -アルキルを表す。

【0175】

Q^3 は特に好ましくは水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_2 -アルキル、または場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりメチルもしくはメトキシ置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルを表し、或いは

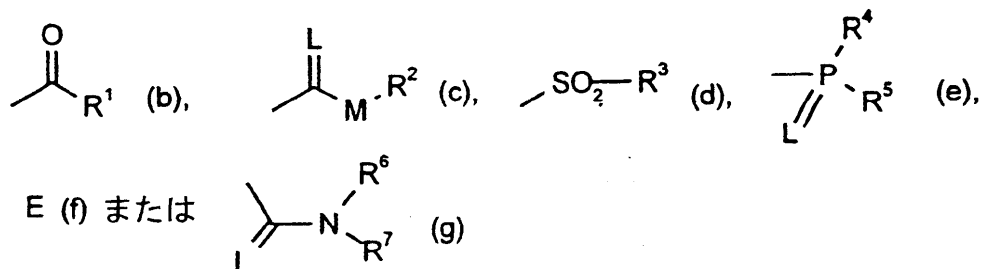
Q³ および Q⁴ はそれらが結合している炭素原子と一緒にあって特に好ましくは、場合により 1 個の環員が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により C₁ - C₄ - アルキルもしくは C₁ - C₄ - アルコキシ置換されていてもよい飽和 C₅ - C₆ - シクロアルキルを表す。

【0176】

G は特に好ましくは水素 (a) を表すかまたは特に好ましくは基

【0177】

【化51】



10

【0178】

の 1 つを表し、特に (a)、(b) または (c) を表し、
ここで

20

E は金属イオンまたはアンモニウムイオンを表し、

L は酸素または硫黄を表し、そして

M は酸素または硫黄を表す。

【0179】

R¹ は特に好ましくは各場合とも場合により弗素もしくは塩素置換されていてもよい C₁ - C₁₆ - アルキル、C₂ - C₁₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルチオ - C₁ - C₆ - アルキル、ポリ - C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、または場合により 1 個もしくは 2 個の直接隣接していない環員が酸素および／もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により弗素、塩素、C₁ - C₅ - アルキルもしくは C₁ - C₅ - アルコキシ置換されていてもよい C₃ - C₇ - シクロアルキルを表し、

30

場合により弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₃ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオもしくは C₁ - C₄ - アルキルスルホニル置換されていてもよいフェニルを表し、

場合により弗素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロゲノアルキルもしくは C₁ - C₃ - ハロゲノアルコキシ置換されていてもよいフェニル - C₁ - C₄ - アルキルを表し、

各場合とも場合により弗素、塩素、臭素もしくは C₁ - C₄ - アルキル置換されていてもよいピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニルまたはチエニルを表し、

40

場合により弗素、塩素、臭素もしくは C₁ - C₄ - アルキル置換されていてもよいフェノキシ - C₁ - C₃ - アルキルを表し、或いは

各場合とも場合により弗素、塩素、臭素、アミノもしくは C₁ - C₄ - アルキル置換されていてもよいピリジルオキシ - C₁ - C₃ - アルキル、ピリミジルオキシ - C₁ - C₃ - アルキルまたはチアゾリルオキシ - C₁ - C₃ - アルキルを表す。

【0180】

R² は特に好ましくは各場合とも場合により弗素置換されていてもよい C₁ - C₁₆ - アルキル、C₂ - C₁₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₂ - C₆ - アルキルまたはポリ - C₁ - C₆ - アルコキシ - C₂ - C₆ - アルキルを表し、

50

場合により弗素一、塩素一、 C_1-C_4 -アルキルもしくは C_1-C_4 -アルコキシ置換されていてもよい C_3-C_7 -シクロアルキルを表し、或いは

各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、シアノー、ニトロ一、 C_1-C_4 -アルキル一、 C_1-C_3 -アルコキシ一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルキル一もしくは C_1-C_3 -ハロゲノアルコキシ一置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、

R^3 は特に好ましくは場合により弗素一置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルを表し、或いは各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、 C_1-C_4 -アルキル一、 C_1-C_4 -アルコキシ一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルキル一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルコキシ一、シアノーもしくはニトロ一置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、

10

R^4 および R^5 は互いに独立して各々が特に好ましくは C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_4 -アルケニルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオを表し、或いは各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、ニトロ一、シアノー、 C_1-C_3 -アルコキシ一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルコキシ一、 C_1-C_3 -アルキルチオ一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルキルチオ一、 C_1-C_3 -アルキル一もしくは C_1-C_3 -ハロゲノアルキル一置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、そして

R^6 および R^7 は互いに独立して各々が特に好ましくは水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルを表し、場合により弗素一、塩素一、臭素一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルキル一、 C_1-C_4 -アルキル一もしくは C_1-C_4 -アルコキシ一置換されていてもよいフェニルを表し、場合により弗素一、塩素一、臭素一、 C_1-C_4 -アルキル一、 C_1-C_3 -ハロゲノアルキル一もしくは C_1-C_4 -アルコキシ一置換されていてもよいベンジルを表し、或いは一緒になって場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりメチルもしくはエチル一置換されていてもよい C_4-C_5 -アルキレン基を表す。

20

【0181】

特に好ましい基の定義において、例えばハロゲノアルキル中のように置換基としてのものも包含するハロゲンは弗素、塩素、臭素およびヨウ素を表し、特に弗素、塩素および臭素を表しそして非常に特に弗素または塩素を表す。

30

【0182】

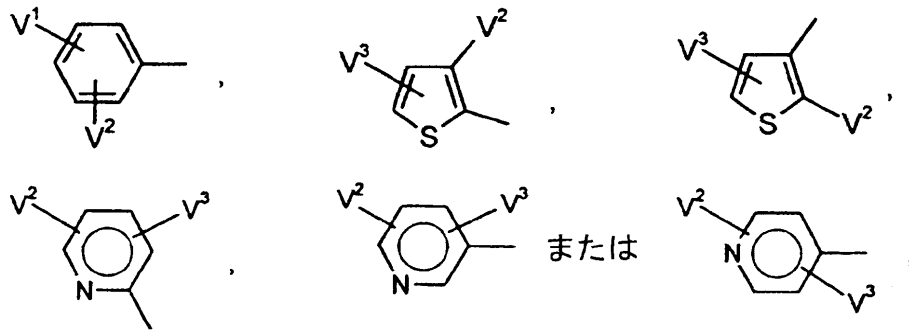
Xは非常に特に好ましくは弗素、塩素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ニトロまたはシアノ（特に弗素、塩素、メチル、エチル、*n*-プロピルまたはイソプロピル）を表す。

【0183】

Yは非常に特に好ましくは基

【0184】

【化 5 2】



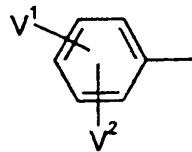
10

【0185】

の1つを表し、
特に

【0186】

【化 5 3】



20

【0187】

を表す。

【0188】

V^1 は非常に特に好ましくは水素、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたはフェニルを表す。

30

【0189】

V^2 および V^3 は互いに独立して各々が非常に特に好ましくは水素、弗素、塩素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシを表す。

【0190】

Z は非常に特に好ましくは水素、弗素、塩素、メチル、エチル、*n*-プロピル、メトキシ、エトキシまたは *n*-プロポキシ（特に水素、弗素、塩素、メチル、エチルまたは *n*-プロピル）を表す。

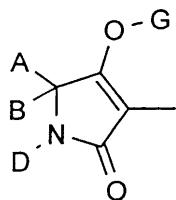
【0191】

CKE は非常に特に好ましくは基

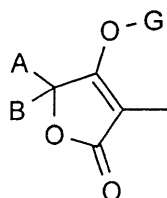
40

【0192】

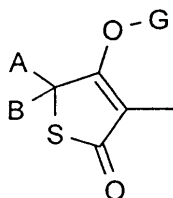
【化 5 4】



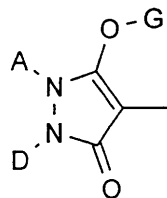
(1),



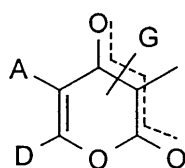
(2),



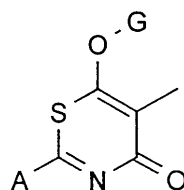
(3),



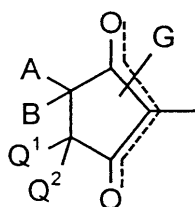
(4),



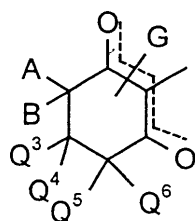
(5),



(6),



(7),



(8).

【0193】

の1つを表す。

【0194】

Aは非常に特に好ましくは水素、各場合とも場合により弗素一置換されていてもよいC₁－C₈－アルキルもしくはC₁－C₆－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、場合により1個の環員が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により弗素一、メチルー、エチルーもしくはメトキシ一置換されていてもよいC₃－C₆－シクロアルキルを表し、或いは(式(I-5)、(I-7)および(I-8)の化合物の場合でないが)各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、メチルー、エチルー、n-プロピルー、イソ-プロピルー、メトキシ一、エトキシ一、トリフルオロメチルー、トリフルオロメトキシ一、シアノーもしくはニトロ一置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。

【0195】

Bは非常に特に好ましくはC₁－C₄－アルキルを表し、或いはA、Bおよびそれらが結合している炭素原子は非常に特に好ましくは、場合により1個の環員が酸素または硫黄により置換されていてもよくそして場合によりメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、弗素もしくは塩素によりモノ置換されていてもよい飽和C₅－C₆－シクロアルキルを表し、或いはA、Bおよびそれらが結合している炭素原子は非常に特に好ましくは、2個の置換基がそれらが結合している炭素原子と一緒にあって各場合とも場合により1個のメチレン基が酸

素もしくは硫黄により置換されていてもよい C_2-C_4 -アルカンジイルもしくは C_2-C_4 -アルケンジイルまたはブタジエンジイルを表す C_5-C_6 -シクロアルキルを表す。

【0196】

Dは非常に特に好ましくは水素を表し、各場合とも場合により弗素—もしくは塩素—置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_2-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_2-C_4 -アルキル、または場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルを表し、或いは(式(I-1)および(I-4)の化合物の場合でないが)各場合とも場合により弗素—、塩素—、メチルー、エチルー、*n*-プロピルー、イソプロピルー、メトキシ—、エトキシ—、トリフルオロメチルーもしくはトリフルオロメトキシ—置換されていてもよいフェニル、フラニル、ピリジル、チエニルまたはベンジル(式(I-1)の化合物では特に水素)を表し、

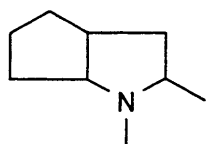
或いは

AおよびDは一緒になって非常に特に好ましくは、場合により1個の炭素原子が硫黄により置換されていてもよくそして場合によりヒドロキシル、メチル、エチル、メトキシもしくはエトキシにより置換されていてもよい場合により置換されていてもよい C_3-C_4 -アルカンジイルを表し、或いは

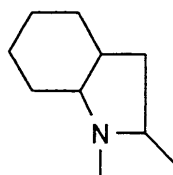
AおよびDは(式(I-1)の化合物の場合には)それらが結合している原子と一緒にあって、下記の基AD:

【0197】

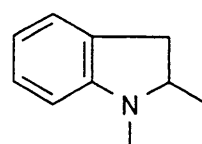
【化55】



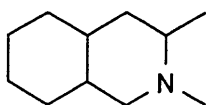
AD-1



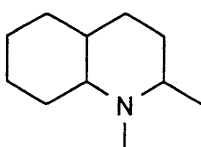
AD-2



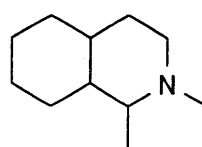
AD-3



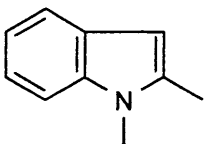
AD-4



AD-6



AD-8



AD-10

【0198】

の1つを表し、

Aおよび Q^1 は一緒になって非常に特に好ましくは、 C_3-C_4 -アルカンジイルまたはブテンジイルを表し、それらの各々は場合により弗素、ヒドロキシル、メチルもしくはメトキシによりモノ—もしくはジ置換されていてもよく、或いは

Q¹ は非常に特に好ましくは水素を表す。

【0199】

Q² は非常に特に好ましくは水素を表す。

【0200】

Q⁴、Q⁵ および Q⁶ は互いに独立して各々が非常に特に好ましくは水素、メチルまたはエチルを表す。

【0201】

Q³ は非常に特に好ましくは水素、メチル、エチル、または場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよいC₃ - C₆ - シクロアルキル（特に水素、メチルまたはエチル）を表し、或いは

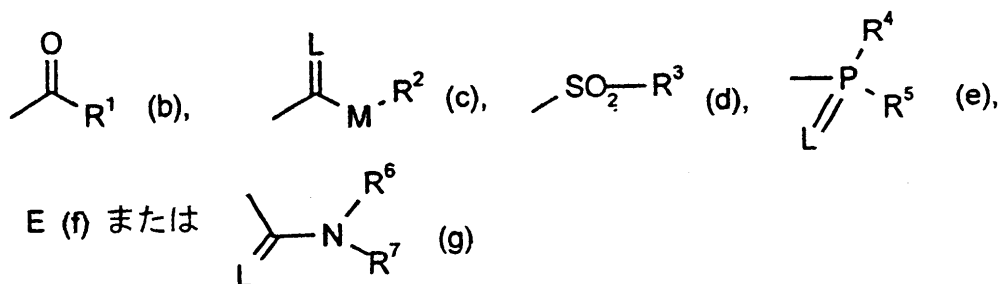
Q³ および Q⁴ はそれらが結合している炭素原子と一緒に非常に特に好ましくは、場合により1個の環員が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよい場合によりメチルもしくはメトキシ置換されていてもよい飽和C₅ - C₆ - シクロアルキルを表す。

【0202】

G は非常に特に好ましくは水素 (a) を表すかまたは基

【0203】

【化56】



【0204】

の1つを表し、特に (a)、(b) または (c) を表し、ここで

E は金属イオンまたはアンモニウムイオンを表し、

L は酸素または硫黄を表し、そして

M は酸素または硫黄を表す。

【0205】

R¹ は非常に特に好ましくは各場合とも場合により弗素もしくは塩素置換されていてもよいC₁ - C₁₄ - アルキル、C₂ - C₁₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₆ - アルキル、ポリ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、または場合により1個もしくは2個の直接隣接していない環員が酸素および／もしくは硫黄により置換されていてもよい場合により弗素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシもしくはイソプロポキシ置換されていてもよいC₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、場合により弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル置換されていてもよいフェニルを表し、場合により弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルもしくはトリフルオロメトキシ置換されていてもよいベンジルを表し、

各場合とも場合により弗素、塩素、臭素、メチルもしくはエチル置換されてい

てもよいフラニル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリルまたはピラゾリルを表し、

場合により弗素一、塩素一、メチルーもしくはエチルー置換されていてもよいフェノキシ-C₁-C₂-アルキルを表し、或いは

各場合とも場合により弗素一、塩素一、アミノ一、メチルーもしくはエチルー置換されていてもよいピリジリオキシ-C₁-C₂-アルキル、ピリミジリオキシ-C₁-C₂-アルキルまたはチアゾリリオキシ-C₁-C₂-アルキルを表す。

【0206】

R²は非常に特に好ましくは各場合とも場合により弗素一置換されていてもよいC₁-C₁₄-アルキル、C₂-C₁₄-アルケニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₆-アルキルまたはポリ-C₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₆-アルキルを表し、

場合により弗素一、塩素一、メチルー、エチルー、n-プロピル、イソプロピルもしくはメトキシ置換されていてもよいC₃-C₆-シクロアルキルを表し、或いは各場合とも場合により弗素一、塩素一、シアノー、ニトロ、メチルー、エチルー、n-プロピル、i-プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルーもしくはトリフルオロメトキシ置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表す。

【0207】

R³は非常に特に好ましくは各場合とも場合により弗素一置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、或いは各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、メチルー、tert-ブチル、メトキシ、トリフルオロメチルー、トリフルオロメトキシ、シアノーもしくはニトロ置換されていてもよいフェニルまたはベンジルを表し、

R⁴およびR⁵は互いに独立して各々が非常に特に好ましくはC₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、C₁-C₄-アルキルチオを表し、或いは各場合とも場合により弗素一、塩素一、臭素一、ニトロ、シアノー、C₁-C₂-アルコキシ、C₁-C₂-フルオロアルコキシ、C₁-C₂-アルキルチオ、C₁-C₂-フルオロアルキルチオもしくはC₁-C₃-アルキル置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

【0208】

R⁶およびR⁷は互いに独立して各々が非常に特に好ましくは水素を表し、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₃-C₄-アルケニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルを表し、場合により弗素一、塩素一、臭素一、トリフルオロメチルー、メチルーもしくはメトキシ置換されていてもよいフェニルを表し、場合により弗素一、塩素一、臭素一、メチルー、トリフルオロメチルーもしくはメトキシ置換されていてもよいベンジルを表し、或いは一緒になって場合により1個のメチレン基が酸素もしくは硫黄により置換されていてもよいC₅-C₆-アルキレン基を表す。

【0209】

上記の一般的なもしくは好ましい基の定義または説明は所望するなら互いに組み合わせることができ、すなわち各々の範囲および好ましい範囲の間の組み合わせを包含する。それら最終生成物並びに対応して前駆体および中間体の両方に適用される。

【0210】

以上で好ましい(好適な)として挙げられた意味の組み合わせを含有する式(I)の化合物が本発明によると好ましい。

【0211】

以上で特に好ましいとして挙げられた意味の組み合わせを含有する式(I)の化合物が本発明によると特に好ましい。

【0212】

以上で非常に特に好ましいとして挙げられた意味の組み合わせを含有する式(I)の化

10

20

30

40

50

合物が本発明によると非常に特に好ましい。

【0213】

Gが水素を表す式(I)の化合物が特に好ましい。

【0214】

飽和もしくは不飽和炭化水素基、例えばアルキルまたはアルケニル、は各場合とも可能である限り直鎖状もしくは分枝鎖状であることができ、例えばアルコキシ中のようにヘテロ原子との組み合わせも包含する。

【0215】

断らない限り、場合により置換されていてもよい基はモノーまたはポリ置換されていてよく、そしてポリ置換の場合には置換基は同一もしくは相異なることができる。

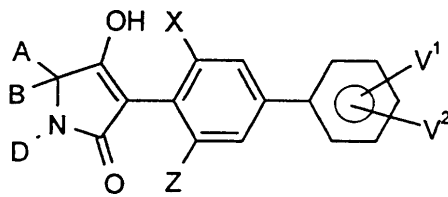
10

【0216】

製造実施例で挙げられた化合物の他に、下記の式(I-1-a)の化合物が具体的に挙げられる：

【0217】

【化57】



20

【0218】

【表 1】

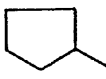
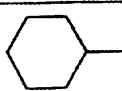
表1: $X = \text{CH}_3$, $Z = \text{CH}_3$, $V^1 = \text{H}$, $V^2 = \text{H}$.

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

【 0 2 1 9 】

【表 2】

表1(続き)

A	B	D
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H

【 0 2 2 0 】

【表 3】

表1(続き)

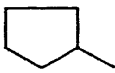
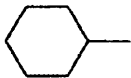
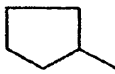
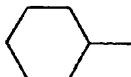
A	B	D
$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}- \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array}$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_4 \end{array}$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array}$		H
		H
		H

表1(続き)

A	D	B
$-(\text{CH}_2)_3-$		H
$-(\text{CH}_2)_4-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H

【表 4】

表1(続き)

A	D	B
$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \qquad \qquad \\ \text{(CH}_2\text{)}_3 \end{array}$		H
H	CH ₃	H
H	C ₂ H ₅	H
H	C ₃ H ₇	H
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

【0 2 2 2】

表 2 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

X = C₂H₅、Z = CH₃、V¹ = H、V² = H。

表 3 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

X = C₂H₅、Z = C₂H₅、V¹ = H、V² = H。

表 4 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

X = CH₃、Z = CH₃、V¹ = 4-C1、V² = H。

表 5 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

X = C₂H₅、Z = CH₃、V¹ = 4-C1、V² = H。

表 6 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

10

20

30

40

50

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表 7 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表 8 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表 9 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表 10 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 2-Cl$ 、 $V^2 = 4-Cl$ 。

表 11 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 2-Cl$ 、 $V^2 = 4-Cl$ 。

表 12 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 2-Cl$ 、 $V^2 = 4-Cl$ 。

表 13 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CF_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 14 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CF_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 15 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-CF_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 16 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 17 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 18 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 19 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 20 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 21 : A、B および D は各々表 1 に示された通りである

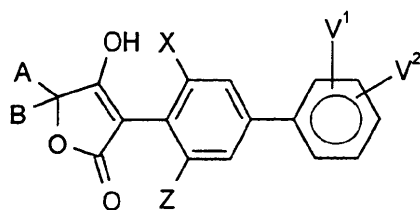
$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

【0223】

製造実施例で挙げられた化合物の他に、下記の式 (I-2-a) の化合物が具体的に挙げられる：

【0224】

【化58】



【0225】

10

20

30

40

【表 5】

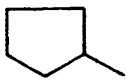
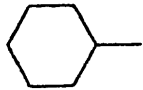
表22: $X = \text{CH}_3$, $Z = \text{CH}_3$, $V^1 = \text{H}$, $V^2 = \text{H}$.

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

【 0 2 2 6 】

【表 6】

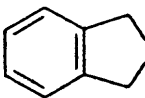
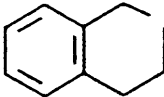
表22(続き):

A	B
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	

【 0 2 2 7 】

【表 7】

表22(続き):

A	B
	$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$
	$-CH_2-(CHCH_3)_2-(CH_2)_2-$
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad CH_2 \end{array}$
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_4 \end{array}$
	$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ \qquad \qquad (CH_2)_3 \end{array}$
	
	

10

20

【0228】

表23: AおよびBは各々表22に示された通りである

30

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = H$ 、 $V^2 = H$ 。

表24: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = H$ 、 $V^2 = H$ 。

表25: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表26: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表27: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表28: AおよびBは各々表22に示された通りである

40

 $X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表29: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表30: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 3-Cl$ 、 $V^2 = H$ 。

表31: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CF_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表32: AおよびBは各々表22に示された通りである

 $X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CF_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表33: AおよびBは各々表22に示された通りである

50

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 3 4 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 2-CH_3$ 、 $V^2 = 4-CH_3$ 。

表 3 5 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 2-CH_3$ 、 $V^2 = 4-CH_3$ 。

表 3 6 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 2-CH_3$ 、 $V^2 = 4-CH_3$ 。

表 3 7 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 3 8 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 3 9 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-CH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 4 0 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = CH_3$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 4 1 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

$X = C_2H_5$ 、 $Z = CH_3$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

表 4 2 : A および B は各々表 2 2 に示された通りである

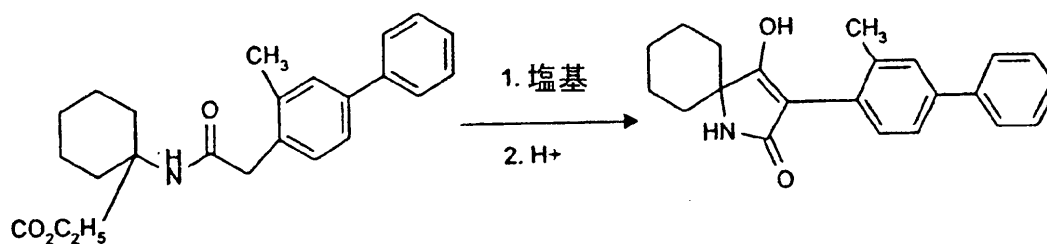
$X = C_2H_5$ 、 $Z = C_2H_5$ 、 $V^1 = 4-OCH_3$ 、 $V^2 = H$ 。

【0229】

方法 (A) に従い、N-[(2-メチル-4-フェニル)-フェニルアセチル]-1-アミノシクロヘキサン-カルボン酸エチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0230】

【化59】



【0231】

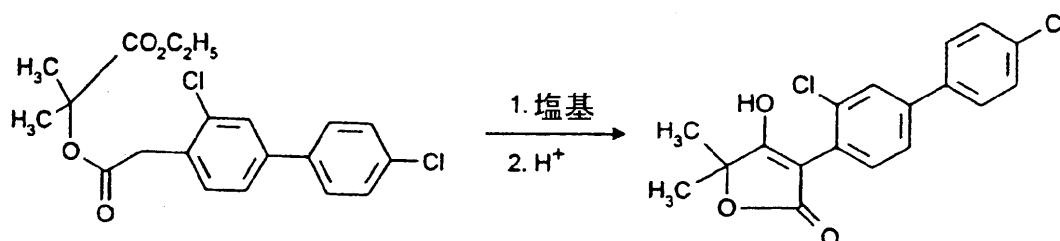
により表すことができる。

【0232】

方法 (B) に従い、O-[(2-クロロ-4-(4-クロロ)-フェニル)-フェニルアセチル]-2-ヒドロキシイソ酪酸エチルを用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0233】

【化60】



【0234】

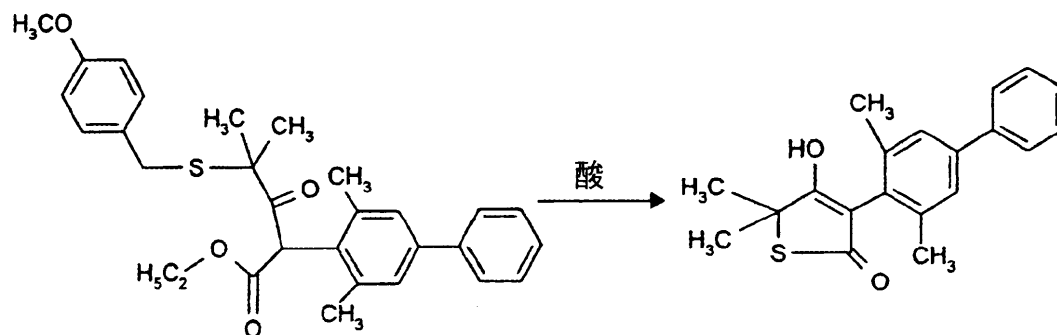
により表すことができる。

【0235】

方法(C)に従い、2-[(2,6-ジメチル-4-フェニル)-フェニル]-4-(4-メトキシ)-ベンジルメルカプト-4-メチル-3-オキソ-酪酸エチルを用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0236】

【化61】



10

【0237】

により表すことができる。

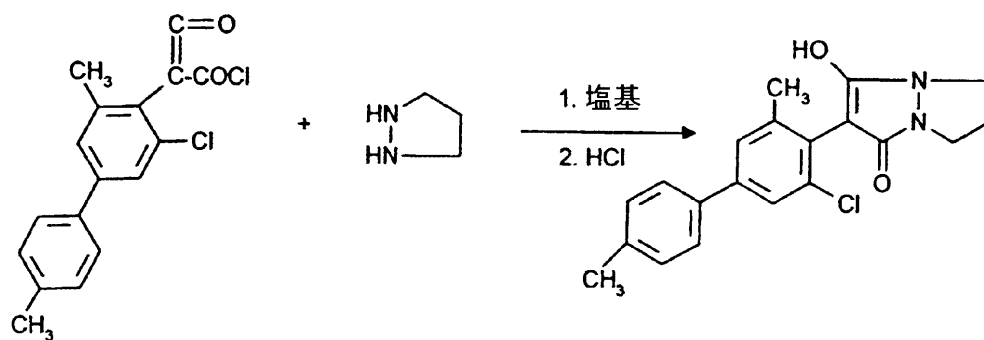
20

【0238】

例えば方法(D-α)に従い、クロロカルボニル3-[(2-クロロ-6-メチル-4-(4-メチル)-フェニル)-フェニル]ケテンおよび1,2-ジアザシクロペンタンを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0239】

【化62】



30

【0240】

により表すことができる。

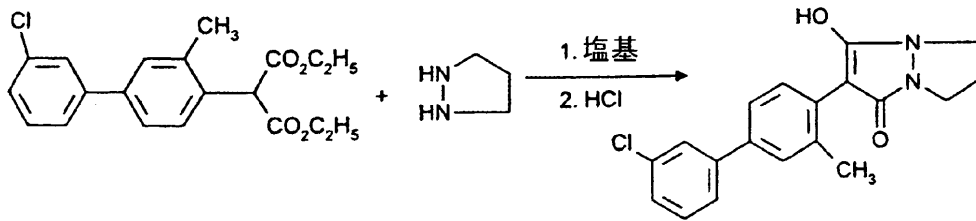
【0241】

40

例えば方法(D-β)に従い、3-[(2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-フェニル]マロン酸ジエチルおよび1,2-ジアザシクロペンタンを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0242】

【化 6 3】



【0 2 4 3】

により表すことができる。

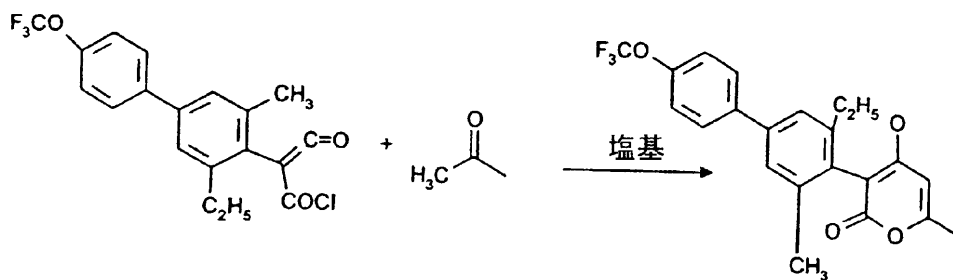
10

【0 2 4 4】

例えば方法（E）に従い、クロロカルボニル 2-[(2-エチル-6-メチル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-フェニル) ケテンおよびアセトンを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0 2 4 5】

【化 6 4】



20

【0 2 4 6】

により表すことができる。

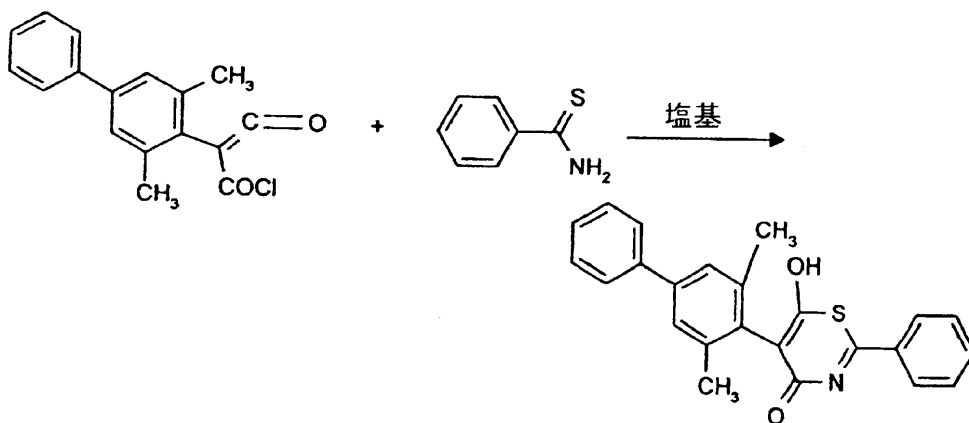
【0 2 4 7】

例えば方法（F）に従い、クロロカルボニル 2-[(2, 6-ジメチル-4-フェニル)-フェニル] ケテンおよびチオベンズアミドを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

30

【0 2 4 8】

【化 6 5】



40

【0 2 4 9】

により表すことができる。

【0 2 5 0】

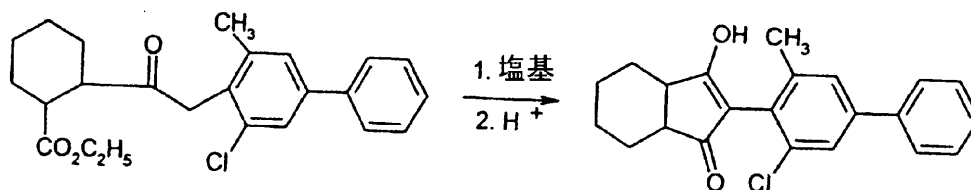
方法（G）に従い、5-[(2-クロロ-6-メチル-4-フェニル)-フェニル] -

50

2, 3-テトラメチレン-4-オキソ-吉草酸エチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0251】

【化66】



10

【0252】

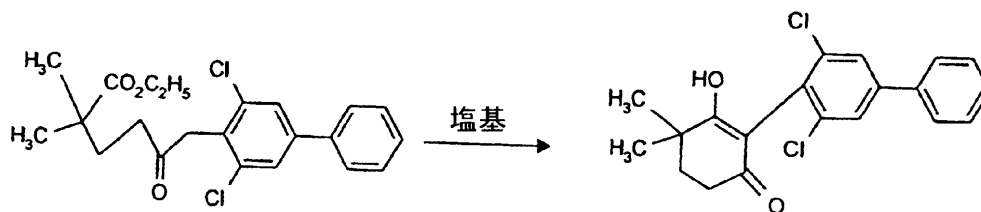
により表すことができる。

【0253】

方法(H)に従い、5-[(2, 6-ジクロロ-4-フェニル)-フェニル]-2, 2-ジメチル-5-オキソ-ヘキサン酸エチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0254】

【化67】



20

【0255】

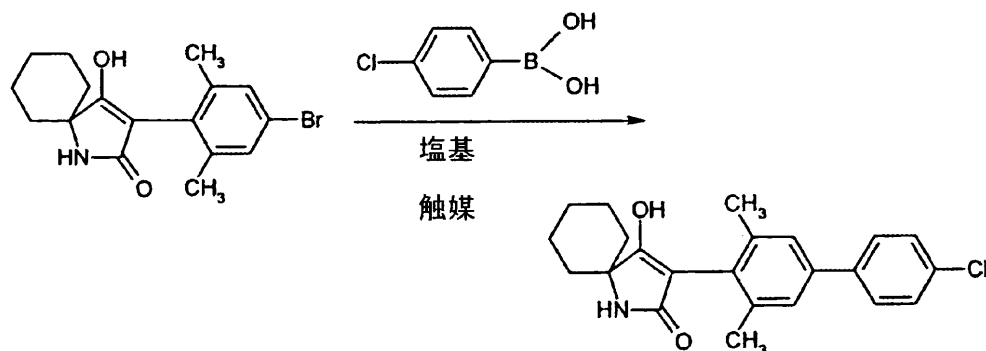
により表すことができる。

【0256】

方法(I)に従い、3-[(2, 6-ジメチル-4-ブロモ)-フェニル]-4, 4-(ペンタメチレン)-ピロリジン-2, 4-ジオンおよび4-クロロフェニルボロン酸を出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0257】

【化68】



40

【0258】

により表すことができる。

【0259】

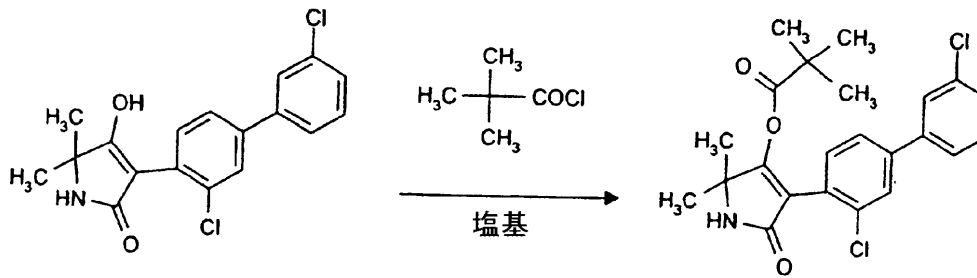
方法(Jα)に従い、3-[(2-クロロ-4-(3-クロロフェニル))-フェニル]-5, 5-ジメチルピロリジン-2, 4-ジオンおよび塩化ピバロイルを

50

出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0260】

【化69】



10

【0261】

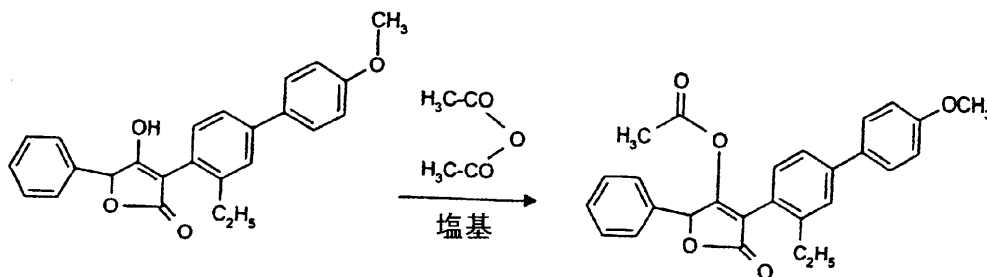
により表すことができる。

【0262】

方法(J)、(変法β)に従い、3-[(2-エチル-4-(4-メトキシフェニル)-フェニル)-4-ヒドロキシ-5-フェニル-Δ³-ジヒドロフラン-2-オン]および無水酢酸を出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0263】

【化70】



20

【0264】

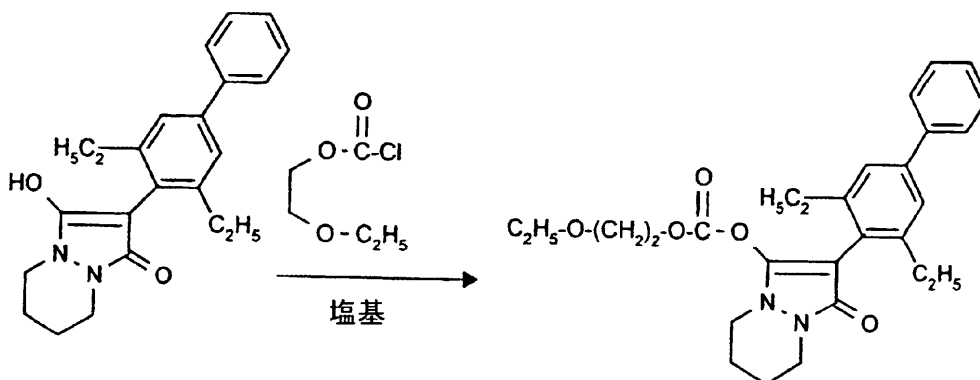
により表すことができる。

【0265】

方法(K)に従い、8-[(2,6-ジエチル-4-フェニル)-フェニル]-1,6-ジアザビシクロ(4.3.0)^{1.6}-ノナン-7,9-ジオンおよびクロロ蟻酸エトキシエチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0266】

【化71】



40

【0267】

により表すことができる。

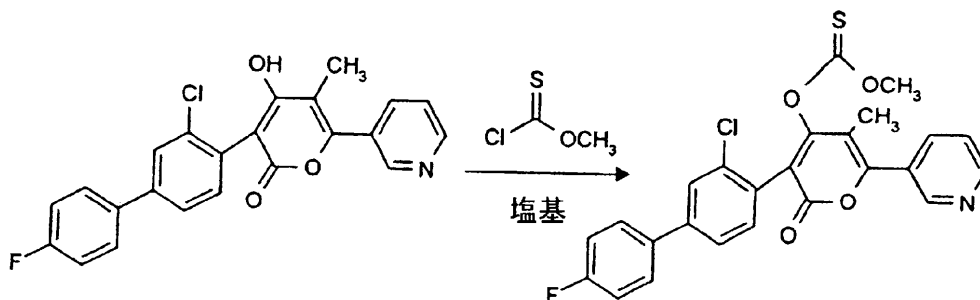
50

【0268】

方法(L)に従い、3-[(2-クロロ-4-(4-フルオロフェニル)フェニル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-6-(3-ピリジル)ピロンおよびクロロモノチオ蟻酸メチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0269】

【化72】



10

【0270】

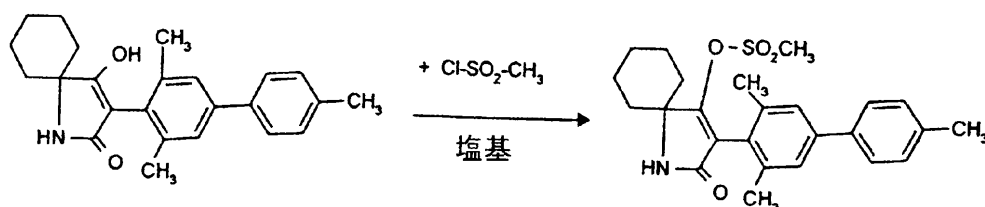
により表すことができる。

【0271】

方法(M)に従い、2-[(2,6-ジメチル-4-(4-メチルフェニル)フェニル)-5,5-ペンタメチレンピロリジン-2,4-ジオンおよび塩化メタンスルホニルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0272】

【化73】



30

【0273】

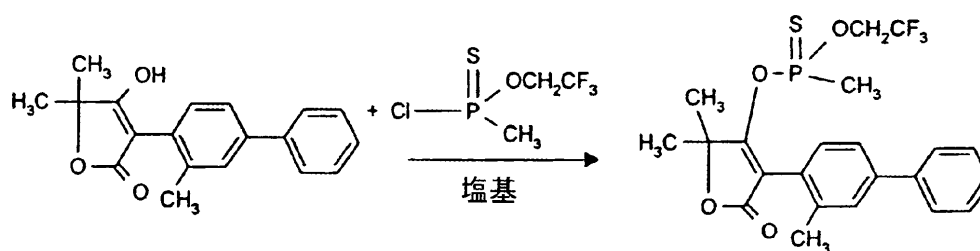
により表すことができる。

【0274】

方法(N)に従い、2-[(2-メチル-4-フェニル)フェニル]-4-ヒドロキシ-5,5-ジメチル-Δ³-ジヒドロフラン-2-オンおよび2,2,2-トリフルオロエチルメタンチオホスホニルクロリドを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0275】

【化74】



40

【0276】

により表すことができる。

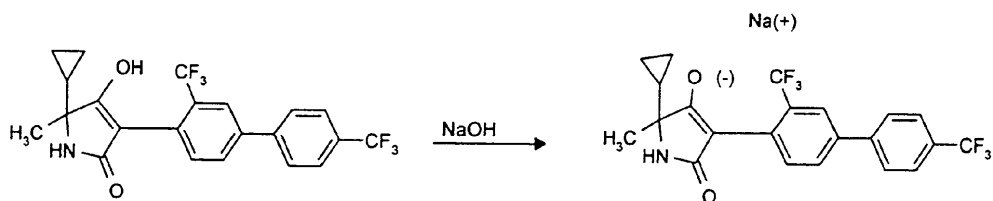
50

【0277】

方法（O）に従い、3-[(2-トリフルオロメチル-4-(4-トリフルオロメチル-フェニル)-フェニル)-5-シクロプロピル-5-メチル-ピロリジン-2,4-ジオンおよびNaOHを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0278】

【化75】



10

【0279】

により表すことができる。

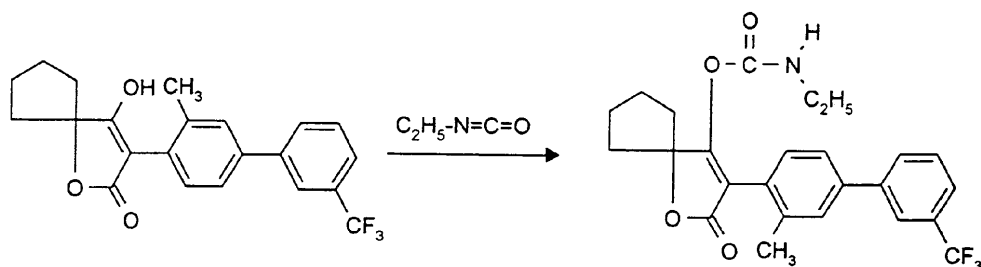
【0280】

方法（P）、変法αに従い、3-[(2-メチル-4-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-フェニル)-4-ヒドロキシ-5-テトラメチレン-Δ³-ジヒドロフラン-2-オンおよびイソシアヌ酸エチルを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

20

【0281】

【化76】



30

【0282】

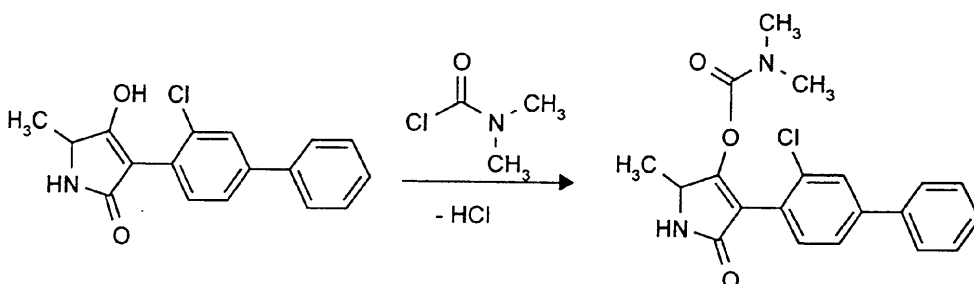
により表すことができる。

【0283】

方法（P）、変法βに従い、3-[(2-メチル-4-フェニル)-フェニル]-5-メチル-ピロリジン-2,4-ジオンおよびジメチルカルバモイルクロリドを出発物質として用いると、本発明に従う方法の工程は下記の式：

【0284】

【化77】



40

【0285】

により表すことができる。

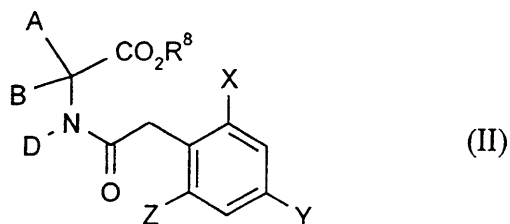
【0286】

50

本発明に従う方法 (a) において出発物質として必要な式 (I I)

【0287】

【化78】



10

【0288】

[式中、

A、B、D、X、Y、ZおよびR⁸は各々以上で定義されている通りである]
の化合物は新規である。

【0289】

式 (I I) のアシルアミノ酸エステル類は、例えば、式 (X X I I I)

【0290】

【化79】



20

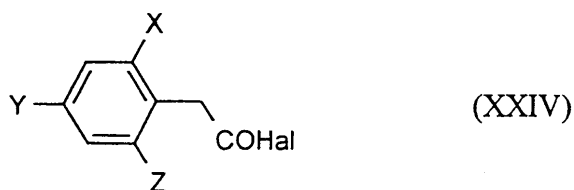
【0291】

[式中、

A、B、R⁸およびDは各々上記で定義されている通りである]
のアミノ酸誘導体を式 (X X I V)

【0292】

【化80】



30

【0293】

[式中、

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りであり、そして
Halは塩素または臭素を表す]

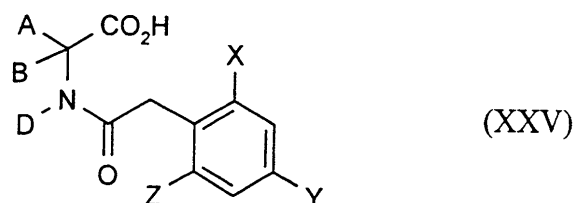
の置換されたフェニルアセチルハライド類を用いてアシル化する時 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968)、

または式 (X X V)

【0294】

40

【化 8 1】



【0 2 9 5】

〔式中、

10

A、B、D、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕

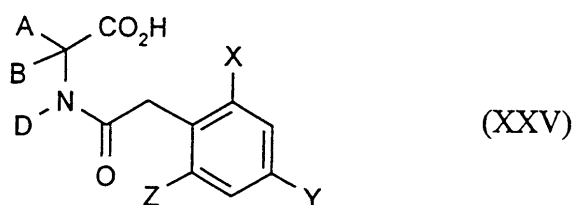
のアシルアミノ酸類をエステル化する時 (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)) に得られる。

【0 2 9 6】

式 (XXV)

【0 2 9 7】

【化 8 2】



20

【0 2 9 8】

〔式中、

A、B、D、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕

の化合物は新規である。

【0 2 9 9】

式 (XXV) の化合物は、例えば Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 505) に従い、式 (XXVI)

30

【0 3 0 0】

【化 8 3】



【0 3 0 1】

〔式中、

40

A、BおよびDは各々上記で定義されている通りである〕

のアミノ酸類を式 (XXIV)

【0 3 0 2】

【化 8 4】



【0303】

[式中、

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りであり、そして

10

Halは塩素または臭素を表す]

の置換されたフェニルアセチルハライド類を用いてアシル化する時に得られる。

【0304】

式 (XXIV) の化合物は新規である。それらは原則的に既知である方法により製造することができる (例えば、H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Vol. 8, p. 467-469 (1952) 参照)。

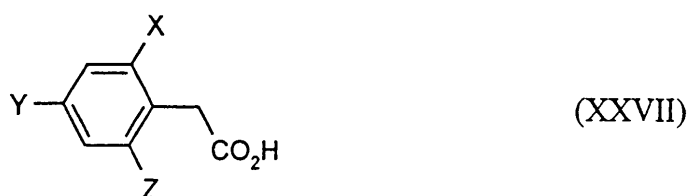
【0305】

式 (XXIV) の化合物は、例えば、式 (XXVII)

20

【0306】

【化 8 5】



【0307】

[式中、

30

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の置換されたフェニル酢酸類を、適宜希釈剤 (例えば場合により塩素化されていてもよい脂肪族または芳香族炭化水素類、例えばトルエンまたは塩化メチレン) の存在下で、 -20°C ~ 150°C 、好ましくは -10°C ~ 100°C 、の温度において、ハロゲン化剤 (例えば塩化チオニル、臭化チオニル、塩化オキサリル、ホスゲン、三塩化リン、三臭化リンまたは五塩化リン) と反応させることにより得られる。

【0308】

式 (XXIII) および式 (XXVI) の化合物の一部は既知であり、および/またはそれらは既知の方法により製造することができる (例えば、Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, p. 11-22, 23-27 (1970) 参照)。

40

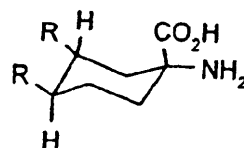
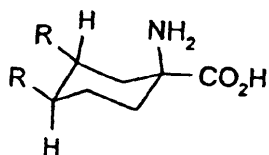
【0309】

AおよびBが環を形成する式 (XXVIa) の置換された環式アミノカルボン酸類は一般的にはブヘラーベルグス (Bucherer-Bergs) 合成によりまたはストレッカー (Strecker) 合成により得られ、そして各場合とも異なる異性体形態で得られる。それ故、ブヘラーベルグス合成の条件下では、基Rおよびカルボキシル基がエクアトリアルである異性体 (簡単にするために以下では β と称する) が主として得られるが、ストレッカー合成の条件下ではアミノ基および基Rがエクアトリアルである異性体 (簡単にするために以下では α と称する) が主として得られる。

【0310】

50

【化 8 6】



ブヘラー-ベルグス合成

ストレッカー合成

10

(β異性体)

(α異性体)

【0311】

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

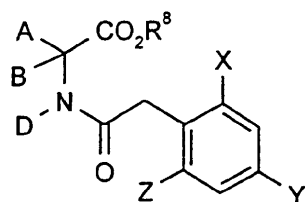
【0312】

さらに、上記の方法 (A) において使用される式 (II)

【0313】

【化 8 7】

20



(II)

【0314】

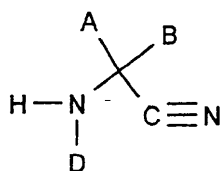
[式中、

A、B、D、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである] の出発物質は、式 (XXVII)

30

【0315】

【化 8 8】



(XXVIII)

【0316】

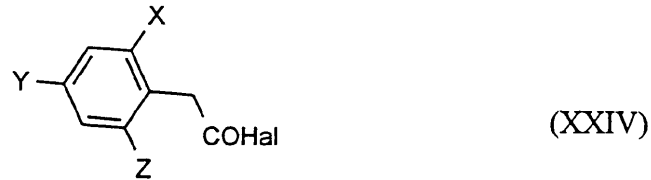
[式中、

A、BおよびDは各々上記で定義されている通りである] のアミノニトリル類を式 (XXIV)

40

【0317】

【化 8 9】



【0 3 1 8】

[式中、

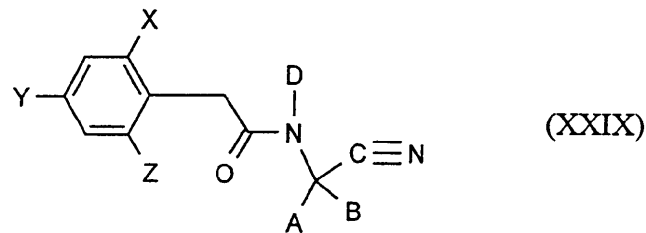
X、Y、ZおよびHalは各々上記で定義されている通りである]

10

の置換されたフェニルアセチルハライド類と反応させて式 (XXIX)

【0 3 1 9】

【化 9 0】



20

【0 3 2 0】

[式中、

A、B、D、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の化合物を与え、そしてこれらを引き続き酸性アルコールシスにかける時に製造することができる。

【0 3 2 1】

式 (XXIX) の化合物も同様に新規である。

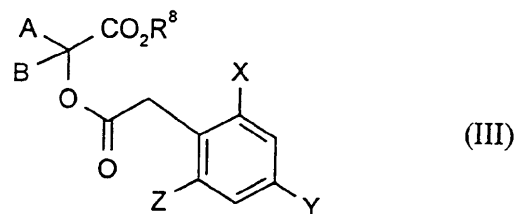
【0 3 2 2】

本発明に従う方法 (B) において出発物質として必要な式 (III)

30

【0 3 2 3】

【化 9 1】



【0 3 2 4】

40

[式中、

A、B、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである]

の化合物は新規である。

【0 3 2 5】

それらは原則的に既知である方法により製造することができる。

【0 3 2 6】

それ故、式 (III) の化合物は、例えば、式 (XXX)

【0 3 2 7】

【化 9 2】



【0 3 2 8】

〔式中、

A、Bおよび R^8 は各々上記で定義されている通りである〕
 の2-ヒドロキシカルボン酸エステル類を式 (XXIV)

【0 3 2 9】

10

【化 9 3】



【0 3 3 0】

〔式中、

X、Y、ZおよびHalは各々上記で定義されている通りである〕
 の置換されたフェニルアセチルハライド類を用いてアシル化する時に得られる (Chem . Reviews 52, 237-416 (1953))。

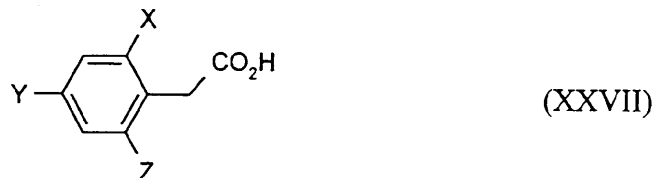
20

【0 3 3 1】

さらに、式 (III) の化合物は、式 (XXVII)

【0 3 3 2】

【化 9 4】



30

【0 3 3 3】

〔式中、

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕
 の置換されたフェニル酢酸類を式 (XXXI)

【0 3 3 4】

【化 9 5】



40

【0 3 3 5】

〔式中、

A、Bおよび R^8 は各々上記で定義されている通りであり、そして
 Halは塩素または臭素を表す〕
 の α -ハロゲノカルボン酸エステル類を用いてアルキル化する時にも得られる。

【0 3 3 6】

式 (XXVII) の化合物は新規である。

50

【0337】

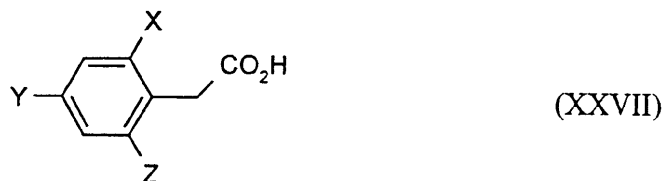
式 (XXXI) の化合物は既知でありそしてほとんどの場合市販されている。

【0338】

式 (XXVII)

【0339】

【化96】



10

【0340】

[式中、

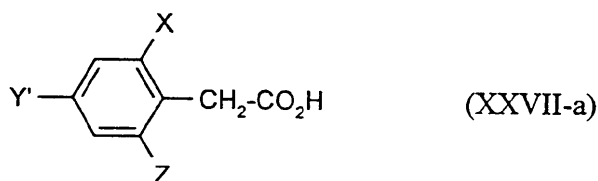
X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の化合物は、例えば、

α) 溶媒、塩基および触媒 (好ましくはパラジウム錯体、例えば、テトラキス (トリフェニルホスフィン) -パラジウム) の存在下で、式 (XXVII-a)

【0341】

【化97】



20

【0342】

[式中、

XおよびZは各々上記で定義されている通りであり、

Y' は塩素または臭素を表し、好ましくは臭素を表す]

の化合物を式 (XII)

【0343】

【化98】



【0344】

[式中、

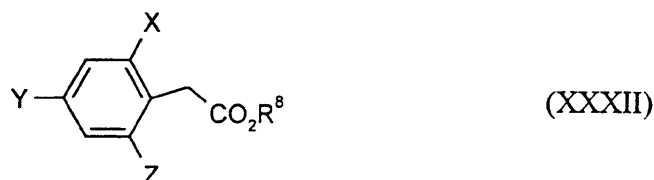
Yは上記で定義されている通りである]

のボロン酸と反応させる時に、或いは

β) 式 (XXXII)

【0345】

【化99】



40

【0346】

50

[式中、

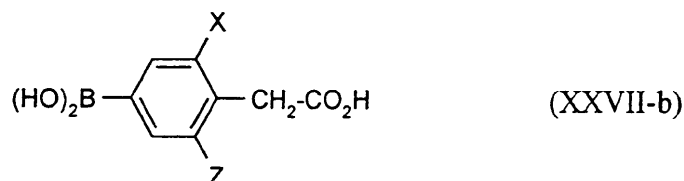
X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである]

のフェニル酢酸エステル類を一般的に既知である標準条件下で酸類または塩基類の存在下で、溶媒の存在下で、加水分解する時に、或いは

γ) 式 (XXVII-b)

【0347】

【化100】



10

【0348】

[式中、

XおよびZは各々上記で定義されている通りである]

のフェニル酢酸類を、溶媒、塩基および触媒（好ましくは上記のパラジウム錯体の1つ）の存在下で、式 (XXXXIII)

Y-Hal

(XXXXIII)

[式中、

Yは上記で定義されている通りであり、そして

Halは塩素、臭素またはヨウ素を表す]

のハロゲン化合物と反応させる時に

得られる。

【0349】

式 (XII) および (XXXXIII) の化合物は既知であり、それらの一部は市販されており、或いはそれらは原則的に既知である方法により製造することができる。式 (XXVII-a) のフェニル酢酸類の一部はWO 96/35 664およびWO 97/02 243から既知であり、またはそれらはそこに記載された方法により製造することができる。

30

【0350】

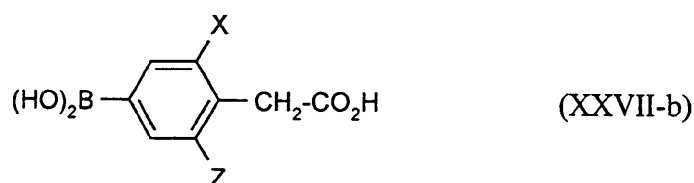
式 (XXVII-b) および (XXXXIII) の化合物は新規である。

【0351】

式 (XXVII-b)

【0352】

【化101】



40

【0353】

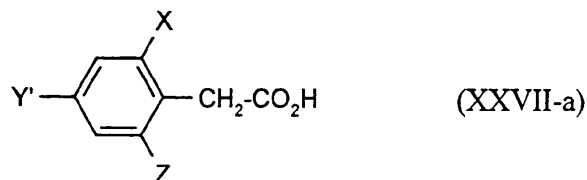
[式中、

XおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の化合物は、例えば、式 (XXVII-a)

【0354】

【化 1 0 2】



【 0 3 5 5】

〔式中、

X、Y' および Z は各々上記で定義されている通りである〕

10

のフェニル酢酸類を、希釈剤の存在下で、式 (XXXIV)



〔式中、

R²¹ は C₁ - C₈ - アルキルまたはフェニルを表し、好ましくは n - C₄H₉ を表す〕

のリチウム化合物および式 (XXXV)



〔式中、

R⁸ は上記で定義されている通りである〕

のボロン酸エステル類と反応させる時に得られる。

【 0 3 5 6】

20

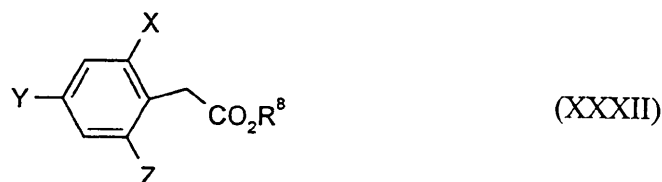
式 (XXXIV) および (XXXV) の化合物は市販の化合物である。

【 0 3 5 7】

式 (XXXII)

【 0 3 5 8】

【化 1 0 3】



30

【 0 3 5 9】

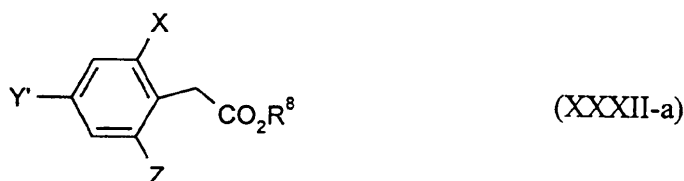
〔式中、

X、Y、Z および R⁸ は各々上記で定義されている通りである〕

の化合物は、例えば、式 (XXXII-a)

【 0 3 6 0】

【化 1 0 4】



40

【 0 3 6 1】

〔式中、

R⁸、X、Y' および Z は各々上記で定義されている通りである〕

のフェニル酢酸エステル類を、溶媒、塩基および触媒（好ましくは上記のパラジウム錯体の 1 つ）の存在下で、式 (XII)

【 0 3 6 2】

【化 1 0 5】



【 0 3 6 3】

〔式中、

Yは以上で定義されている通りである〕

のボロン酸類と反応させる時に得られる。

【 0 3 6 4】

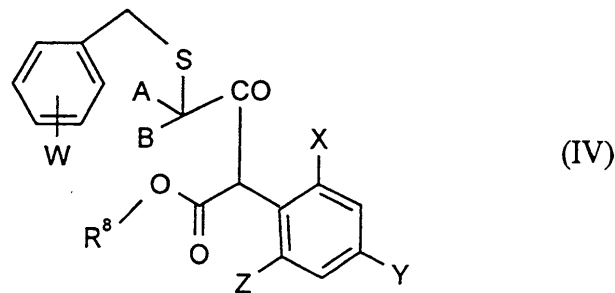
式 (XXXI I - a) のフェニル酢酸エステル類の一部は出願 WO 96/35664 および WO 97/02243 から既知であり、またはそれらはそこに記載されている方法により製造することができる。

【 0 3 6 5】

上記の方法 (C) において出発物質として必要な式 (I V)

【 0 3 6 6】

【化 1 0 6】



【 0 3 6 7】

〔式中、

A、B、W、X、Y、Z および R⁸ は各々上記で定義されている通りである〕

の化合物は新規である。

【 0 3 6 8】

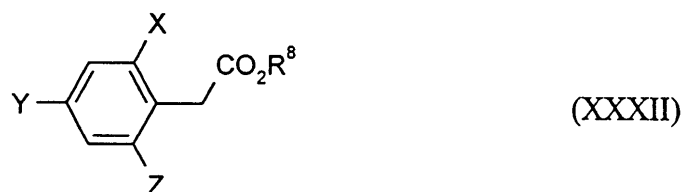
それらは原則的に既知である方法により製造することができる。

【 0 3 6 9】

式 (I V) の化合物は、例えば、式 (XXXI I)

【 0 3 7 0】

【化 1 0 7】



【 0 3 7 1】

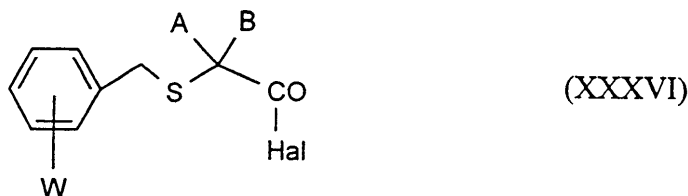
〔式中、

X、Y、R⁸ および Z は各々上記で定義されている通りである〕

の置換されたフェニル酢酸エステル類を、強塩基の存在下で、式 (XXXV I)

【 0 3 7 2】

【化 1 0 8】



【 0 3 7 3】

〔式中、

10

A、BおよびWは各々上記で定義されている通りであり、そして
Halはハロゲン（特に塩素または臭素）を表す]

の2-ベンジルチオカルボニルハライド類を用いてアシル化する時に得られる（例えば、M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228参照）。

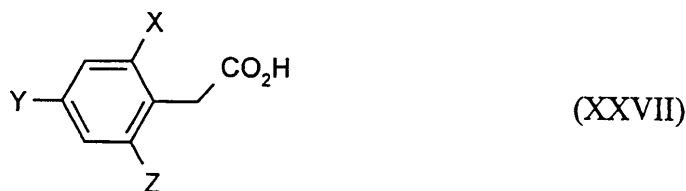
【 0 3 7 4】

式（XXXII）の化合物は新規である。式（XXXII）の化合物は、例えば、式（XXVII）

【 0 3 7 5】

【化 1 0 9】

20



【 0 3 7 6】

〔式中、

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

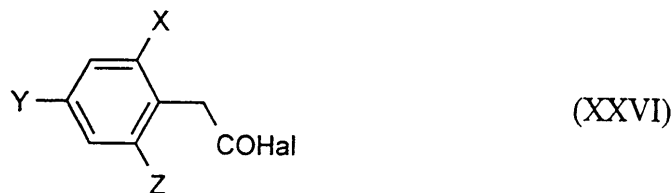
30

の化合物をアルコール類および脱水剤（例えば濃硫酸）の存在下でエステル化する時に、
或いは

式（XXIV）

【 0 3 7 7】

【化 1 1 0】



40

【 0 3 7 8】

〔式中、

X、Y、ZおよびHalは各々上記で定義されている通りである]

の化合物を用いてアシル化する時に得られる（Chem. Reviews 52, 237-416 (1953)）。

【 0 3 7 9】

式（XXXVI）のベンジルチオカルボニルハライド類の一部は既知であり、および／またはそれらは既知の方法により製造することができる（J. Antibiotics (1983), 26, 1589）。

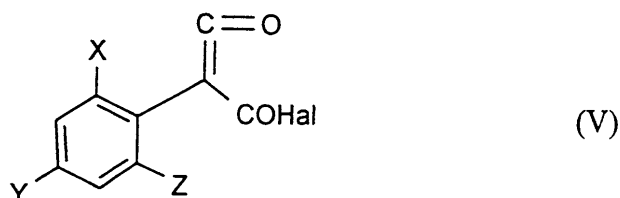
50

【0380】

上記の方法 (D)、(E) および (F) における出発物質として必要な式 (V) のハロゲノカルボニルケテン類は新規である。それらは原則的に一般的に既知である方法により製造することができる (例えば、Org. Prep. Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 および DE 1 945 703 参照)。それ故、例えば、式 (V)

【0381】

【化111】



10

【0382】

[式中、

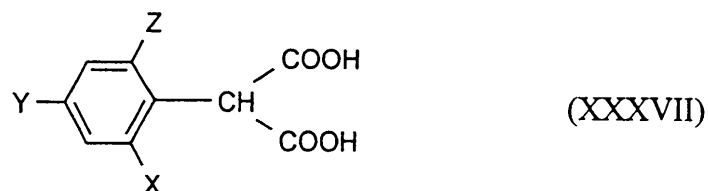
X、Y および Z は各々上記で定義されている通りであり、そして
Hal は塩素または臭素を表す]

の化合物は、式 (XXXVII)

20

【0383】

【化112】



【0384】

[式中、

X、Y および Z は各々上記で定義されている通りである]

の置換されたフェニルマロン酸類を、適宜触媒、例えば、ジメチルホルムアミド、メチルエステルホルムアミドまたはトリフェニルホスフィン、の存在下でそして適宜塩基、例えば、ピリジンまたはトリエチルアミン、の存在下で、アシルハライド類、例えば、塩化チオニル、塩化燐 (V)、塩化燐 (III)、塩化オキサリル、ホスゲンまたは臭化チオニルと反応させる時に得られる。

【0385】

式 (XXXVII) の置換されたフェニルマロン酸類は新規である。それらは一般的に既知である方法により製造することができる (例えば、Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 517 ff, EP-A-528156, WO96/35664, WO97/02243 参照)。

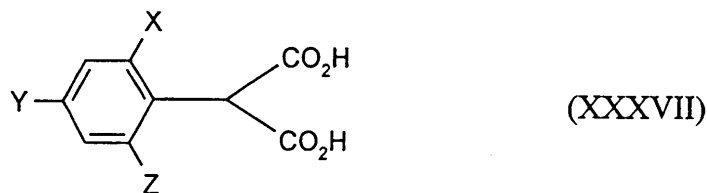
40

【0386】

それ故、式 (XXXVII)

【0387】

【化 1 1 3】



【0 3 8 8】

[式中、

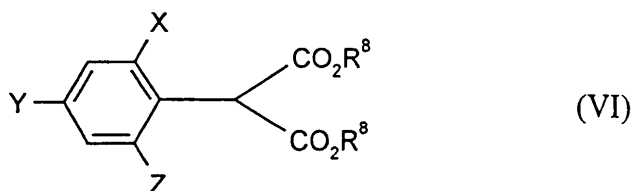
X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

10

のフェニルマロン酸類は、式 (V I)

【0 3 8 9】

【化 1 1 4】



【0 3 9 0】

20

[式中、

X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである]

のフェニルマロン酸エステル類を最初に塩基の存在下でそして溶媒中で加水分解しそして引き続き注意深く酸性化する時に得られる (E P - 5 2 8 1 5 6、W O 9 6 / 3 5 6 6 4、W O 9 7 / 0 2 2 4 3)。

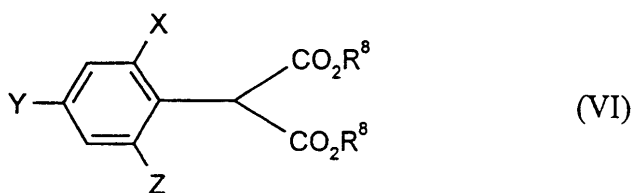
【0 3 9 1】

式 (V I)

【0 3 9 2】

【化 1 1 5】

30



【0 3 9 3】

[式中、

X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである]

のマロン酸エステル類は新規である。

【0 3 9 4】

40

それらは一般的に既知である有機化学方法により製造することができる (例えば、T e t r a h e d r o n L e t t . 2 7, 2 7 6 3 (1 9 8 6) および O r g a n i k u m , V E B D e u t s c h e r V e r l a g d e r W i s s e n s c h a f t e n , B e r l i n 1 9 7 7, p. 5 8 7 f f 参照)。

【0 3 9 5】

本発明に従う方法 (D) 用の出発物質として必要な式 (V I I)



[式中、

AおよびDは各々上記で定義されている通りである]

のヒドラジン類の一部は既知であり、および／またはそれらは文献から既知である方法に

50

より製造することができる（例えば、Liebigs Ann. Chem. 585, 6 (1954); Reactionen der organischen Synthese, C. Ferri, p. 212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem. 443, 242 (1925); Chem. Ber. 98, 2551 (1965), EP-508126 参照）。

【0396】

本発明に従う方法（E）のための出発物質として必要な式（VIII）

【0397】

【化116】

10



【0398】

[式中、

AおよびDは各々上記で定義されている通りである]

のカルボニル化合物または式（VIIIa）

【0399】

【化117】

20



【0400】

[式中、

A、DおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである]

のそれらのシリルエノールエーテル類は市販の一般的に既知である化合物または既知の方法により得られる化合物である。

30

【0401】

本発明に従う方法（F）を実施するための出発物質として必要な式（V）のケテン酸クロリド類の製造はすでに以上で記載されている。本発明に従う方法（F）を実施するために必要な式（IX）

【0402】

【化118】



40

【0403】

[式中、

Aは上記で定義されている通りである]

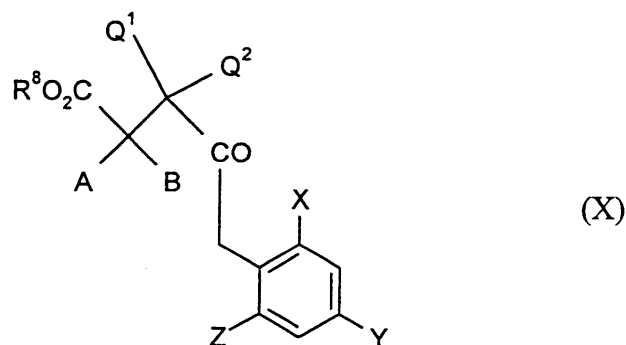
のチオアミド類は有機化学において一般的に既知である化合物である。

【0404】

上記の方法（G）において出発物質として必要な式（X）

【0405】

【化 1 1 9】



10

【0 4 0 6】

〔式中、

A、B、Q¹、Q²、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである〕
 の化合物は新規である。

【0 4 0 7】

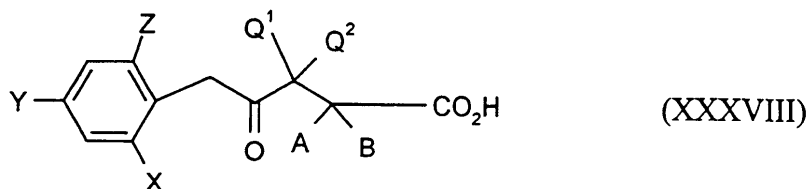
それらは原則的に既知である方法により製造することができる。

【0 4 0 8】

式 (X) の 5-アリール-4-ケトカルボン酸エステル類は、例えば、式 (XXXVI I I) 20

【0 4 0 9】

【化 1 2 0】



【0 4 1 0】

30

〔式中、

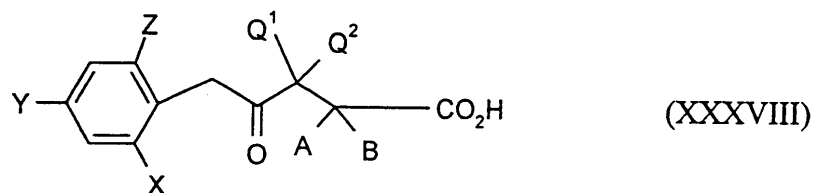
X、Y、Z、A、B、Q¹およびQ²は各々上記で定義されている通りである〕
 の 5-アリール-4-ケトカルボン酸類をエステル化するか（例えば、Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, page 499参照）またはアルキル化する（製造実施例参照）時に得られる。

【0 4 1 1】

式 (XXXV I I I)

【0 4 1 2】

【化 1 2 1】



40

【0 4 1 3】

〔式中、

A、B、Q¹、Q²、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕
 の 5-アリール-4-ケトカルボン酸類は新規であるが、原則的に既知である方法により 50

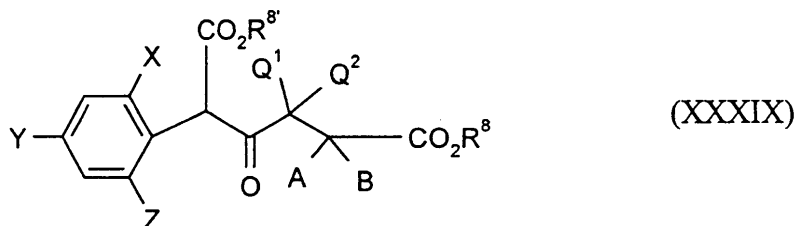
製造することができる（製造実施例参照）。

【0414】

式（XXXVII）の5-アリール-4-ケトカルボン酸類は、例えば、式（XXXIX）

【0415】

【化122】



10

【0416】

[式中、

A、B、D¹、D²、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りであり、そしてR⁸およびR^{8'}は各々アルキル（特にC₁–C₈–アルキル）を表す]

の2-フェニル-3-オキソアジピン酸エステル類を、適宜希釈剤の存在下でそして適宜塩基または酸の存在下で、脱カルボキシル化する時に得られる（例えば、Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, page 519 to 521 参照）。

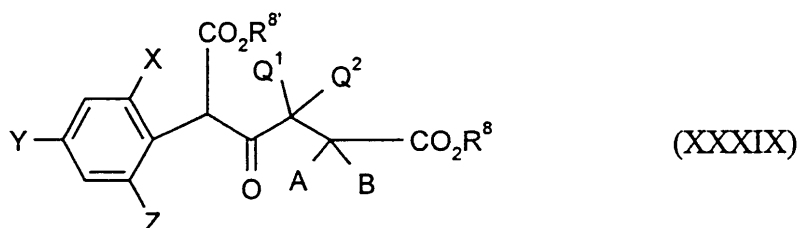
20

【0417】

式（XXXIX）

【0418】

【化123】



30

【0419】

[式中、

A、B、Q¹、Q²、X、Y、Z、R⁸、R^{8'}は各々上記で定義されている通りである]

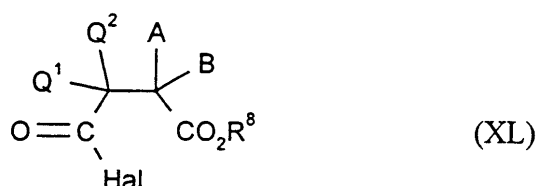
の化合物は新規である。

【0420】

式（XXXIX）の化合物は、例えば、式（XL）

【0421】

【化124】



【0422】

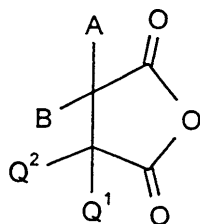
50

[式中、
A、B、Q¹、Q²およびR⁸は各々上記で定義されている通りであり、そしてHalは
塩素または臭素を表す]

のジカルボン酸モノエステルクロリド類または式(XLI)

【0423】

【化125】



(XLI)

10

【0424】

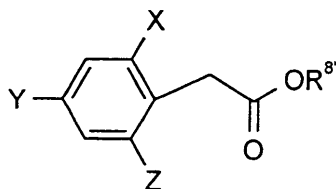
[式中、

A、B、Q¹およびQ²は各々上記で定義されている通りである]

の無水カルボン酸類を、希釈剤の存在下でそして塩基の存在下で、式(XXXII)

【0425】

【化126】



(XXXII)

20

【0426】

[式中、

X、Y、ZおよびR^{8'}は各々上記で定義されている通りである]

のフェニル酢酸エステルを用いてアシル化する時に得られる(例えば、M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228参照、製造実施例も参照)。

【0427】

式(XL)および式(XLI)の化合物の一部は既知の有機化学化合物であり、および／またはそれらは簡単な方法で原則的に既知である方法により製造することができる。

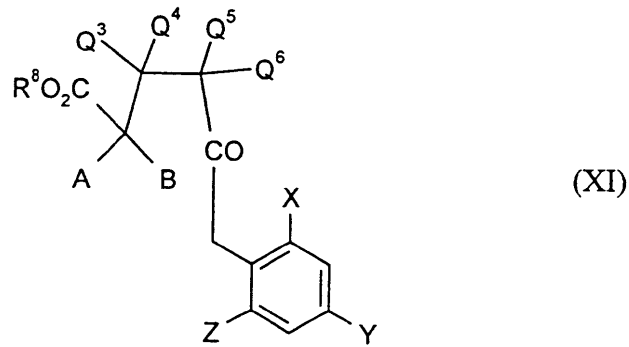
【0428】

上記の方法(H)において出発物質として必要な式(XI)

【0429】

30

【化 1 2 7】



10

【0 4 3 0】

〔式中、

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y、ZおよびR⁸は各々上記で定義されている通りである〕

の化合物は新規である。

【0 4 3 1】

それら原則的に既知である方法により製造することができる。

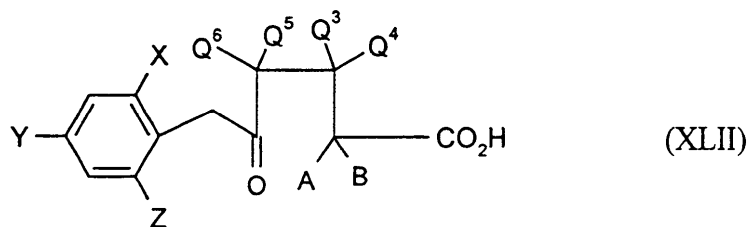
【0 4 3 2】

式 (X I) の 6-アリール-5-ケトカルボン酸エステル類は、例えば、式 (X L I I)

20

【0 4 3 3】

【化 1 2 8】



30

【0 4 3 4】

〔式中、

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである〕

の 6-アリール-5-ケトカルボン酸類をエステル化する時に得られる (例えば、Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, page 499 および製造実施例参照)。

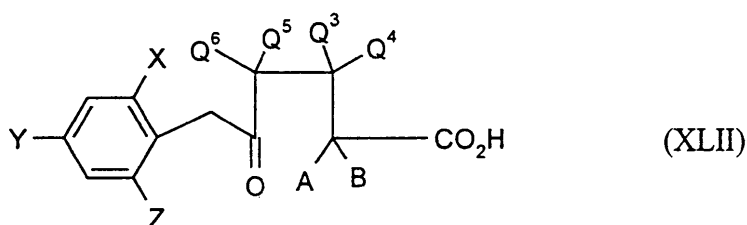
【0 4 3 5】

式 (X L I I)

40

【0 4 3 6】

【化 1 2 9】



50

【0437】

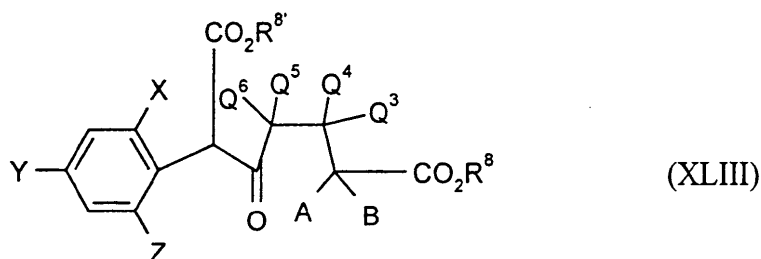
[式中、

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の6-アリール-5-ケトカルボン酸類は新規である。それらは原則的に既知である方法により、例えば式(XLIII)

【0438】

【化130】



10

【0439】

[式中、

A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、YおよびZは各々上記で定義されている通りであり、そして

20

R^8 および $R^{8'}$ は各々アルキル（好ましくは $C_1 - C_6$ -アルキル）である]

の置換された2-フェニル-3-オキソ-ヘプタンジオン酸エステル類を、適宜希釈剤の存在下でそして適宜塩基または酸の存在下で、加水分解しそして脱カルボキシル化することにより製造することができる（例えば、Organikum, 15th edition, Berlin, 1977, page 519 to 521および製造実施例参照）。

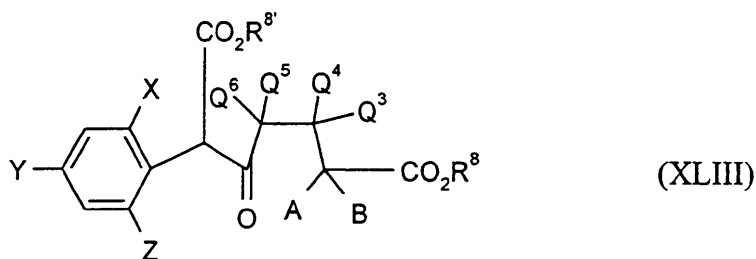
【0440】

式(XLIII)

【0441】

【化131】

30



【0442】

[式中、

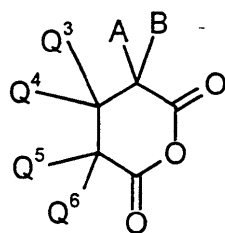
A、B、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 、X、Y、Z、 R^8 および $R^{8'}$ は各々上記で定義されている通りである]

40

の化合物は新規である。それらは式(XLIV)

【0443】

【化 1 3 2】



(XLIV)

【0 4 4 4】

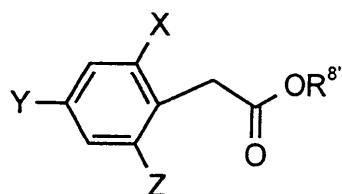
10

〔式中、

A、B、Q³、Q⁴、Q⁵ および Q⁶ は各々上記で定義されている通りである〕
 の無水ジカルボン酸類を希釈剤の存在下でそして塩基の存在下で式 (XXXI I)

【0 4 4 5】

【化 1 3 3】



(XXXII)

20

【0 4 4 6】

〔式中、

X、Y、Z および R^{8'} は各々上記で定義されている通りである〕
 の置換されたフェニル酢酸エステルと縮合させる時に得られる。

【0 4 4 7】

式 (XLIV) の化合物の一部は既知であり、および／またはそれらは既知の方法により製造することができる。

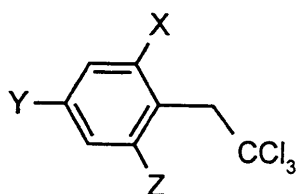
【0 4 4 8】

式 (XXXI I) の化合物は方法 (B) 用の前駆体ですでに記載されている。さらに、
 式 (XXXI I) の化合物は式 (XLV)

30

【0 4 4 9】

【化 1 3 4】



(XLV)

【0 4 5 0】

40

〔式中、

X、Y および Z は各々上記で定義されている通りである〕
 の置換された 1, 1, 1-トリクロロ-2-フェニルエタン類を最初にアルコキシド類 (例えば、ナトリウムメトキシドまたはナトリウムエトキシドの如きアルカリ金属アルコキシド類) と希釈剤 (例えばアルコキシドから誘導されるアルコール) の存在下で 0℃～150℃の間の、好ましくは 20℃～120℃の間の、温度において、そして引き続き酸 (好ましくは、例えば硫酸の如き無機酸) と -20℃～150℃の間の、好ましくは 0℃～100℃の間の、温度において反応させることにより得られる (DE 3 314 249 参照)。

【0 4 5 1】

50

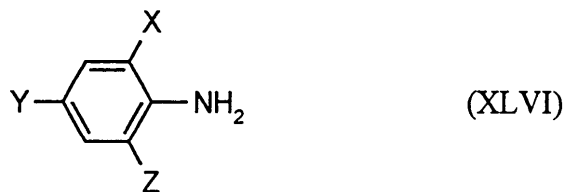
式 (X L V) の化合物は新規であり、それらは原則的に既知である方法により製造することができる。

【0452】

式 (X L V) の化合物は、例えば、式 (X L V I)

【0453】

【化135】



10

【0454】

[式中、

X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

のアニリン類を、式 (X L V I I)



[式中、

R^{21} はアルキル、好ましくは $C_1 - C_6$ - アルキル、を表す]

のアルキルニトリルの存在下で、塩化銅 (I I) の存在下で、そして適宜希釈剤 (例えばアセトニトリルの如き脂肪族ニトリル) の存在下で、 $-20^{\circ}C \sim 80^{\circ}C$ の、好ましくは $0^{\circ}C \sim 60^{\circ}C$ の温度において、塩化ビニリデン ($CH_2 = CCl_2$) と反応させる時に得られる。

20

【0455】

式 (X L V I I) の化合物は既知の有機化学化合物である。塩化銅 (I I) および塩化ビニリデンは昔から知られておりそして市販されている。

【0456】

式 (X L V I) の化合物は新規である。

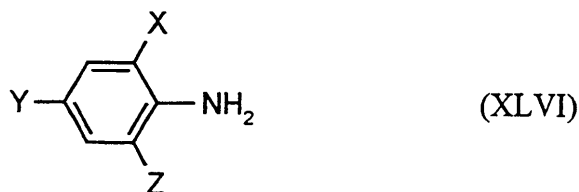
【0457】

式 (X L V I)

30

【0458】

【化136】



【0459】

[式中、

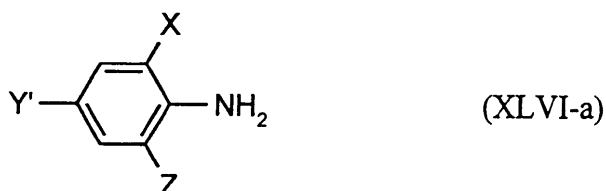
X、YおよびZは各々上記で定義されている通りである]

の化合物は、例えば、式 (X L V I - a)

40

【0460】

【化137】



50

【0461】

〔式中、

XおよびZは各々上記で定義されている通りであり、

Y'はハロゲンを表す（好ましくは臭素を表す）〕

のアニリン類を、溶媒、塩基および触媒（好ましくはパラジウム錯体、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム）の存在下で、式（X I I）

【0462】

【化138】



10

【0463】

〔式中、

Yは上記で定義されている通りである〕

のボロン酸と反応させる時に得られる。

【0464】

A、B、D、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、XおよびZが各々上記で定義されている通りでありそしてY'が塩素および臭素を表し、好ましくは臭素を表し、そして上記の方法（I）における出発物質とし必要な式（I-1'-a）～（I-8'-a）の化合物の一部は既知であり（WO 96/35 664、WO 97/02 243）、或いはそれらはそこに記載されている方法によりまたは方法（A）～（H）により製造することができる。

20

【0465】

式（X I I）

【0466】

【化139】



30

【0467】

〔式中、

Yは上記で定義されている通りである〕

のボロン酸類の一部は市販されており、または簡単な方法で一般的に既知である方法により製造することができる。

【0468】

本発明に従う方法（J）、（K）、（L）、（M）、（N）、（O）および（P）を実施するための出発物質としてその他に必要な式（X I I I）のアシルハライド類、式（X I V）の無水カルボン酸類、式（X V）のクロロ蟻酸エステル類またはクロロ蟻酸チオエステル類、式（X V I）のクロロモノチオ蟻酸エステル類またはクロロジチオ蟻酸エステル類、（X V I I）のスルホニルクロリド類、式（X V I I I）の燐化合物、並びに式（X I X）および（X X）の金属水酸化物、金属アルコキシド類またはアミン類、並びに式（X X I）のイソシアナート類および式（X X I I）のカルバモイルクロリド類は一般的に既知である有機または無機化学化合物である。

40

【0469】

さらに、式（V I I）、（V I I I）、（I X）、（X I I I）～（X X I I I）、（X X V I）、（X X V I I I）、（X X X）、（X X X V I）、（X L）、（X L I）および（X L V I - a）の化合物は最初に引用した特許文献から既知であり、および／また

50

はそれらはそこに記載された方法により製造することができる。

【0470】

方法(A)は、A、B、D、X、Y、ZおよびR⁸が各々上記で定義されている通りである式(I I)の化合物を塩基の存在下で分子間縮合にかけることにより特徴づけられる。

【0471】

本発明に従う方法(A)用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドン、並びにアルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノールおよびtert-ブタノールを使用することが好ましい。

10

【0472】

本発明に従う方法(A)を実施するために適する塩基(脱プロトン化剤)は全ての一般的なプロトン受容体である。アルカリ金属およびアルカリ土類金属酸化物、水酸化物および炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウムを使用することが好ましく、それらは相間移動触媒、例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、アドゲン(Adogen) 464(=メチルトリアルキル(C₈-C₁₀)アンモニウムクロリド)またはTDA1(=トリス-(メトキシエトキシエチル)-アミン)の存在下で使用することもできる。アルカリ金属、例えばナトリウムおよびカリウム、を使用することもできる。さらに、アルカリ金属およびアルカリ土類金属アミド類および水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウムおよび水素化カルシウム、並びにアルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムtert-ブトキシドを使用することもできる。

20

【0473】

本発明に従う方法(A)を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は0℃~250℃の間の、好ましくは50℃~150℃の間の温度で実施される。

30

【0474】

本発明に従う方法(A)は一般的には大気圧で実施される。

【0475】

本発明に従う方法(A)を実施する時には、式(I I)の反応成分および脱プロトン化塩基は一般的には等モル量のほぼ2倍で使用される。しかしながら、それより大過剰(3モルまで)の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0476】

方法(B)は、A、B、X、Y、ZおよびR⁸が各々以上で定義されている通りである式(I I I)の化合物を希釈剤の存在下でそして塩基の存在下で分子間縮合にかけることにより特徴づけられる。

40

【0477】

本発明に従う方法(B)用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドン、並びにアルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノールおよびtert-ブタノールを使用することが好ましい。

【0478】

本発明に従う方法(B)を実施するために適する塩基(脱プロトン化剤)は全ての一般

50

的なプロトン受容体である。アルカリ金属およびアルカリ土類金属酸化物、水酸化物および炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウムを使用することが好ましく、それらは相間移動触媒、例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、アドゲン464（＝メチルトリアルキル（ C_8-C_{10} ）アンモニウムクロリド）またはTDA1（＝トリスー（メトキシエトキシエチル）ーアミン）の存在下で使用することもできる。アルカリ金属、例えばナトリウムおよびカリウム、を使用することもできる。さらに、アルカリ金属およびアルカリ土類金属アミド類および水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウムおよび水素化カルシウム、並びにアルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムtert-ブトキシドを使用することもできる。

10

【0479】

本発明に従う方法（B）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は0℃～250℃の間の、好ましくは50℃～150℃の間の温度で実施される。

【0480】

本発明に従う方法（B）は一般的には大気圧で実施される。

【0481】

本発明に従う方法（B）を実施する時には、式（III）の反応成分および脱プロトン化塩基は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（3モルまで）の一方の成分または他方を使用することも可能である。

20

【0482】

方法（C）は、A、B、W、X、Y、ZおよびR⁸が各々以上で定義されている通りである式（IV）の化合物を酸の存在下でそして、適宜、希釈剤の存在下で分子間縮合にかけることにより特徴づけられる。

【0483】

本発明に従う方法（C）用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにハロゲン化された炭化水素類、例えばジクロロメタン、クロロホルム、塩化メチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドンを使用することが好ましい。さらに、アルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール、tert-ブタノールを使用することもできる。

30

【0484】

適宜、使用される酸が希釈剤として作用することもできる。

【0485】

本発明に従う方法（C）用に適する酸は全ての一般的な無機および有機酸、例えば、ハロゲン化水素酸、硫酸、アルキル、アリールおよびハロアルキルスルホン酸、特にハロゲン化されたアルキルカルボン酸、例えば、トリフルオロ酢酸、である。

【0486】

40

本発明に従う方法（C）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は0℃～250℃の間の、好ましくは50℃～150℃の間の温度で実施される。

【0487】

本発明に従う方法（C）は一般的には大気圧で実施される。

【0488】

本発明に従う方法（C）を実施する時には、式（IV）の反応成分および酸は、例えば、等モル量で使用される。しかしながら、適宜、酸を溶媒としてまたは触媒として使用することも可能である。

【0489】

50

方法 (D- α) および (D- β) は、X、Y、Z、R⁸ および H a l が各々以上で定義されている通りである式 (V) または (V I) の化合物を、適宜塩基の存在下でそして適宜希釈剤の存在下で、A および D が各々以上で定義されている通りである式 (V I I) の化合物と反応させることにより特徴づけられる。

【0490】

本発明に従う方法 (D- α) および (D- β) 用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドン、並びに、式 (V I) の化合物が使用される場合にのみであるがアルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノールおよびtert-ブタノールを使用することが好ましい。

10

【0491】

式 (V) の化合物が使用される時には、適する塩基は無機塩基、特にアルカリ金属またはアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸カルシウム、並びに有機塩基、例えば、ピリジンまたはトリエチルアミンであり、そして式 (V I) の化合物が使用される時には、アルカリ金属およびアルカリ土類金属酸化物、水酸化物および炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウムであり、それらは相間移動触媒、例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、アドゲン464 (=メチルトリアルキル (C₈-C₁₀) アンモニウムクロリド) またはTDA1 (=トリス-(メトキシエトキシエチル)-アミン)、アルカリ金属、例えばナトリウムおよびカリウム、並びにアルカリ金属アミド類および水素化物、およびアルカリ土類金属アミド類および水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウムおよび水素化カルシウム、並びにアルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシドおよびカリウムtert-ブトキシド、の存在下で使用することもできる。

20

【0492】

本発明に従う方法 (D- α) および (D- β) を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は-20℃~250℃の間の、好ましくは0℃~150℃の間の温度で実施される。

30

【0493】

本発明に従う方法 (D- α) および (D- β) は一般的には大気圧で実施される。

【0494】

本発明に従う方法 (D- α) および (D- β) を実施する時には、式 (V) および (V I I) または (V I) および (V I I) の反応成分並びに適宜使用される脱プロトン化塩基は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰 (3モルまで) の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0495】

本発明に従う方法 (E) は、式 (V I I I) のカルボニル化合物または式 (V I I I a) のそれらのエノールエーテル類を希釈剤の存在下でそして、適宜、酸受容体の存在下で式 (V) のケテン酸ハライド類と反応させることにより特徴づけられる。

40

【0496】

本発明に従う方法 (E) 用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドンを使用することが好ましい。

【0497】

本発明に従う変法E) を実施するために適する酸受容体は全ての一般的な酸受容体であ

50

る。

【0498】

第三級アミン類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（DABCO）、ジアザビシクロウンデカン（DBU）、ジアザビシクロノネン（DBN）、ヒューニッヒ（Huenig）塩基およびN，N-ジメチルアニリンを使用することが好ましい。

【0499】

本発明に従う変法E）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。有利には、反応は0℃～250℃の間の、好ましくは50℃～220℃の間の温度で実施される。

10

【0500】

本発明に従う方法（E）は有利には大気圧で実施される。

【0501】

本発明に従う方法（E）を実施する時には、A、D、X、YおよびZが各々以上で定義されている通りでありそしてHalがハロゲンを表す式（VII）および（V）の反応成分、並びに、適宜、酸受容体は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（5モルまで）の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0502】

本発明に従う方法（F）は、式（IX）のチオアミド類を希釈剤の存在下でそして、適宜、酸受容体の存在下で式（V）のケテン酸ハライド類と反応させることにより特徴づけられる。

20

【0503】

本発明に従う変法F）用に適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドンを使用することが好ましい。

【0504】

本発明に従う方法（F）を実施するために適する酸受容体は全ての一般的な酸受容体である。

30

【0505】

第三級アミン類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（DABCO）、ジアザビシクロウンデカン（DBU）、ジアザビシクロノネン（DBN）、ヒューニッヒ塩基およびN，N-ジメチルアニリンを使用することが好ましい。

【0506】

本発明に従う方法（F）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。有利には、反応は0℃～250℃の間の、好ましくは20℃～220℃の間の温度で実施される。

【0507】

本発明に従う方法（F）は有利には大気圧で実施される。

40

【0508】

本発明に従う方法（F）を実施する時には、A、X、YおよびZが各々上記で定義されている通りでありそしてHalがハロゲンを表す式（IX）および（V）の反応成分、並びに、適宜、酸受容体は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（5モルまで）の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0509】

方法（G）は、A、B、Q¹、Q²、Y、ZおよびR⁸が各々上記で定義されている通りである式（X）の化合物を塩基の存在下で分子間縮合にかけることにより特徴づけられる。

【0510】

50

本発明に従う方法（G）用に適する希釈剤は反応相手に対して不活性である全ての有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドン、を使用することが好ましい。さらに、アルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール、tert-ブタノールを使用することも可能である。

【0511】

本発明に従う方法（G）を実施するために適する塩基（脱プロトン化剤）は全ての一般的なプロトン受容体である。アルカリ金属およびアルカリ土類金属酸化物、水酸化物および炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウムを使用することが好ましく、それらは相間移動触媒、例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、アドゲン464（＝メチルトリアルキル（C₈－C₁₀）アンモニウムクロリド）またはTDA1（＝トリス（メトキシエトキシエチル）－アミン）の存在下で使用することもできる。アルカリ金属、例えばナトリウムおよびカリウムを使用することもできる。さらに、アルカリ金属およびアルカリ土類金属アミド類および水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウムおよび水素化カルシウム、並びにアルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムtert-ブトキシドを使用することもできる。

【0512】

本発明に従う方法（G）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は－75℃～250℃の間の、好ましくは－50℃～150℃の間の温度で実施される。

【0513】

本発明に従う方法（G）は一般的には大気圧で実施される。

【0514】

本発明に従う方法（G）を実施する時には、式（X）の反応成分および脱プロトン化塩基は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（3モルまで）の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0515】

方法（H）は、A、B、Q³、Q⁴、Q⁵、Q⁶、X、Y、ZおよびR⁸が各々上記で定義されている通りである式（XI）の化合物を塩基の存在下で分子間縮合にかけることにより特徴づけられる。

【0516】

本発明に従う方法（H）用に適する希釈剤は反応相手に対して不活性である全ての有機溶媒である。炭化水素類、例えばトルエンおよびキシレン、並びにエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、並びに極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミドおよびN-メチルピロリドン、を使用することが好ましい。アルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノールおよびtert-ブタノールを使用することもできる。

【0517】

本発明に従う方法（H）を実施するために適する塩基（脱プロトン化剤）は全ての一般的なプロトン受容体である。アルカリ金属およびアルカリ土類金属酸化物、水酸化物および炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウムを使用することが好ましく、それらは相間移動触媒、例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、アドゲン464（＝メチルトリアルキル（C₈－C₁₀）アンモニ

ウムクロリド) またはTDA1 (=トリスー(メトキシエトキシエチル)ーアミン) の存在下で使用することもできる。アルカリ金属、例えばナトリウムおよびカリウム、を使用することもできる。さらに、アルカリ金属およびアルカリ土類金属アミド類および水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウムおよび水素化カルシウム、並びにアルカリ金属アルコキシド類、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドおよびカリウムtert-ブトキシド、を使用することもできる。

【0518】

本発明に従う方法(H)を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は0℃~250℃の間の、好ましくは50℃~150℃の間の温度で実施される。

10

【0519】

本発明に従う方法(H)は一般的には大気圧で実施される。

【0520】

本発明に従う方法(H)を実施する時には、式(XII)の反応成分および脱プロトン化塩基は一般的にはほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰(3モルまで)の一方の成分または他方を使用することも可能である。

【0521】

本発明に従う方法(I)を実施するためには、パラジウム(0)錯体が触媒として適する。例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムが使用される。パラジウム(II)化合物、例えばビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリドも適する。

20

【0522】

本発明に従う方法(I)を実施するために適する酸受容体は無機または有機塩基である。これらは好ましくはアルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、酢酸塩、炭酸塩または炭酸水素塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウムまたは水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムまたは酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸アンモニウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸水素カリウム、アルカリ金属弗化物、例えば、弗化カリウム、弗化セシウム、並びに第三級アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)またはジアザビシクロウンデカン(DBU)を包含する。

30

【0523】

本発明に従う方法(I)を実施するために適する希釈剤は、水、有機溶媒およびそれらの混合物である。例は、脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素類、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；ハロゲン化された炭化水素類、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンまたはテトラクロロエチレン；エーテル類、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサラン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルまたはアニソール；アルコール類、例えばメタノール、エタノール、n-もしくはi-プロパノール、n-、イソ-、sec-もしくはtert-ブタノール、エタンジオール、プロパン-1,2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル；水を包含する。

40

【0524】

本発明に従う方法(I)における反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は0℃~+140℃の間の、好ましくは50℃~+100℃の間の温度

50

で実施される。

【0525】

本発明に従う方法（I）を実施する時には、式（X I I）のボロン酸および式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物は1：1～3：1の、好ましくは1：1～2：1の、モル比で使用される。一般的には、1モルの式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物化合物当たり0.005～0.5モルの、好ましくは0.01モル～0.1モルの触媒が使用される。塩基は普通は過剰量で使用される。

【0526】

方法（J-α）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を各場合とも、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式（X I I I）のカルボニルハライド類と反応させることにより特徴づけられる。

10

【0527】

本発明に従う方法（J-α）用に適する希釈剤はアシルハライド類に対して不活性である全ての溶媒である。炭化水素類、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレンおよびテトラリン、並びにハロゲンされた炭化水素類、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼンおよびo-ジクロロベンゼン、並びにケトン類、例えばアセトンおよびメチルイソプロピルケトン、並びにエーテル類、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランおよびジオキサン、並びにカルボン酸エステル類、例えば酢酸エチル、並びに強極性溶媒、例えばジメチルスルホキシドおよびスルホランを使用することが好ましい。アシルハライドの加水分解安定性が許容する限り、反応を水の存在下で実施することもできる。

20

【0528】

本発明に従う方法（J-α）を実施するために適する酸結合剤は全ての一般的な酸受容体である。第三級アミン類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（D A B C O）、ジアザビシクロウンデカン（D B U）、ジアザビシクロノネン（D B N）、ヒューニッヒ塩基およびN，N-ジメチルーアニリン、並びにアルカリ土類金属酸化物、例えば酸化マグネシウムおよび酸化カルシウム、並びにアルカリ金属およびアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムを使用することが好ましい。

30

【0529】

本発明に従う方法（J-α）における反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は-20℃～+150℃の間の、好ましくは0℃～100℃の間の温度で実施される。

【0530】

本発明に従う方法（J-α）を実施する時には、式（I-1-a）～（I-8-a）の出発物質および式（X I I I）のカルボニルハライドは一般的には各場合ともほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（5モルまで）のカルボニルハライドを使用することも可能である。処理は一般的な方法により実施される。

40

【0531】

方法（J-β）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式（X I V）の無水カルボン酸類と反応させることにより特徴づけられる。

【0532】

本発明に従う方法（J-β）用に好ましい希釈剤はアシルハライド類が使用される時にも好ましい希釈剤である。そうでない場合には、過剰量で使用される無水カルボン酸を同時に希釈剤として作用させることも可能である。

【0533】

方法（J-β）においては、適宜、加えられる酸結合剤は好ましくはアシルハライド類が使用される時にも好ましい酸結合剤である。

50

【0534】

本発明に従う方法（J-β）においては、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。一般的には、反応は -20°C ～ $+150^{\circ}\text{C}$ の間の、好ましくは 0°C ～ 100°C の間の、温度で実施される。

【0535】

本発明に従う方法（J-β）を実施する時には、式（I-1-a）～（I-8-a）の出発物質および式（XIV）の無水カルボン酸は一般的に各々ほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（5モルまで）の無水カルボン酸を使用することも可能である。処理は一般的な方法により実施される。

【0536】

一般的には、採用される工程は希釈剤および過剰の無水カルボン酸並びに生成したカルボン酸を蒸留によりまたは有機溶媒もしくは水で洗浄することにより除去することである。

【0537】

方法（K）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を各場合とも、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式（XV）のクロロ蟻酸エステル類またはクロロ蟻酸チオールエステル類と反応させることにより特徴づけられる。

【0538】

本発明に従う方法（K）に従う反応に適する酸結合は全ての一般的な酸受容体である。第三級アミン類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DABCO、DBU、DBN、ヒューニツヒ塩基およびN，N-ジメチルーアニリン、並びにアルカリ土類金属酸化物、例えば酸化マグネシウムおよび酸化カルシウム、並びにアルカリ金属炭酸塩およびアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウム、を使用することが好ましい。

【0539】

本発明に従う方法（K）用に適する希釈剤はクロロ蟻酸エステル類またはクロロ蟻酸チオールエステル類に対して不活性である全ての溶媒である。炭化水素類、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレンおよびテトラリン、並びにハロゲンされた炭化水素類、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼンおよびo-ジクロロベンゼン、並びにケトン類、例えばアセトンおよびメチルイソプロピルケトン、並びにエーテル類、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランおよびジオキサン、並びにカルボン酸エステル類、例えば酢酸エチル、並びに強極性溶媒、例えばジメチルスルホキシドおよびスルホランを使用することが好ましい。

【0540】

本発明に従う方法（K）を実施する時には、反応温度は相対的に広い範囲内で変えることができる。反応が希釈剤および結合剤の存在下で実施される時には、反応温度は一般的に -20°C ～ $+100^{\circ}\text{C}$ の間、好ましくは 0°C ～ 50°C の間である。

【0541】

本発明に従う方法（K）は一般的には大気圧で実施される。

【0542】

本発明に従う方法（K）を実施する時には、式（I-1-a）～（I-8-a）の出発物質および適当な式（XV）のクロロ蟻酸エステルまたはクロロ蟻酸チオールエステルは一般的には各場合ともほぼ等モル量で使用される。しかしながら、相対的に大過剰（2モルまで）の一方の成分または他方を使用することも可能である。処理は一般的な方法により実施される。一般的には、沈澱した塩を除去しそして残った反応混合物を希釈剤のストリッピングにより濃縮する。

【0543】

本発明に従う方法（L）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を各場合とも希釈剤の存在下でそして、適宜、酸結合剤の存在下で式（XVI）の化合物と反応させる

10

20

30

40

50

ことにより特徴づけられる。

【0544】

製造方法（L）においては、1モルの式（I-1-a）～（I-8-a）の出発物質当たり約1モルの式（XVI）のクロロモノチオ蟻酸エステルまたはクロロジチオ蟻酸エステルを、0～120℃、好ましくは20～60℃で反応させる。

【0545】

適宜加えられる適する希釈剤は全ての不活性な極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類、並びにハロゲンアルカン類でもある。

【0546】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを使用することが好ましい。

10

【0547】

好ましい態様において、化合物（I-1-a）～（I-8-a）のエノレート塩が強脱プロトン化剤、例えば、水素化ナトリウムまたはカリウムtert-ブトキシド、の添加により製造される場合には、別の酸結合剤を加える必要はない。

【0548】

酸結合剤が使用される場合には、これらは一般的な無機または有機塩基、例えば水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンである。

【0549】

反応は大気圧または高められた圧力で実施することができ、そして好ましくは大気圧で実施される。処理は一般的な方法により実施される。

20

【0550】

本発明に従う方法（M）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を各場合とも、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式（XVII）のスルホニルクロリド類と反応させることにより特徴づけられる。

【0551】

製造方法（M）においては、1モルの式（I-1-a）～（I-8-a）の出発物質当たり約1モルの式（XVII）のスルホニルクロリドを、-20～150℃、好ましくは20～70℃で反応させる。

【0552】

30

適宜加えられる適する希釈剤は全ての不活性な極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類またはハロゲン化された炭化水素類、例えば塩化メチレン、である。

【0553】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0554】

好ましい態様において、化合物（I-1-a）～（I-8-a）のエノレート塩が強脱プロトン化剤（例えば、水素化ナトリウムまたはカリウムtert-ブトキシド）の添加により製造される場合には、別の酸結合剤を加える必要はない。

40

【0555】

酸結合剤が使用される場合には、これらは一般的な無機または有機塩基、例えば水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンである。

【0556】

反応は大気圧または高められた圧力で実施することができ、そして好ましくは大気圧で実施される。処理は一般的な方法により実施される。

【0557】

本発明に従う方法（N）は、式（I-1-a）～（I-8-a）の化合物を各場合とも、適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式（XVIII）の燐化合物と反応させることにより特徴づけられる。

50

【0558】

製造方法(N)においては、1モルの式(I-1-a)～(I-8-a)の出発物質当たり1～2、好ましくは1～1.3、モルの式(XVII)の燐化合物を、-40～150℃の間の、好ましくは-10～110℃の間の温度で反応させて、式(I-1-e)～(I-8-e)の化合物を与える。

【0559】

適宜加えられる適する溶媒は全ての不活性な極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、アルコール類、スルフィド類、スルホン類、スルホキシド類、などである。

【0560】

アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0561】

適宜加えられる適する酸結合剤は一般的な無機または有機塩基、例えば水酸化物、炭酸塩またはアミン類である。例は、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンを包含する。

【0562】

反応は大気圧または高められた圧力で実施することができ、そして好ましくは大気圧で実施される。処理は一般的な方法により実施される。生じた最終生成物は好ましくは結晶化、クロマトグラフィー精製によりまたはいわゆる「初期蒸留」、すなわち減圧下での揮発性成分の除去、により精製される。

【0563】

方法(O)は、式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を、適宜希釈剤の存在下で、式(XIX)の金属水酸化物もしくは金属アルコキシド類または式(XX)のアミン類と反応させることにより特徴づけられる。

【0564】

本発明に従う方法(O)用に好ましい希釈剤は、エーテル類、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、またはアルコール類、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、並びに水である。

【0565】

本発明に従う方法(O)は一般的には大気圧で実施される。

【0566】

反応温度は一般的に-20℃～100℃の間、好ましくは0℃～50℃の間である。

【0567】

本発明に従う方法(P)は、式(I-1-a)～(I-8-a)の化合物を各場合とも、(P-α)適宜希釈剤の存在下でそして適宜触媒の存在下で、式(XXI)の化合物と、または(P-β)適宜希釈剤の存在下でそして適宜酸結合剤の存在下で、式(XXII)の化合物と反応させることにより特徴づけられる。

【0568】

製造方法(P-α)においては、1モルの式(I-1-a)～(I-8-a)の出発物質当たり約1モルの式(XXI)のイソシアナートを、0～100℃の間の、好ましくは20～50℃の間の温度で反応させる。

【0569】

適宜加えられる適する希釈剤は全ての不活性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類である。

【0570】

適宜、反応を促進するために触媒を加えてもよい。非常に有利には、使用される触媒は有機錫化合物、例えば、ジラウリン酸ジブチル錫である。反応は好ましくは大気圧で実施される。

【0571】

製造方法 (P-β) においては、1モルの式 (I-1-a) ~ (I-8-a) の出発物質当たり約1モルの式 (XXII) のカルバモイルクロリドを、-20~150℃、好ましくは0~70℃で反応させる。

【0572】

適宜加えられる適する希釈剤は全ての不活性な極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類またはハロゲン化された炭化水素類である。

【0573】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドまたは塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0574】

好ましい態様において、化合物 (I-1-a) ~ (I-8-a) のエノレート塩が強脱プロトン化剤 (例えば、水素化ナトリウムまたはカリウム *tert*-ブトキシド) の添加により製造される場合には、別の酸結合剤を加える必要はない。

【0575】

酸結合剤が使用される場合には、これらは一般的な無機または有機塩基、例えば水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンまたはピリジンである。

【0576】

反応は大気圧または高められた圧力で実施することができ、そして好ましくは大気圧で実施される。処理は一般的な方法により実施される。

【0577】

活性化合物は農業において、林業において、貯蔵製品および材料の保護において、並びに衛生分野において遭遇する動物性有害生物、特に昆虫、殺ダニ剤および線虫を防除するために適し、そして良好な作物耐性および温血動物に対する好ましい毒性を有する。それらは好ましくは作物保護剤として使用される。それらは通常の敏感性および耐性種に対して並びに全てのまたは一部の成長段階に対して活性である。上記の有害生物は下記のものを包含する：

等脚目 (Isopoda) から、例えば、オニスカス・アセルス (*Oniscus asellus*)、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) およびポルセリオ・スカバー (*Porcellio scaber*)、

倍脚綱 (Diplopoda) から、例えば、ブラニウルス・グットラタス (*Blaniulus guttulatus*)、

チロポダ目 (Chilopoda) から、例えば、ゲオフィルス・カルポファグス (*Geophilus carpophagus*) およびスカチゲラ種 (*Scutigera spec.*)、

シムフィラ目 (Symphylla) から、例えば、スカチゲレラ・イマキユラタ (*Scutigerebella immaculata*)、

シミ目 (Thysanura) から、例えば、レプシマ・サツカリナ (*Lepisma saccharina*)、

トビムシ目 (Collembola) から、例えば、オニチウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)、

直翅目 (Orthoptera) から、例えば、アチータ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ケラ種 (*Gryllotalpa spp.*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria migratorioides*)、メラノプルス種 (*Melanoplus spp.*) およびシストセルカ種 (*Schistocerca spp.*)、

ゴキブリ目 (Blattaria) から、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blattella orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、ロイコファエ・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、チャパネ・ゴキブリ (*Blattella germanica*)、ハサミムシ目 (Dermaptera) から、例えば、ホルフィキュラ・アウリクラリア (*Forficula*

10

20

30

40

50

auricularia)、
 シロアリ目 (Isoptera) から、例えば、レチキュリテルメス種 (Reticulitermes spp.)、
 シラミ目 (Phthiraptera) から、例えば、ヒトジラミ (Pediculus humanus corporis)、ケモノジラミ種 (Haematopinus spp.)、ケモノホソジラミ種 (Linognathus spp.)、ケモノハジラミ種 (Trichodectes spp.) およびダマリネア種 (Damalinaea spp.)、
 アザミウマ目 (Thysanoptera) から、例えば、クリバネアザミウマ (Hercinothrips femoralis)、ネギアザミウマ (Thrips tabaci)、スリップス・パルミ (Thrips palmi) およびフランクリエラ・アクシデンタリス (Frankliniella accidentalis)、
 半翅目 (Heteroptera) から、例えば、チャイロカメムシ種 (Eurygaster spp.)、ジスデルクス・インテルメジウス (Dysdercus intermedius)、ピエスマ・クワドラタ (Piesma quadrata)、ナンキンムシ (Cimex lectularius)、ロドニウス・プロリクス (Rhodnius prolixus) およびトリアトマ種 (Triatoma spp.)、
 同翅目 (Homoptera) から、例えば、アレウロデス・ブラシカエ (Aleurodes brassicae)、ワタコナジラミ (Bemisia tabaci)、トリアレウロデス・バポラリオルム (Trialeurodes vaporariorum)、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、ダイコンアブラムシ (Brevicoryne brassicae)、クリプトミズス・リビス (Cryptomyzus ribis)、アフィス・ファバエ (Aphis fabae)、アフィス・ポミ (Aphis pomi)、リンゴワタムシ (Eriosoma lanigerum)、モモコフキアブラムシ (Hyalopterus arundinis)、フィロキセラ・バスタトリックス (Phylloxera vastatrix)、ペンフィグス種 (Pemphigus spp.)、ムギヒゲナガアブラムシ (Macrosiphum avenae)、コブアブラムシ種 (Myzus spp.)、ホツブイボアブラムシ (Phorodon humuli)、ムギクビレアブラムシ (Rhopalosiphum padi)、ヒメヨコバイ種 (Empoasca spp.)、ユースセリス・ビロバツス (Euscelis bilobatus)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、ミズキカタカイガラムシ (Lecanium corni)、オリーブカタカイガラムシ (Saissetia oleae)、ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、アカマルカイガラムシ (Aonidiella aurantii)、シロマルカイガラムシ (Aspidiotus hederae)、シユードコツカス種 (Pseudococcus spp.) およびキジラミ種 (Psylla spp.)、
 鱗翅目 (Lepidoptera) から、例えば、ワタアカミムシ (Pectinophora gossypiella)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatomia brumata)、リソコレチス・ブランカルデラ (Lithocolletis blancardella)、ヒポノミユウタ・パデラ (Hyponomeuta padella)、コナガ (Plutella xylostella)、ウメケムシ (Malacosoma neustria)、クワノキンムケシ (Euproctis chrysorrhoea)、マイマイガ種 (Lymantria spp.)、ブツカラトリックス・スルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、ミカンハモグリガ (Phyllocnistis citrella)、ヤガ種 (Agrotis spp.)、ユークソア種 (Euxoa spp.)、フェルチア種 (Feltia spp.)、エアリアス・インストラナ (Earias insulana)、ヘリオチス種 (Heliot

10

20

30

40

50

his spp.)、ヨトウムシ (*Mamestra brassicae*)、パノリス・フラメア (*Panolis flammea*)、スポドプテラ種 (*Spodoptera* spp.)、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、アオムシ種 (*Pieris* spp.)、ニカメイチュウ種 (*Chilo* spp.)、アワノメイガ (*Pyrausta nubilalis*)、スジコナマダラメイガ (*Ephestia kuehniella*)、ハチミツガ (*Galleria mellonella*)、ティネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、ティネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、ホフマノフィラ・シユードスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、カコエシア・ポダナ (*Caecicia podana*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、クリストネウラ・フミフエラナ (*Choristoneura fumiferana*)、クリシア・アンビグエラ (*Clysia ambiguella*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、トルトリクス・ビリダナ (*Tortrix viridana*) およびクナファロセルス種 (*Cnaphalocerus* spp.)

10

。鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、コナナガシンクイムシ (*Rhizopertha dominica*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、ヒロトルベス・バジユルス (*Hylotrupes bajulus*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、フエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、ジアブロチカ種 (*Diabrotica* spp.)、シリオデス・クリソセフアラ (*Psylliodes chrysocephala*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna varivestis*)、アトマリア種 (*Atomaria* spp.)、ノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、ハナゾウムシ種 (*Anthrenus* spp.)、コクゾウムシ種 (*Sitophilus* spp.)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、バシヨウゾウムシ (*Cosmopolites sordidus*)、シユートリンクス・アシミリス (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ヒペラ・ポストチカ (*Hypera postica*)、カツオブシムシ種 (*Dermestes* spp.)、トロゴデルマ種 (*Trogoderma* spp.)、アントレヌス種 (*Anthrenus* spp.)、アタゲヌス種 (*Attagenus* spp.)、ヒラタキクイムシ種 (*Lyctus* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、ヒヨウホンムシ種 (*Ptinus* spp.)、ニプツス・ホロレウカス (*Niptus hololeucus*)、セマルヒヨウホンムシ (*Gibbium psyllioides*)、コクヌストモドキ種 (*Tribolium* spp.)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コメツキムシ種 (*Agriotes* spp.)、コノデルス種 (*Conoderus* spp.)、メロロンサ・メロロンサ (*Melolontha melolontha*)、アムファイマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*) およびコステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、

20

30

40

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えば、マツハバチ種 (*Diprion* spp.)、ホプロカムパ種 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス種 (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*) およびスズメバチ種 (*Vespa* spp.)、

双翅目 (*Diptera*) から、例えばヤブカ種 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ (*Anopheles* spp.)、イエカ (*Culex* spp.)、キイロシヨウジ

50

ヨウバエ (*Drosophila melanogaster*)、イエバエ種 (*Musca* spp.)、ヒメイエバエ種 (*Fannia* spp.)、クロバエ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、キンバエ種 (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ種 (*Chrysomyia* spp.)、クテレブラ種 (*Cuterebra* spp.)、ウマバエ種 (*Gastrophilus* spp.)、ヒツポボスカ種 (*Hyppobosca* spp.)、サシバエ種 (*Stomoxys* spp.)、ヒツジバエ種 (*Oestrus* spp.)、ウシバエ種 (*Hypoderma* spp.)、アブ種 (*Tabanus* spp.)、タニア種 (*Tannia* spp.)、ケバエ (*Bibio hortulanus*)、オスシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、クロキンバエ種 (*Phorbia* spp.)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、セラチチス・キャピタータ (*Ceratitis capitata*)、ミバエオレアエ (*Dacus oleae*)、ガガンボ・パルドーサ (*Tipula paludosa*)、ヒレミーア種 (*Hydemyia* spp.) およびリリオミザ種 (*Liriomyza* spp.)。ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) およびナガノミ種 (*Ceratophyllus* spp.)、

10

蜘蛛形網 (*Arachnida*) から、例えばスコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ラトロデクタス・マクタンズ (*Latrodectus mactans*)、アシプトコナダニ (*Acarus siro*)、ヒメダニ種 (*Argas* spp.)、カズキダニ種 (*Ornithodoros* spp.)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、エリオフィエス・リビス (*Eriophyes ribis*)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptura oleivora*)、オウシマダニ種 (*Boophilus* spp.)、コイタマダニ種 (*Rhipicephalus* spp.)、アンブリオマ種 (*Amblyomma* spp.)、イボマダニ種 (*Hyalomma* spp.)、マダニ種 (*Ixodes* spp.)、キユウセンヒゼンダニ種 (*Psoroptes* spp.)、シヨクヒヒゼンダニ種 (*Chorioptes* spp.)、ヒゼンダニ種 (*Sarcoptes* spp.)、ホコリダニ種 (*Tarsonemus* spp.)、クロバハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ミカンリンゴハダニ種 (*Panonychus* spp.)、ナミハダニ種 (*Tetranychus* spp.)、ヘミタルソネムス種 (*Hemitarsonemus* spp.)、ブレビパルプス種 (*Brevipalpus* spp.)。

20

30

【0578】

植物寄生性線虫には次のものが包含される：例えば、ネグサレセンチュウ種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、シストセンチュウ種 (*Heterodera* spp.)、グロボデラ種 (*Globodera* spp.)、ネコブセンチュウ種 (*Meloidogyne* spp.)、アフエレンコシデス種 (*Aphelenchoides* spp.)、ロンギドルス種 (*Longidorus* spp.)、ジフイネマ種 (*Xiphinema* spp.)、トリコドルス種 (*Trichodorus* spp.)、ブルサフェレンチュス種 (*Bursaphelenchus* spp.)。

40

【0579】

本発明に従う活性化化合物は葉および土壌適用後に高い殺昆虫および殺ダニ活性を有する。

【0580】

それらは植物に被害を与える昆虫を抑制するために、例えば、マスタード・ビートル (*Phaedon cochlaeriae*) の幼虫に対して、グリーン・ライス・リーフホッパー (*Nephotettix cincticeps*) の幼虫に対しておよびグリ

50

ーン・ピーチ・アフィド (*Myzus persicae*) の幼虫に対して、特に成功裡に使用することができる。

【0581】

活性化化合物は通常の調合物、例えば液剤、乳剤、水和剤、懸濁剤、粉末、散剤、ペースト剤、可溶性粉末、粒剤、濃厚懸濁乳剤、活性化化合物を含浸させた天然および合成材料、並びに重合体物質中の極小カプセルに転化することができる。

【0582】

これらの調合物は既知の方法で、例えば活性化化合物を伸展剤、すなわち液体溶媒および／または固体の担体と、場合により界面活性剤、すなわち乳化剤および／または分散剤および／または発泡剤を用いて、混合することにより製造される。

10

【0583】

使用される伸展剤が水である場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。本質的には、適する液体溶媒は芳香族、例えばキシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン類、塩素化された芳香族もしくは塩素化された脂肪族炭化水素類、例えばクロロベンゼン類、クロロエチレン類もしくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素類、例えばシクロヘキサン、またはパラフィン類、例えば石油画分、鉱油および植物油、アルコール類、例えばブタノールもしくはグリコール並びにそれらのエーテル類およびエステル類、ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド並びに水である。

20

【0584】

固体の担体としては、例えばアンモニウム塩および粉碎した天然鉱物、例えばカオリン、クレイ、タルク、チヨーク、石英、アタパルジヤイト、モンモリロナイトまたは珪藻土、並びに粉碎した合成鉱物、例えば高度に分散したケイ酸、アルミナおよびシリケート類が適しており；粒剤用の固体担体としては、例えば粉碎し且つ分別した天然石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石および白雲石、並びに無機および有機のひきわりの合成顆粒、および有機物質例えばおがくず、やしがら、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎の顆粒が適しており；乳化剤および／または発泡剤としては、例えば非イオン性およびアニオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類および蛋白質加水分解生成物が適しており；分散剤としては、例えばリグニンスルファイト廃液およびメチルセルロースが適する。

30

【0585】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロース、並びに粉状、粒状またはラテックス状の天然および合成重合体、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテート、並びに天然燐脂質、例えばセファリン類およびレシチン類、並びに合成燐脂質を調合物中で用いることができる。他の添加剤は鉱油および植物油でありうる。

【0586】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー、並びに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料、並びに微量の栄養剤、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩を用いることができる。

40

【0587】

調合物は一般的には0.1～95重量%の間、好ましくは0.5～90重量%の間、の活性化化合物を含有する。

【0588】

本発明に従う活性化化合物は、その商業的に一般的な調合物の状態およびこれらの調合物から製造された使用形態で、他の活性化化合物、例えば殺昆虫剤、誘引剤、消毒剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌・殺カビ剤、成長調節剤または除草剤との混合物として存

50

在することができる。殺昆虫剤は、例えば、燐酸エステル類、カルバミン酸エステル類、カルボン酸エステル類、塩素化された炭化水素類、フェニルウレア類および微生物により製造される化合物などを包含する。

【0589】

混合物中の特に好ましい共成分の例は以下の化合物である：

殺菌・殺カビ剤：

アルジモルフ (aldimorph)、アンプロピルフォス (ampropylfos)、
アンプロピルフォス・カリウム (ampropylfos potassium)、ア
ンドプリム (andoprim)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール
(azaconazole)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、
ベナラキシル (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、
ビナパクリル (binapacryl)、ベンザマクリル-イソブチル (benzamacryl-isobutyl)、
ビアラフォス (bialaphos)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル、ビテルタノール (biter
tanol)、ブラスチシジン-S (blasticidin-S)、ブロムコナゾール
(bromiconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオバート (buthiobate)、
多硫化カルシウム、カプシマイシン (capsimycin)、カプタフォル (capt
afol)、カプタン (captan)、カルベンダジム (carbendazim)、
カルボキシ (carboxin)、カルヴォン (carvon)、キノメチオネート (quinomethionate)、
クロベンチアゾン (chlobenthiazole)、クロルファナゾール (chlorfenazole)、クロロネブ (chloro
neb)、クロロピクリン (chloropicrin)、クロロタロニル (chlor
othalonil)、クロゾリネート (chlozolate)、クロジラコン (clozylacon)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cymox
anil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyp
rodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、
デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジク
ロブトラゾール (diclobutrazole)、ジクロフルアニド (diclofl
uanid)、ジクロメジン (diclomezine)、ジクロラン (dichlor
an)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジフェノコナゾール (d
ifeniconazole)、ジメシリモル (dimethirimol)、ジメトモ
ルフ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジ
ニコナゾール-M (diniconazole-M)、ジノキャップ (dinocap)、
ジフェニルアミン、ジピリチオン (dipyrrithione)、ジタリンフォス (d
italimfos)、ジチアノン (dithianon)、ドデモルフ (dodemo
rph)、ドジン (dodine)、ドラゾキシロン (drazoxolon)、
エジフェンフォス (edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxicon
azole)、エタコナゾール (etaconazole)、エシリモル (ethirim
ol)、エトリジアゾール (etridiazole)、
ファミキサドン (famoxadon)、フェナリモル (fenarimol)、フェン
ブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フ
ェニトロパン (fenitropan)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、
フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenprop
imorph)、フェンチンアセテート (fentin acetate)、フェンチン
ヒドロキシド (fentin hydroxide)、フェルバム (ferbam)、フ
ェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フメトバー
(fumetover)、フルロミド (fluromide)、フルキンコナゾール (f
luquinconazole)、フルルプリミドール (flurprimidol)、
フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulpham

10

20

30

40

50

ide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアフォル (flutriafol)、フォルペット (folpet)、
 フォセチルーアルミニウム (fosetyl-aluminum)、フォセチルーナトリウム (fosetyl-sodium)、フタリド (fthalide)、フベリダゾール (fuberidazole)、フララキシル (furalaxyl)、フラメトピル (furametpyr)、フルカルボニル (furcarbonil)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾールーシス (furconazole-cis)、フルメシクロックス (furmecycloxx)、
 グアザチン (guazatine)、
 ヘキサクロベンゼン、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾール (hymexazole)、
 イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン (iminocladine)、イミノクタジン・アルベシラート (iminocladine albesilate)、イミノクタジン・トリアセテート (iminocladine triacetate)、ヨードカルブ (iodocarb)、イブコナゾール (ibconazole)、イプロベンフォス (IBP) (iprobendfos (IBP))、イプロジオン (iprodione)、イルママイシン (irumamycin)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イソバレジオン (isovalledione)、
 カスガマイシン (kasugamycin)、レスキシムーメチル (kresoxim-methyl)、銅調合物、例えば水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシシンー銅およびボルドー (Bordeaux) 混合物、
 マンコッパー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マネブ (maneb)、メフェリンゾン (mefenimzone)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepconil)、メタラキシル (metaxyl)、メトコナゾール (metconazole)、メタスルフォカルブ (methasulfocarb)、メスフロキサム (methfuroxam)、メチラム (metiram)、メトメクラム (metomeclam)、メススルフォバックス (metasulfobax)、ミルジオマイシン (mildiomycin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミクロゾリン (myclozolin)、
 ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロタルーイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモル (nuarimol)、
 オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキサモカルブ (oxamocarb)、オキシソリニック・アシド (oxolinic acid)、オキシカルボキシム (oxycarboxim)、オキシフェンチイン (oxyfenthin)、
 パクロブトラゾール (paclobutrazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、フォスジフェン (phosdiphen)、ピマリシン (pimaricin)、ピペラリン (piperalin)、ポリオキシシン (polyoxin)、ポリ
 オキシリム (polyoxorim)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロパノシンーナトリウム (propanosine-sodium)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、ピラゾフォス (pyrazophos)、ピリフェノックス (pyrifenoxx)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、ピロキシフル (pyroxyfur)、
 キンコナゾール (quinconazole)、キントゼン (PCNB) (quintozene (PCNB))、
 硫黄および硫黄調合物、

10

20

30

40

50

テブコナゾール (tebuconazole)、テクロフタラム (tecloftalam)、テクナゼン (tecnazene)、テトシクラシス (tetcyclasis)、
 テトラコナゾール (tetraconazole)、
 チアベンダゾール (thiabendazole)、チシオフエン (thicyofen)、
 チフルザミド (thifluzamide)、チオファネートーメチル (thiophanate-methyl)、
 チラム (thiram)、トキシミド (tixymid)、
 トルククロフォスーメチル (tolclofos-methyl)、トリルフルアニド (tolylfluaniid)、
 トリアジメフォン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、
 トリアズブチル (triazbutyl)、
 トリアゾキシド (triazoxide)、トリクラミド (trichlamide)、
 トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、
 トリフルミゾール (triflumizole)、トリフォリン (triforine)、
 トリチコナゾール (triticonazole)、
 ユニコナゾール (uniconazole)、
 バリダマイシンA (validamycin A)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、
 ビニコナゾール (viniconazole)、
 ザリルアミド (zarilamide)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、並びに
 ダガー (Dagger) G
 OK-8705、
 OK-8801、
 α-(1, 1-ジメチルエチル)-β-(2-フェノキシエチル)-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α-(2, 4-ジクロロフェニル)-β-フルオロ-β-プロピル-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α-(2, 4-ジクロロフェニル)-β-メトキシ-α-メチル-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-エタノール、
 α-(5-メチル-1, 3-ジオキササン-5-イル)-β-[[4-トリフルオロメチル)-
 フェニル]-メチレン]-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-エタノール、
 (5RS, 6RS)-6-ヒドロキシ-2, 2, 7, 7-テトラメチル-5-(1H-1, 2, 4-
 トリアゾール-1-イル)-3-オクタノン、
 (E)-α-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-フェノキシ-フェニルアセトアミド、
 {2-メチル-1-[[[1-(4-メチルフェニル)-エチル]-アミノ]-カルボニル]-
 プロピル}カルバミン酸1-イソプロピル、
 1-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-
 エタノン-O-(フェニルメチル)-オキシム、
 1-(2-メチル-1-ナフタレニル)-1H-ピロール-2, 5-ジオン、
 1-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-(2-プロペニル)-2, 5-ピロリジンジオン、
 1-[(ジヨードメチル)-スルホニル]-4-メチル-ベンゼン、
 1-[[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル]-メチル]-
 1H-イミダゾール、
 1-[[2-(4-クロロフェニル)-3-フェニルオキシラニル]-メチル]-1H-
 1, 2, 4-トリアゾール、
 1-[1-[2-[(2, 4-ジクロロフェニル)-メトキシ]-フェニル]-エテニル]-
 1H-イミダゾール、
 1-メチル-5-ノニル-2-(フェニルメチル)-3-ピロリジノール、
 2', 6'-ジブプロモ-2-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-4'-トリフルオロ-
 メチル-1, 3-チアゾール-5-カルボキシアニリド、

10

20

30

40

50

- 2, 2-ジクロロ-N-[1-(4-クロロフェニル)-エチル]-1-エチル-3-メチル-シクロプロパンカルボキサミド、
- 2, 6-ジクロロ-5-(メチルチオ)-4-ピリミジニル-チオシアナート、
- 2, 6-ジクロロ-N-(4-トリフェニルメチルベンジル)-ベンズアミド、
- 2, 6-ジクロロ-N-[4-(トリフェニルメチル)-フェニル]-メチル)-ベンズアミド、
- 2-(2, 3, 3-トリヨード-2-プロペニル)-2H-テトラゾール、
- 2-[(1-メチルエチル)-スルホニル]-5-(トリクロロメチル)-1, 3, 4-チアジアゾール、
- 2-[[6-デオキシ-4-O-(4-O-メチル-β-D-グリコピラノシル)-α-D-グルコピラノシル]-アミノ]-4-メトキシ-1H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-5-カルボニトリル、
- 2-アミノブタン、
- 2-ブromo-2-(ブromoメチル)-ペンタンジニトリル、
- 2-クロロ-N-(2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-インデン-4-イル)-3-ピリジンカルボキサミド、
- 2-クロロ-N-(2, 6-ジメチルフェニル)-N-(イソチオシアナトメチル)-アセトアミド、
- 2-フェニルフェノール(OPP)、
- 3, 4-ジクロロ-1-[4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル]-1H-ピロール-2, 5-ジオン、
- 3, 5-ジクロロ-N-[シアノ[(1-メチル-2-プロピニル)-オキシ]-メチル]-ベンズアミド、
- 3-(1, 1-ジメチルプロピル-1-オキソ-1H-インデン-2-カルボニトリル、
- 3-[2-(4-クロロフェニル)-5-エトキシ-3-イソキサゾリジニル]-ピリジン、
- 4-クロロ-2-シアノ-N, N-ジメチル-5-(4-メチルフェニル)-1H-イミダゾール-1-スルホンアミド、
- 4-メチル-テトラゾロ[1, 5-a]キナゾリン-5(4H)-オン、
- 8-(1, 1-ジメチルエチル)-N-エチル-N-プロピル-1, 4-ジオキサスピロ[4.5]デカン-2-メタンアミン、
- 8-ヒドロキシキノリンサルフェート、
- 9H-キサンテン-2-[(フェニルアミノ)-カルボニル]-9-カルボン酸ヒドラジド、
- ビス-(1-メチルエチル)-3-メチル-4-[(3-メチルベンゾイル)-オキシ]-2, 5-チオフェンジカルボキシレート、
- シス-1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-シクロヘプタノール、
- シス-4-[3-[4-(1, 1-ジメチルプロピル)-フェニル-2-メチルプロピル]-2, 6-ジメチル-モルホリン塩酸塩、
- [(4-クロロフェニル)-アゾ]-シアノ酢酸エチル、
- 炭酸水素カリウム、
- メタンテトラチオール-ナトリウム塩、
- 1-(2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、
- メチルN-(2, 6-ジメチルフェニル)-N-(5-イソキサゾリルカルボニル)-DL-アラニネート、
- メチルN-(クロロアセチル)-N-(2, 6-ジメチルフェニル)-DL-アラニネート、
- N-(2, 3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-メチル-シクロヘキサンカル

10

20

30

40

50

ボキサミド、

N- (2, 6-ジメチルフェニル) -2-メトキシ-N- (テトラヒドロ-2-オキソ-3-フラニル) -アセトアミド、

N- (2, 6-ジメチルフェニル) -2-メトキシ-N- (テトラヒドロ-2-オキソ-3-チエニル) -アセトアミド、

N- (2-クロロ-4-ニトロフェニル) -4-メチル-3-ニトロ-ベンゼンスルホンアミド、

N- (4-シクロヘキシルフェニル) -1, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、

N- (4-ヘキシルフェニル) -1, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン 10

、
N- (5-クロロ-2-メチルフェニル) -2-メトキシ-N- (2-オキソ-3-オキサゾリジニル) -アセトアミド、

N- (6-メトキシ) -3-ピリジニル) -シクロプロパンカルボキサミド、

N- [2, 2, 2-トリクロロ-1- [(クロロアセチル) -アミノ] -エチル] -ベンズアミド、

N- [3-クロロ-4, 5-ビス (2-プロピニルオキシ) -フェニル] -N'-メトキシ-メタンイミドアミド、

N-ホルミル-N-ヒドロキシ-DL-アラニン-ナトリウム塩、

O, O-ジエチル [2- (ジプロピルアミノ) -2-オキソエチル] -エチルホスホロアミドチオエート、 20

O-メチルS-フェニルフェニルプロピルホスホロアミドチオエート、

S-メチル1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール-7-カルボチオエート、

スピロ [2H] -1-ベンゾピラン-2, 1' (3' H) -イソベンゾフラン] -3'-オン、

殺菌剤：

ブロナポル (bronopol)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ニトラピリン (nitrapyrin)、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、カスガマイシン (kasugamycin)、オクチリノン (octhilinone)、フランカルボン酸、オキシテトラシクリン (oxytetracyclin)、プロベナゾール (probenazole)、ストレプトマイシン (streptomycin)、テクロフタラム (tecloftalam)、硫酸銅および他の銅調合物。 30

殺昆虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセトミプリド (acetamiprid)、アクリナスリン (acrinathrin)、アラニカルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、アルドキシカルブ (aldoxycarb)、アルファシペルメスリン (alpha-cypermethrin)、アルファメスリン (alphamethrin)、アミトラズ (amitraz)、アベルメクチン (avermectin)、AZ60541、アザジラクチン (azadirachtin)、 40

アザメチフォス (azamethiphos)、アジンフォスA (azinphos A)、アジンフォスM (azinphos M)、アゾシクロチン (azocyclostin)、

バシルス・ポピリアエ (Bacillus popilliae)、バシルス・セファエリクス (Bacillus sphaericus)、バシルス・サブチリス (Bacillus subtilis)、バシルス・スリングエンシス (Bacillus thuringiensis)、バクテリオウイルス類、ベオーベリア・バッシアナ (Beauveria bassiana)、ベオーベリア・テネラ (Beauveria tenella)、

ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb) 50

、ベンスルタップ (bensultap)、ベンゾキシメート (benzoximate)、ベータシフルスリン (betacyfluthrin)、ビフェナゼート (bifenazate)、ビフェンスリン (bifenthrin)、バイオエタノメスリン (bioethanomethrin)、ビオペルメスリン (biopermethrin)、BPMC、ブロモフォスA (bromophos A)、ブフェンカルブ (bufencarb)、ブプロフェジン (buprofezin)、ブタチオフォス (butathiofos)、ブトカルボキシシン (butocarboxin)、ブチルピリダベン (butylpyridaben)、

カジュサフォス (cadusafos)、カルバリール (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボフェノチオン (carbophenothion)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、クロエトカルブ (chloethocarb)、クロルエトキシフォス (chlorethoxyfos)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルフェンビンフォス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロルメフォス (chlormephos)、クロルピリフォス (chlorpyrifos)、クロルピリフォスM (chlorpyrifos M)、クロバポルスリン (chlovaorthrin)、シスーレスメスリン (cis-resmethrin)、クロシスリン (clocythriner)、クロエトカルブ (chloethocarb)、クロフェンテジン (clofentezine)、シアノフォス (cyanophos)、シクロブレン (cycloprene)、

シクロプロスリン (cycloprothrin)、シフルスリン (cyfluthrin)、シハロスリン (cyhalothrin)、シヘキサチン (cyhexatin)、シベルメスリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、

デルタメスリン (deltamethrin)、デメトン-M (demeton-M)、デメトン-S (demeton-S)、デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ジアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンフォス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、ドクサツ-ナトリウム (docusate-sodium)、ドフェナピン (dofenapyn)、

エフルシラネート (eflusalanate)、エマメクチン (emamectin)、エンペンスリン (empenthrin)、エンドスルファン (endosulfan)、エントモフトラ種 (Entomopftthora spp.)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチオン (ethion)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、エトプロフォス (ethoprophos)、エトキサゾール (etoxazole)、エトリンフォス (etrimphos)、

フェナミフォス (fenamiphos)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノキサクリム (fenoxacrim)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、フェンプロパスリン (fenpropathrin)、フェンピラド (fenpyrad)、フェンピリスリン (fenpyrithrin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フルアジナム (fluazinam)、フルアズロン (fluazuron)、フルブロシスリネート (flubrocycythrinate)、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルシスリネート (flucythrinate)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、フルテンジン (flutenzi

10

20

30

40

50

ne)、フルバリネート (fluvalinate)、フォノフォス (fonophos)、
 フォスメチラン (fosmethilan)、フォスチアゼート (fosthiazate)、
 フブフェンプロックス (fubfenprox)、フラチオカルブ (furathiocarb)、

グラニューシスウイルス、

ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、ヘプテノフォス (heptenophos)、
 ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、
 ヒドロプレン (hydroprene)、

イミダクロプリド (imidacloprid)、イサゾフォス (isazophos)、
 イソフェンフォス (isofenphos)、イソキサチオン (isoxathion)、
 イベルメクチン (ivermectin)、

10

核多角体病ウイルス、

ラムダーシハロスリン (lambda-cyhalothrin)、ルフェヌロン (lufenuron)、

マラチオン (malathion)、メカルバム (mecarbam)、メタルデヒド (metaldehyde)、

メタミドフォス (methamidophos)、メタリジウム・アニソプリアエ (Metharhizium anisopliae)、
 メタリジウム・フラボビリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン (methidathion)、
 メチオカルブ (methiocarb)、メトミル (methomyl)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、
 メトルカルブ (metolcarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、メビンフォス (mevinphos)、
 ミルベメクチン (milbemectin)、モノクロトフォス (monocrotophos)、

20

ナレド (naled)、ニテンピラム (nitenpyram)、ニチアジン (nithiazine)、
 ノバルロン (novaluron)、

オメトエート (omethoate)、オキサミル (oxamyl)、オキシデメトンM (oxydemethon M)、

パエシロミセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、
 パラチオンA (parathion A)、パラチオンM (parathion M)、
 ペルメスリン (permethrin)、フェントエート (phenthoate)、
 フォレート (phorate)、フォサロン (phosalone)、フォスメット (phosmet)、
 フォスファミドン (phosphamidon)、フォキシム (phoxim)、

30

ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミフォスM (pirimiphos M)、
 ピリミフォスA (pirimiphos A)、プロフェノフォス (profenofos)、
 プロメカルブ (promecarb)、プロポクサー (propoxur)、
 プロチオフォス (prothiofos)、プロトエート (prothoate)、
 ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロフォス (pyrachlofos)、
 プレスメスリン (pyresmethrin)、ピレスルム (pyrethrum)、
 ピリダベン (pyridaben)、ピリダチオン (pyridathion)、
 ピリミジフェン (pyrimidifen)、
 ピリプロキシフェン (pyriproxifen)、
 キナルフォス (quinalphos)、

40

リバビリル (ribavirin)、

サリチオン (salithion)、セブフォス (sebufos)、シラフルオフエン (silaflofen)、
 スピノサド (spinosad)、スルフォテップ (sulfotep)、
 スルプロフォス (sulprofos)、

タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、テブフェノジド (tebufenozid)、
 テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テブピリミフォス (tebupirimiphos)、
 テフルベンズロン (teflubenzuron)

50

、テフルスリン (tefluthrin)、テムフォス (temephos)、
 テミビンフォス (temivinvphos)、テルブフォス (terbufos)、テト
 ラクロルビンフォス (tetrachlorvinphos)、テータシペルメスリン
 (thetacypermethrin)、チアプロニル (thiapronil)、
 チアトリフォス (thiatriphos)、チオシクラム・ハイドロフェン・オキサレ
 ート (thiocyclam hydrogen oxalate)、チオジカルブ (thiodicarb)、
 チオファノックス (thiofanox)、スリングエンシン (thuringiensin)、

トラロシスリン (tralocythrin)、トラロメスリン (tralomethrin)、
 トリアラテン (triarathene)、トシアザメート (triazamate)、
 トリアゾフォス (triazophos)、

トリアズロン (triazuron)、トリクロフェニジン (trichlophenidine)、
 トリクロルフォン (trichlorfon)、トリフルオムロン (trifluomuron)、
 トリメタカルブ (tromethacarb)、

バミドチオン (vamidothion)、バニリプロール (vaniliprole)、
 ベルチシリウム・レカニイ (Verticillium lecanii)、

YI 5302、

ゼータシペルメスリン (zetaacypermethrin)、ゾラプロフォス (zolaprophos)、

(1R-シス) - [5 - (フェニルメチル) - 3 - フラニル] - メチル - 3 - [(ジヒド
 ロー 2 - オキソ - 3 (2H) - フラニリデン) - メチル] - 2, 2 - ジメチルシクロプロ
 パンカルボキシレート、

(3 - フェノキシフェニル) - メチル - 2, 2, 3, 3 - テトラメチルシクロプロパンカ
 ルボキシレート、

1 - [(2 - クロロ - 5 - チアゾリル) メチル] テトラヒドロ - 3, 5 - ジメチル - N -
 ニトロ - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 (1H) - イミン、

2 - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - [4 - (1, 1 - ジメチルエチル) フ
 ェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - オキサゾール、

2 - (アセチルオキシ) - 3 - ドデシル - 1, 4 - ナフタレンジオン、

2 - クロロ - N - [[4 - (1 - フェニルエトキシ) - フェニル] - アミノ] - カルボ
 ニル] - ベンズアミド、

2 - クロロ - N - [[4 - (2, 2 - ジクロロ - 1, 1 - ジフルオロエトキシ) - フェ
 ニル] - アミノ] - カルボニル] - ベンズアミド、

プロピルカルバミン酸 3 - メチルフェニル、

4 - [4 - (4 - エトキシフェニル) - 4 - メチルペンチル] - 1 - フルオロ - 2 - フェ
 ノキシ - ベンゼン、

4 - クロロ - 2 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 5 - [[2 - (2, 6 - ジメチル - 4 -
 フェノキシフェノキシ) エチル] チオ] - 3 (2H) - ピリダジノン、

4 - クロロ - 2 - (2 - クロロ - 2 - メチルプロピル) - 5 - [(6 - ヨード - 3 - ピリ
 ジニル) メトキシ] - 3 (2H) - ピリダジノン、

4 - クロロ - 5 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メトキシ] - 2 - (3, 4 - ジクロ
 ロフェニル) - 3 (2H) - ピリダジノン、

バシルス・スリングエンシス (Bacillus thuringiensis) 菌株 E
 G - 2348、

[2 - ベンゾイル - 1 - (1, 1 - ジメチルエチル) - ヒドラジノ安息香酸、

2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - オキソ - 1 - オキサスピロ
 [4. 5] デセ - 3 - エン - 4 - イルブタノエート、

[3 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 - チアゾリジニリデン] - シアナ
 ミド、

ジヒドロ - 2 - (ニトロメチレン) - 2H - 1, 3 - チアジン - 3 (4H) - カルボキシ

10

20

30

40

50

アルデヒド、

[2-[[1, 6-ジヒドロ-6-オキソ-1-(フェニルメチル)-4-ピリダジニル] オキシ] エチル]-カルバミン酸エチル、

N-(3, 4, 4-トリフルオロ-1-オキソ-3-ブテニル)-グリシン、

N-(4-クロロフェニル)-3-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-4-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド、

N-[(2-クロロ-5-チアゾリル)メチル]-N'-メチル-N''-ニトログアニジン、

N-メチル-N'-(1-メチル-2-プロペニル)-1, 2-ヒドラジンジカルボチオアミド、

N-メチル-N'-2-プロペニル-1, 2-ヒドラジンジカルボチオアミド、

O, O-ジエチル[2-(ジプロピルアミノ)-2-オキソエチル]-エチルホスホロアミドチオエート。

【0590】

他の既知の活性化化合物、例えば除草剤、肥料および成長調節剤と混合することも可能である。

【0591】

殺昆虫剤として使用する時には、本発明に従う活性化化合物はさらにそれらの市販の調合物中およびそれらの調合物から調製した使用形態で、相乗剤との混合物状で存在することもできる。相乗剤とは、加えられる相乗剤自体は活性である必要はないが、活性化化合物の活性を高める化合物である。

【0592】

市販の調合物から調整した使用形態の活性化化合物含有量は広い範囲内で変えることができる。使用形態の活性化化合物濃度は0.0000001~95重量%、好適には0.0001~1重量%の間の活性化化合物でありうる。

【0593】

化合物は使用形態に適する通常の方法で使用される。

【0594】

衛生上の有害生物または貯蔵製品の有害生物に対して使用する時には、活性化化合物は木材およびクレイ上での優れた残存活性並びに石灰処理した物質上でのアルカリに対する良好な安定性により特徴づけられる。

【0595】

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

【0596】

本発明に従う活性化化合物は、例えば、次の植物に関連して使用することができる：

次の属の双子葉雑草：カラシ属 (*Sinapis*)、マメグンバイナズナ属 (*Leipidium*)、ヤエムグラ属 (*Galium*)、ハコベ属 (*Stellaria*)、シカギク属 (*Matricaria*)、カミツレモドキ属 (*Anthemis*)、ガリンソガ属 (*Galinsoga*)、アカザ属 (*Chenopodium*)、イラクサ属 (*Urtica*)、キオン属 (*Senecio*)、ヒユ属 (*Amaranthus*)、スベリヒユ属 (*Portulaca*)、オナモミ属 (*Xanthium*)、ヒルガオ属 (*Convolvulus*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、タデ属 (*Polygonum*)、セスバニア属 (*Sesbania*)、ブタクサ属 (*Ambrosia*)、アザミ属 (*Cirsium*)、ヒレアザミ属 (*Carduus*)、ノゲシ属 (*Sonchus*)、ナス属 (*Solanum*)、イヌガラシ属 (*Rorippa*)、キカシグサ属 (*Rotala*)、アゼナ属 (*Lindernia*)、ラミウム属 (*Lamium*)、クワガタソウ属 (*Veronica*)、イチビ属 (*Abutilon*)、エメクス属 (*Emex*)、チョウセンア

10

20

30

40

50

サガオ属 (*Datura*)、スミレ属 (*Viola*)、チシマオドリコ属 (*Galeopsis*)、ケシ属 (*Papaver*)、センタウレア属 (*Centaurea*)、トリフォリウム属 (*Trifolium*)、ラヌクルス属 (*Ranunculus*) およびタラキサクム属 (*Taraxacum*)。

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

10

次の属の単子葉雑草：ヒエ属 (*Echinochloa*)、エノコログサ属 (*Setaria*)、キビ属 (*Panicum*)、メヒシバ属 (*Digitaria*)、アワガリエ属 (*Phleum*)、スズメノカタビラ属 (*Poa*)、ウシノケグサ属 (*Festuca*)、オヒシバ属 (*Eleusine*)、ブラキアリア属 (*Brachiaria*)、ドクミギ属 (*Lolium*)、スズメノチヤヒキ属 (*Bromus*)、カラスミギ属 (*Avena*)、カヤツリグサ属 (*Cyperus*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、カモジグサ属 (*Agropyron*)、シノドン属 (*Cynodon*)、ミズアオイ属 (*Monochoria*)、テンツキ属 (*Fimbristylis*)、オモダカ属 (*Sagittaria*)、ハリイ属 (*Eleocharis*)、ホタルイ属 (*Scirpus*)、パスパルム属 (*Paspalum*)、カモノハシ属 (*Ischaemum*)、スフエノクレア属 (*Sphenoclea*)、ダクチロクテニウム属 (*Dactyloctenium*)、ヌカボ属 (*Agrostis*)、スズメノテツボウ属 (*Alopecurus*)、アペラ属 (*Apera*)、アエギロプス属 (*Aegilopus*) およびファラリス (*Phalaris*) 属。

20

次の属の単子葉栽培植物：イネ属 (*Oryza*)、トウモロコシ属 (*Zea*)、コムギ属 (*Triticum*)、オオムギ属 (*Hordeum*)、カラスミギ属 (*Avena*)、ライムギ属 (*Secale*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、キビ属 (*Panicum*)、サトウキビ属 (*Saccharum*)、アナナス属 (*Ananas*)、クサスギカズラ属 (*Asparagus*) およびネギ属 (*Allium*)。

30

【0597】

しかしながら、本発明に従う活性化合物の使用はこれらの属に何ら限定されるものではなく、同じ方法で他の植物にも及ぶ。

【0598】

化合物は、濃度に依存して、例えば工業地域および鉄道線路上、樹木が存在するかあるいは存在しない道路および広場上の雑草の完全防除に適している。同等に、化合物は多年生栽培植物、例えば造林、装飾樹木、果樹園、ブドウ園、柑橘類の木立、クルミの果樹園、バナナの植林、コーヒーの植林、茶の植林、ゴムの木の植林、油ヤシの植林、カカオの植林、小果樹の植え付けおよびホップの栽培植物、芝生 (*lawns*)、芝土 (*turf*)、および牧草地の中の雑草の防除に、そして一年生栽培植物中の雑草の選択的防除に使用することができる。

40

【0599】

本発明に従う式 (I) の化合物は土壌および植物の地上部分に適用される時に強い除草活性および広い活性範囲を有する。ある程度までは、それらは単子葉および双子葉栽培植物中の単子葉および双子葉雑草の選択的抑制に、発芽前および発芽後の両方で適している。

【0600】

雑草類の防除用には、本発明に従う活性化合物はそのままで或いはそれらの組成物の形態において、既知の除草剤との混合物として用いることもでき、仕上げた調合物または槽混合が可能である。

50

【0601】

混合物用に使用できる成分は既知の除草剤、例えば下記のものである：

アセトクロル (acetochlor)、アシフルオルフェン (一ナトリウム) (acifluorfen (sodium))、アクロニフェン (aclonifen)、アラクロル (alachlor)、アロキシジム (一ナトリウム) (alloxydim (sodium))、アメトリン (ametryne)、アミドクロル (amidochlor)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アニロフォス (anilofos)、アスラム (asulam)、アトラジン (atrazine)、アザファネジン (azafaneidin)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、ベナゾリン (一エチル) (benazolin (ethyl))、ベンフレサート (benfuresate)、ベンスルフロン (一メチル) (bensulfuron (methyl))、ベントゾン (bentazon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾイルプロップ (一エチル) (benzoylprop (ethyl))、ビアラフォス (bialaphos)、ビフェノックス (bifenox)、ビスピリバック (一ナトリウム) (bispyribac (sodium))、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブタクロル (butachlor)、ブトロキシジム (butoxydim)、ブチレート (butylate)、カフェンストロール (cafenstrole)、カロキシジム (caloxydim)、カルベタミド (carbetamide)、カルフェントラゾン (一エチル) (carfentrazone (ethyl))、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロランベン (chloramben)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (一エチル) (chlorimuron (ethyl))、クロルニトロフェン (chlornitrofen)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルトルロン (chlortoluron)、シニドン (一エチル) (cinidon (ethyl))、シンメスリン (cinmethylin)、シノスルフロン (cinosulfuron)、クレトジム (clethodim)、クロジナフォップ (一プロパルギル) (clodinafop (propargyl))、クロマゾン (clomazone)、クロメプロップ (clomeprop)、クロピラリド (clopyralid)、クロピラスルフロン (一メチル) (clopyrasulfuron (methyl))、クロランスラム (一メチル) (cloransulam (methyl))、クミルロン (cumyluron)、シアナジン (cyanazine)、シブツリン (cybtryne)、シクロエート (cycloate)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、シクロキシジム (cycloxydim)、シハロフォップ (一ブチル) (cyhalofop (butyl))、2, 4-D、2, 4-DB、2, 4-DP、デスメジファム (desmedipham)、ジアラート (diallate)、ジカンバ (dicamba)、ジクロフォップ (一メチル) (diclofop (methyl))、ジクロスラム (diclosulam)、ジエタチル (一エチル) (diethatyl (ethyl))、ジフェンゾクアート (difenzoquat)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ジメフロン (dimefuron)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメタクロル (dimethachlor)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、ジメキシフラム (dimexyflam)、ジニトラミン (dinitramine)、ジフェナミド (diphenamid)、ジクアート (diquat)、ジチオピル (dithiopyr)、ジウロン (diuron)、ジムロン (dymron)、エポプロダン (epoprodan)、EPTC、エスプロカルブ (esprocarb)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エタメトスルフロン (一メチル) (ethametsulfuron (methyl))、エトフメセート (ethofumesate)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトベンザニド (etobenzanid)

、フェノキサプロップ（－P－エチル）（fenoxaprop（－P－ethyl））、フラムプロップ（－イソプロピル）（flamprop（－isopropyl））、フラムプロップ（－イソプロピル－L）（flamprop（－isopropyl－L））、フラムプロップ（－メチル）（flamprop（－methyl））、フラザスルフロン（flazasulfuron）、フルアジフォップ（－P－ブチル）（fluazifop（－P－butyl））、フルアゾレート（fluazolate）、フルカルバゾン（flucarbazone）、フルフェナセット（flufenacet）、フルメツラム（flumetsulam）、フルミクロラック（－ペンチル）（flumiclorac（－pentyl））、フルミオキサジン（flumioxazin）
 、フルミプロピン（flumipropyn）、フルメツラム（flumetsulam）
 、フルオメツロン（fluometuron）、フルオロクロリドン（fluorochloridone）、フルオログリコフェン（－エチル）（fluoroglycofen（－ethyl））、フルポキサム（flupoxam）、フルプロパシル（flupropacil）、フルルピルスルフロン（－メチル、－ナトリウム）（flurpysulfuron（－methyl, －sodium））、フルレノール（－ブチル）（flurenol（－butyl））、フルリドン（fluridone）、フルロキシピル（－メプチル）（fluroxypyr（－meptyl））、フルルプリミドール（frurprimidol）、フルルタモン（flurtamone）、フルチアセット（－メチル）（fluthiacet（－methyl））、フルチアミド（fluthiamide）
 、フオメサフェン（fomesafen）、グルホシネート（－アンモニウム）（glufosinate（－ammonium））、グリホセート（－イソプロピルアンモニウム）（glyphosate（－isopropylammonium））、ハロサフェン（halosafen）、ハロキシフォップ（－エトキシエチル）（haloxyfop（－ethoxyethyl））、ハロキシフォップ（－P－メチル）（haloxyfop（－P－methyl））、ヘキサジノン（hexazinone）、イマザメタベンズ（－メチル）（imazamethabenz（－methyl））、イマザメタピル（imazamethapyr）、イマザモックス（imazamox）、インザピック（imazapic）、イマザピル（imazapyr）、イマザクイン（imazaquin）、イマゼタピル（imazethapyr）、イマゾスルフロン（imazosulfuron）、ヨードスルフロン（iodosulfuron）
 、イオキシニル（ioxynil）、イソプロパリン（isopropalin）、イソプロツロン（isoproturon）、イソウロン（isouron）、イソキサベン（isoxaben）、イソキサクロルトール（isoxachlortole）、イソキサフルトール（isoxaflutole）、イソキサピリフォップ（isoxapyrifop）、ラクトフェン（lactofen）、レナシル（lenacil）、リヌロン（linuron）、MCPA、MCPP、メフェナセット（mefenacet）、メソトリオン（mesotrione）、メタミトロン（metamitron）、メタザクロル（metazachlor）、メタベンズチアズロン（methabenzthiazuron）、メトベンズロン（metobenzuron）、メトブロムロン（metobromuron）、（アルファ）メトラクロル（（alpha）metalachlor）、メトスラム（metosulam）、メトクスロン（metoxuron）、メトリブジン（metribuzin）、メツルフロン（－メチル）（metsulfuron（－methyl））、モリネート（molinate）、モノリヌロン（monolinuron）、ナプロアニリド（naproanilide）、ナプロパミド（napropamide）、ネブロン（neburon）、ニコスルフロン（nicosulfuron）、ノルフルラゾン（norflurazon）、オルベンカルブ（orbencarb）、オリザリン（oryzalin）、オキサジアギル（oxadiargyl）、オキサジアゾン（oxadiazon）、オキサスルフロン（oxasulfuron）、オキサジクロメフォン（oxaziclomefone）、オキシフルオルフェン（oxyfluorfen）、パラクアート（paraqu

at)、ペラルゴン酸 (pelargonic acid)、ペンジメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、フェンメジファム (phenmedipham)、ピペロフォス (piperophos)、プレチラクロル (pretalachlor)、プリミスルフロノール (primisulfuron (−methyl))、プロメトリン (prometryn)、プロパクロル (propachlor)、プロパニル (propanil)、プロパキサフォップ (propaquizafofop)、プロプイソクロル (propisochlor)、プロピザミド (propyzamide)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロスルフロノール (prosulfuron)、ピラフルフェン (−エチル) (pyraflufen (−ethyl))、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾスルフロノール (−エチル) (pyrazosulfuron (−ethyl))、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリデート (pyridate)、ピリミノバック (−メチル) (pyriminobac (−methyl))、ピリチオバック (−ナトリウム) (pyrithiobac (−sodium))、キンクロラック (quinchlorac)、キンメラック (quinmerac)、キノクラミン (quinoclamine)、キサロフォップ (−P−エチル) (quizalofop (−P−ethyl))、キサロフォップ (−P−テフルル) (quizalofop (−P−tefuryl))、リムスルフロノール (rimisulfuron)、セトキシジム (sethoxydim)、シマジン (simazine)、シメトリン (simeetryn)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、スルホメツロン (−メチル) (sulfometuron (−methyl))、スルホセート (sulfosate)、スルホスルフロノール (sulfosulfuron)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テプラロキシジム (tepraloxym) 、テルブチルアジン (terbutylazine)、テルブトリン (terbutryn)、テニルクロル (thenylchlor)、チアフルアミド (thiafluamide)、チアゾピル (thiazopyr)、チジアジミン (thidiazimin)、チフェンスルフロノール (−メチル) (thifensulfuron (−methyl))、チオベンカルブ (thiobencarb)、チオカルバジル (thiocarbazil)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアラート (triallate)、トリアスルフロノール (triasulfuron)、トリベヌロン (−メチル) (tribenuron (−methyl))、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphan)、トリフルラリン (trifluralin) およびトリスルフロノール (triflurosulfuron)。

【0602】

他の既知の活性化合物、例えば殺菌・殺カビ剤、殺昆虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、小鳥忌避剤、植物栄養剤および土壌を改良する剤との混合物も可能である。

【0603】

活性化合物はそのまま、それらの調合物の形態またはそれらからさらに希釈して調製された使用形態、例えば調製済 (ready-to-use) 液剤、懸濁剤、乳剤、粉剤、塗布剤および粒剤の形態で 사용할 ことができる。それらは普通の方法で、例えば、液剤散布 (watering)、噴霧 (spraying)、アトマイジング (atomizing)、粒剤散布 (scattering) によって施用される。

【0604】

本発明に従う活性化合物は植物の発芽の前および後に適用することができる。それらは種蒔き前に土壌中に加えることもできる。

【0605】

活性化合物の使用量は相対的に広い範囲内で変えることができる。それは本質的に所望する効果の性質に依存している。一般的に、使用量は土壌表面 1 ヘクタール当り 1 g ~ 1

0 kgの間、好ましくは1 ha当たり5 g～5 kgの間である。

【0606】

本発明に従う活性化合物は植物、衛生上、および貯蔵製品に対してだけでなく、獣医薬分野において動物寄生体（体外寄生体）、例えば硬質マダニ（hard ticks）、軟質マダニ（soft ticks）、皮癬ダニ、葉ダニ、ハエ類（刺すハエおよび吸うハエ）、寄生性のハエの幼虫、虱、毛虱、鳥虱および蚤、に対しても活性である。これらの寄生体は下記のものを包含する：

シラミ目（Anoplurida）から、例えば、ヘマトピヌス種（Haematopinus spp.）、リノグナスス種（Linognathus spp.）、ペジクルス種（Pediculus spp.）、フチルス種（Phtirus spp.）およびソレノポテス種（Solenopotes spp.）。

10

【0607】

ハジラミ目（Mallophagida）並びにマルツノハジラミ亜目（Amblycerina）およびホソツノハジラミ亜目（Ischnocerina）から、例えば、トリメノポン種（Trimenopon spp.）、メノポン種（Menopon spp.）、トリノトン種（Trinoton spp.）、ボビコラ種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ（Werneckiella spp.）、レピケントロン種（Lepikentron spp.）、ダマリナ種（Damalina spp.）、トリコデクテス種（Trichodectes spp.）およびフェリコラ種（Felicola spp.）。

20

【0608】

双翅目（Diptera）並びにカ亜目（Nematocerina）およびハエ亜目（Brachycerina）から、例えば、エーデス種（Aedes spp.）、アノフェレス種（Anopheles spp.）、クレックス種（Culex spp.）、シムリウム種（Simulium spp.）、ユーシムリウム種（Eusimulium spp.）、フレボトムス種（Phlebotomus spp.）、ルツゾミイア種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス種（Culicoides spp.）、クリソプス種（Chrysops spp.）、ヒボミトラ種（Hybomitra spp.）、アチロツス種（Atylotus spp.）、タバヌス種（Tabanus spp.）、ヘマトポタ種（Haematopota spp.）、フィリポニア種（Philipomyia spp.）、ブラウラ種（Braula spp.）、ムスカ種（Musca spp.）、ヒドロタエア種（Hydrotaea spp.）、ストモキシス種（Stomoxys spp.）、ヘマトビア種（Haematobia spp.）、モレリア種（Morellia spp.）、ファニア種（Fannia spp.）、グロッシナ種（Glossina spp.）、カリフォラ種（Calliphora spp.）、ルシリア種（Lucilia spp.）、クリソミイア種（Chrysomyia spp.）、ウールファルチア種（Wohlfahrtia spp.）、サルコファガ種（Sarcophaga spp.）、オエストルス種（Oestrus spp.）、ヒポデルマ種（Hypoderma spp.）、ガステロフィルス種（Gasterophilus spp.）、ヒッポボスカ種（Hippobosca spp.）、リポプテナ種（Lipoptena spp.）およびメロファグス種（Melophagus spp.）。

30

40

【0609】

ノミ目（Siphonapterida）から、例えば、プレックス種（Pulex spp.）、クテノセファリデス種（Ctenocephalides spp.）、ゼノピスラ種（Xenopsylla spp.）およびセラトフィルス種（Ceratophyllus spp.）。

【0610】

カメムス目（Heteropterida）、例えば、シメックス種（Cimex spp.）、トリアトマ種（Triatoma spp.）、ロドニウス種（Rhodni

50

us spp.) およびパンストロンギルス種 (Panstrongylus spp.)。

【0611】

ゴキブリ目 (Blattarida) から、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica) およびスベラ種 (Supella spp.)。

【0612】

ダニ目 (Acaria) (アカリダ (Acarida)) の亜種並びにメター (Metar) およびメソスチグマタ目 (Mesostigmata) から、例えば、アルガス種 (Argas spp.)、オルニソドルス種 (Ornithodoros spp.)、オタビウス種 (Otobius spp.)、イキシデス種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ種 (Amblyomma spp.)、ブーフイルス種 (Boophilus spp.)、デルマセントル種 (Dermacentor spp.)、ヘマフィサリス種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ種 (Hyalomma spp.)、リピセファルス種 (Rhipicephalus spp.)、デルマニッサス種 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア種 (Raillietia spp.)、ニューモニッサス (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ種 (Sternostoma spp.) およびバロア種 (Varroa spp.)。

【0613】

ケダニ亜目 (Actinedida) (プロチグマタ (Prostigmata)) およびコナダニ亜目 (Acaridida) (アスチグマタ (Astigmata)) から、例えば、アカラピス種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ種 (Cheyletiella spp.)、オルニソヘイレチア種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア種 (Myobia spp.)、ソレルガテス種 (Psorergates spp.)、デモデックス種 (Demodex spp.)、トロンビクラ種 (Trombicula spp.)、リストロフォルス種 (Listrophorus spp.)、アカルス種 (Acarus spp.)、チロファグス種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス種 (Hypodectes spp.)、テロリクス種 (Pterolichus spp.)、ソロプテス種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス種 (Chorioptes spp.)、オクトデクテス種 (Octodectes spp.)、サルコプテス種 (Sarcoptes spp.)、ノトエド레스種 (Notodres spp.)、ネミドコプテス種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス種 (Cytodites spp.) およびラミノシオプテス種 (Laminosioptes spp.)。

【0614】

本発明に従う式 (I) の活性化合物は農業用生産性家畜、例えば、牛、羊、山羊、馬、豚、驢馬、駱駝、バッファロー、兎、鶏、七面鳥、鴨、鶯鳥および蜜蜂、他の室内動物、例えば、犬、猫、飼育用の鳥および水族館の魚、並びにいわゆる実験動物、例えば、ハムスター、モルモット、ラットおよびマウス、に感染する節足動物を抑制するためにも適する。本発明に従う活性化合物の使用によりこれらの節足動物を抑制することによって死亡事例および (肉、乳、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの) 生産量減少を減じ、その結果、より経済的なそしてより簡単な動物の飼育を可能にする。

【0615】

本発明に従う活性化合物は獣医学分野では、既知の方法で腸内投与により、例えば錠剤、カプセル剤、飲料、飲み薬、顆粒、ペースト、大型丸剤、飼料を介する方法および坐薬の形態で、非経口的投与により、例えば、注射 (筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など) により、移植、鼻内投与により、例えば浸漬もしくは入浴、噴霧、注ぎおよび滴下の形態

10

20

30

40

50

で皮膚投与により、洗浄および粉末散布の形態で、そして活性化合物を含有する成型品、例えば首輪、耳札、尾の標識、足輪、端綱、標識装置などを用いて使用される。

【0616】

家畜、家禽、ペットなどに投与される時には、式(I)の活性化合物は1~80%の量で活性化合物を含んでなる調合物(例えば粉剤、乳剤、散剤組成物)として、直接または100~10000倍の希釈後に使用することができ、或いはそれらを化学浴の形態で使用してもよい。

【0617】

さらに、本発明に従う式(I)の化合物が工業材料を破壊する昆虫に対して有効な殺昆虫活性を有することも見いだされた。

【0618】

下記の昆虫が例としてそして好適であるとして挙げられるが、それらは限定されるものではない：

甲虫類(Beetles)、例えば

ヒロトルペス・バジュルス(Hylotrupes bajulus)、クロロフォルス・ピロシス(Chlorophorus pilosis)、アノビウム・プンクタツム(Anobium punctatum)、ゼストビウム・ルフォビロスム(Xestobium rufovillosum)、プチリヌス・ペクチコルニス(Ptilinus pecticornis)、デンドロビウム・ペルチネックス(Dendrobium pertinex)、エルノビウス・モリス(Ernobius mollis)、プリオビウム・カルピニ(Priobium carpini)、リクツス・ブルンネイス(Lyctus brunneus)、リクツス・アフリカヌス(Lyctus africanus)、リクツス・プラニコリス(Lyctus planicollis)、リクツス・リネアリス(Lyctus linearis)、リクツス・プベッセンス(Lyctus pubescens)、トロゴキシロン・アエクアレ(Trogoxylon aequale)、ミンセス・ルギコシル(Minthes rugicollis)、キシレボルス種(Xyleborus spec.)、トリプトデンドロン種(Tryptodendron spec.)、アパテ・モオナクス(Apate monachus)、ボスチリクス・カプシンス(Bostrychus capucins)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス(Heterobostrychus brunneus)、シノキシロン種(Sinoxylon spec.)、ジノデルス・ミヌツス(Dinoderus minutus)。

ハチ類(Hymenopteros)、例えば

シレックス・ジュベンクス(Sirex juvencus)、ウロセルス・ギガス(Urocerus gigas)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス(Urocerus gigas taignus)、ウロセルス・アウグル(Urocerus augur)。

シロアリ類(Termites)、例えば

カロテルメス・フラビコリス(Kaloterme flavicollis)、クリプトテルメス・ブレビス(Cryptoterme brevis)、ヘテロテルメス・インジコラ(Heteroterme indicola)、レチクリテルメス・フラビペス(Reticuliterme flavipes)、レチクリテルメス・サントネンシス(Reticuliterme santonensis)、レクチクリテルメス・ルシフグス(Reticuliterme lucifugus)、マストテルメス・ダーウィニエンシス(Mastoterme darwiniensis)、ズーテルモプシス・ネバデンシス(Zootermopsis nevadensis)、コプトテルメス・フォルモサヌス(Coptoterme formosanus)。

シミ類(Bristletails)、例えば

レイスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)。

10

20

30

40

50

【0619】

工業材料はこの点については非一生存材料、例えば、好適にはプラスチック、接着剤、サイズ、紙およびボール紙、皮革、木材および材木製品、並びにコーティング組成物を意味すると理解すべきである。

【0620】

木材および材木製品が、昆虫による感染から特に好ましく保護される材料である。

【0621】

本発明に従う剤またはこれらを含んでなる混合物により保護できる木材および加工材木製品は、例えば、建築用材木、木製梁、鉄道枕木、橋梁部品、防波堤、木製車両、箱、荷台、容器、電柱、木製型枠、木製窓および扉、合板、チップボード、連結製品、または家屋の建築もしくは連結部の中で非常に一般的に使用されている木材製品を意味すると理解すべきである。

10

【0622】

活性化化合物はそのまま、濃縮物または一般的な普通の調合物、例えば粉末、粒剤、液剤、懸濁剤、乳剤もしくはペースト、の形態で使用する事ができる。

【0623】

上記の調合物はそれ自体は既知である方法で、例えば活性化化合物を少なくとも1種の溶媒もしくは希釈剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤または揮発保留剤、撥水剤、適宜乾燥剤および紫外線安定剤、並びに適宜着色剤および顔料、並びに他の加工助剤と混合することにより、製造できる。

20

【0624】

木材および材木から作成される木製製品の保護用に使用される殺昆虫剤組成物または濃縮物は本発明に従う活性化化合物を0.0001～95重量%、特に0.001～60重量%、の濃度で含んでなる。

【0625】

使用される組成物または濃縮物の量は昆虫の性質および発生状態並びに媒体に依存する。最適な適用量は使用時に各場合とも一連の試験により決めることができる。しかしながら、一般的には、保護しようとする材料を基にして0.0001～20重量%、好適には0.001～10重量%、の活性化化合物を使用することで充分である。

【0626】

使用される溶媒および／または希釈剤は有機化学溶媒もしくは溶媒混合物および／または油状もしくは油型の有機化学溶媒もしくは低揮発度の溶媒混合物および／または有極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物および／または水並びに適宜乳化剤および／または湿潤剤である。

30

【0627】

好適に使用される有機化学溶媒は35より上の蒸発価 (evaporation number) および30℃より上の、好適には45℃より上の、引火点を有する油状または油類似溶媒である。低揮発度を有するそのような油状または油類似溶媒として使用される物質は、適当な鉱油もしくはそれらの芳香族画分、または鉱油を含有する溶媒混合物、好適にはホワイトスピリット、石油および／またはアルキルベンゼンである。

40

【0628】

170～220℃の沸騰範囲を有する鉱油、170～220℃の沸騰範囲を有するホワイトスピリット、250～350℃の沸騰範囲を有するスピンドル油、160～280℃の沸騰範囲の石油もしくは芳香族、ターペンチンのエッセンスなどが有利に使用される。

【0629】

好適な態様では、180～210℃の沸騰範囲を有する液体脂肪族炭化水素類もしくは180～220℃の沸騰範囲を有する芳香族および脂肪族炭化水素類の高沸点混合物および／またはスピンドル油および／またはモノクロロナフタレン、好適にはα-モノクロロナフタレンが使用される。

【0630】

50

溶媒混合物も35より上の蒸発価および30℃より上の、好適には45℃より上の引火点を有し且つ殺昆虫剤／殺菌・殺カビ剤混合物がこの溶媒混合物の中に可溶性または可乳化性である限り、35より上の蒸発価および30℃より上の、好適には45℃より上の引火点を有する低揮発度の油状または油類似有機溶媒を高または中揮発度の有機化学溶媒により部分的に置換することができる。

【0631】

好適な態様によると、有機化学溶媒もしくは溶媒混合物の一部は脂肪族の有極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物により置換される。ヒドロキシルおよび／またはエステルおよび／またはエーテル基を有する脂肪族有機化学溶媒、例えば、グリコールエーテル、エステル類などが好適に使用される。

10

【0632】

本発明の概念で使用される有機化学結合剤はそれ自体既知であり、水で希釈可能でありおよび／または使用される有機化学溶媒中に可溶性もしくは可分散性もしくは可乳化性である合成樹脂および／または結合性乾燥油、特にアクリレート樹脂、ビニル樹脂、例えばポリ酢酸ビニル、ポリエステル樹脂、重縮合もしくは重付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂もしくは改質アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂、例えばインデン-クマロン樹脂、シリコーン樹脂、乾燥植物性および／または乾燥油および／または天然および／もしくは合成樹脂をベースとした物理的乾燥結合剤からなるかまたはそれらを含んでなる結合剤である。

【0633】

結合剤として使用される合成樹脂は乳化液、分散液または溶液の形態でを使用することができる。ビチューメンまたはビチューメン物質を10重量％までの量で結合剤として使用することができる。それ自体は既知である染料、顔料、撥水剤、臭気-遮蔽物質および抑制剤または腐食防止剤などをさらに使用することもできる。

20

【0634】

組成物または濃縮物が有機化学結合剤として少なくとも1種のアルキド樹脂または改質アルキド樹脂および／または乾燥植物性油を含んでなることが本発明によると好ましい。45重量％より多い、好適には50～68重量％の油含有量を有するアルキド樹脂が本発明により好適に使用される。

【0635】

上記の結合剤の全部または一部を揮発保留剤（混合物）または可塑剤（混合物）により置換することができる。これらの添加剤は活性化化合物の蒸発および結晶化または沈澱を防止することを意図する。それらは好適には（使用される結合剤の100％を基にして）結合剤の0.01～30％を置換する。

30

【0636】

可塑剤は、フタル酸エステル類、例えばフタル酸ジブチル、ジオクチルもしくはベンジルブチル、燐酸エステル類、例えば燐酸トリブチル、アジピン酸エステル類、例えばアジピン酸ジ-（2-エチルヘキシル）、ステアリン酸エステル類、例えばステアリン酸ブチルもしくはステアリン酸アミル、オレイン酸エステル類、例えばオレイン酸ブチル、グリセロールエーテル類または相対的に高分子量のグリコールエーテル類、グリセロールエステル類およびp-トルエンスルホン酸エステル類の化学種から生ずる。

40

【0637】

揮発保留剤は化学的にはポリビニルアルキルエーテル類、例えば、ポリビニルメチルエーテル、またはケトン類、例えばベンゾフェノンもしくはエチレンベンゾフェノン、を基にしている。

【0638】

可能な溶媒または希釈剤は特に水であり、適宜1種もしくはそれ以上の上記の有機化学溶媒または希釈剤、乳化剤および分散剤との混合物状であってもよい。

【0639】

大規模な工業的含浸方法、例えば真空、二重真空または圧力法、により木材の特に有効

50

な保護が得られる。

【0640】

調合済み組成物は別の殺昆虫剤およびさらに1種もしくはそれ以上の殺菌・殺カビ剤を、適宜、含んでなることができる。

【0641】

可能な追加の混合相手は、好適には、WO 94/29 268に挙げられている殺昆虫剤および／または殺菌・殺カビ剤である。この文献に挙げられている化合物は本出願の明白な構成部分である。

【0642】

挙げられる特に好ましい混合相手は殺昆虫剤、例えばクロピリフォス (chlorpyrifos)、フォキシム (phoxim)、シラフルフィン (silaflofin)、アルファメスリン (alphamethrin)、シフルスリン (cyfluthrin)、シペルメスリン (cypermethrin)、デルタメスリン (deltamethrin)、ペルメスリン (permethrin)、イミダクロプリド (imidacloprid)、NI-25、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron) およびトリフルムロン (triflumuron)、並びに殺菌・殺カビ剤、例えばエポキシコナゾール (epoxyconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、アザコナゾール (azaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、メトコナゾール (metconazole)、イマザリル (imazalil)、ジクロフルアニド (dichlofluanide)、トリルフルアニド (tolylfluanide)、カルバミン酸3-ヨード-2-プロピニルブチル、N-オクチル-イソチアゾリン-3-オンおよび4, 5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンである。

【実施例】

【0643】

本発明に従う活性化合物の製造および使用を以下の実施例により説明する。

【0644】

実施例

ミズス (Myzus) 試験

溶媒： 1重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃厚物を水で希釈して所望する濃度にする。

【0645】

ピーチ・アフィド (ミズス・ペルシカエ (Myzus persicae)) がたくさん感染しているキャベツの葉 (ブラシカ・オレラセア (Brassica oleracea)) を所望する濃度の活性化合物の調合物中に浸漬することにより処理する。

【0646】

所望する時間の期間後に、死滅率、%を測定する。100%は全てのアブラムシが死滅したことを意味し、0%はアブラムシが死滅しなかったことを意味する。

【0647】

この試験では、例えば、下記の製造実施例の化合物が良好な活性を示す：

【0648】

10

20

30

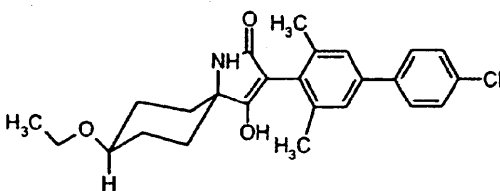
40

【表 8】

表

植物に被害を与える昆虫

ミス試験

活性化合物	活性化合物の濃度、%	6日後の死滅率、%
実施例 I-1-a-4 	0.1	95

10

20

【0649】

実施例

ネフォテティックス (Nephotettix) 試験

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃厚物を水で希釈して所望する濃度にする。

【0650】

イネの実生（オリザ・サティバ (Oryza sativa)）を所望する濃度の活性化合物の調合物中に浸漬することにより処理しそして葉がまだ湿っている間にグリーン・ライス・リーフホッパー（ネフォテティックス・シンクチセプス (Nephotettix cincticeps)）の幼虫を感染させる。

30

【0651】

所望する時間の期間後に、死滅率、%を測定する。100%は全てのヨコバイが死滅したことを意味し、0%はヨコバイが死滅しなかったことを意味する。

【0652】

この試験では、例えば、下記の製造実施例の化合物が良好な活性を示す：

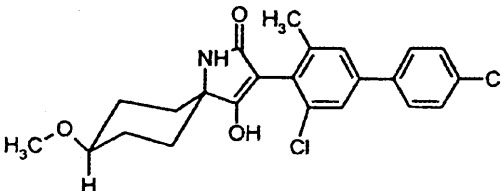
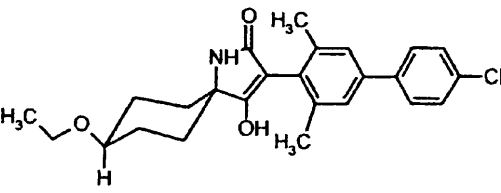
【0653】

【表 9】

表

植物に被害を与える昆虫

初オニックス試験

活性化合物	活性化合物、%	6日後の死滅率、%
実施例 I-1-a-3 	0.1	100
実施例 I-1-a-4 	0.1	100

10

20

【0654】

実施例

フェドン (Phaedon) 幼虫試験

30

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃厚物を水で希釈して所望する濃度にする。

【0655】

キャベツの葉 (ブラシカ・オレラセア (Brassica oleracea)) を所望する濃度の活性化合物の調合物中に浸漬することにより処理しそして葉がまだ湿っている間にマスタード・ビートル (フェドン・コクレアリアエ (Phaedon cochleariae)) の幼虫を感染させる。

【0656】

40

所望する時間の期間後に、死滅率、%を測定する。100%は全てのアブラムシが死滅したことを意味し、0%はアブラムシが死滅しなかったことを意味する。

【0657】

この試験では、例えば、下記の製造実施例の化合物が良好な活性を示す：

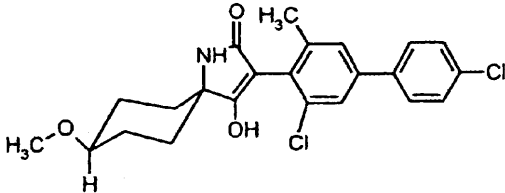
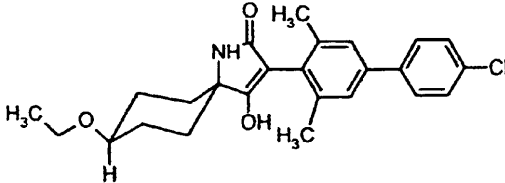
【0658】

【表 10】

表

植物に被害を与える昆虫

フィトン幼虫試験

活性化合物	活性化合物の濃度、%	7日後の死滅率、%
実施例 I-1-a-3 	0.1	100
実施例 I-1-a-4 	0.1	100

【0659】

実施例

発芽後試験

溶媒： 5重量部のアセトン

乳化剤： 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を加え、そして濃厚物を水で希釈して所望する濃度にする。

【0660】

5-15cmの高さを有する試験植物に活性化合物の調合物を1単位面積当たり特定量の所望する活性化合物を適用するような方法で噴霧する。3週間後に、植物に対する被害度を未処理の対照の成長との比較で%被害率で評価する。

【0661】

数字は、

0% = 効果なし（未処理の対照と同様）

100% = 完全死滅

を示す。

発芽後試験／温室

【0662】

【表 1 1】

	gの活性成分/ha	サトウガ`イン (Sugar beet)	カラスミ` (Avena fatua)	エノコグ`サ属 (Setaria)	カラシ属 (Sinapis)
実施例 I-1-a-2	250	20	70	100	70

	gの活性成分/ha	カラスミ` (Avena fatua)	エノコグ`サ属 (Setaria)	アブチロン (Abutilon)	ヒヨ属 (Amaranthus)
実施例 I-1-a-4	250	90	100	80	80

10

【0 6 6 3】

実施例

発芽前試験

溶媒： 5重量部のアセトン

乳化剤： 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適当な調合物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を加え、そして濃厚物を水で希釈して所望する濃度にする。

【0 6 6 4】

植物の種子を普通の土に蒔き、そして24時間後に活性化化合物の調合物を散布する。有利には、単位面積当たりの水の量を一定に保つ。調合物中の活性化化合物濃度は重要でなく、単位面積当たりの活性化化合物適用割合だけが重要である。3週間後に、植物に対する被害度を未処理の対照の成長との比較で%被害率で評価する。

20

【0 6 6 5】

数字は、

0% = 効果なし（未処理の対照と同様）

100% = 完全死滅

を示す。

発芽前試験／温室

【0 6 6 6】

30

【表 1 2】

	gの活性成分/ha	アロペ`ルクルス (Alopecurus)	エノコグ`サ属 (Setaria)	ヒヨ属 (Amaranthus)	ヤエムグ`ウ属 (Galium)
実施例 I-1-a-3	250	100	100	100	90

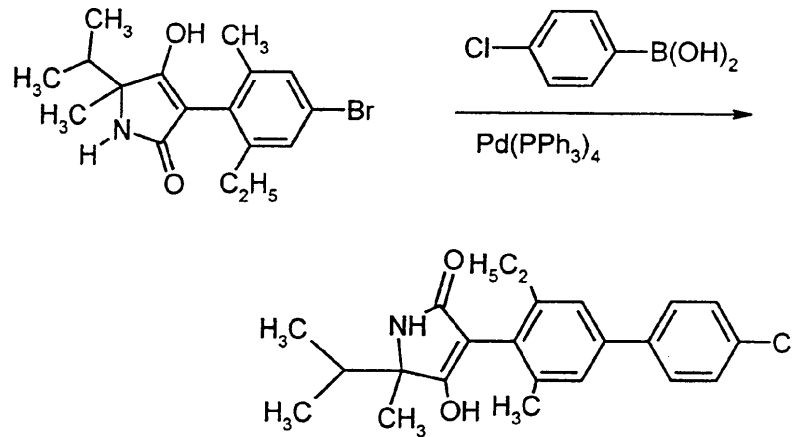
【0 6 6 7】

実施例 I - 1 - a - 1

【0 6 6 8】

40

【化 1 4 0】



10

【0 6 6 9】

アルゴン下で、20 ml の 1, 2-ジメトキシエタン中の WO 97/02243 からの実施例 I-1-a-4 に従う 1.1 g の 3-[(4-ブロモ-2-エチル-6-メチル)-フェニル]-5-イソプロピル-5-メチル-ピロリジン-2, 4-ジオンを 0.6 g の 4-クロロフェニルボロン酸および 180 mg のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムと混合する。混合物を 20℃ で 15 分間攪拌し、15 ml の 20% 強度炭酸ナトリウム水溶液を次に加え、そして混合物を 80℃ で 1 日間攪拌する。混合物を次に濾過し、濾液を水と混合しそして水相を酸性化する。吸引濾過で 0.75 g の生成物を与える(理論値の 65%)。融点: 245℃

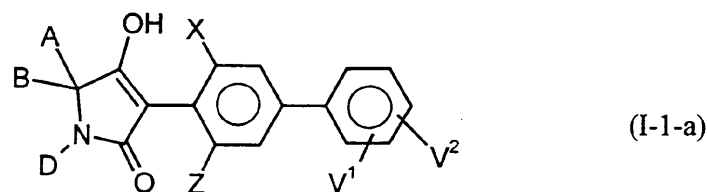
20

【0 6 7 0】

実施例 (I-1-a-1) および (I-1-a-43) の方法により、および/または式 (I-1-a) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (I-1-a) の化合物が得られる:

【0 6 7 1】

【化 1 4 1】



30

【0 6 7 2】

【表 1 3】

実施例 番号	X	Z	V ¹	V ²	D	A	B	融点 °C	異性体
I-1-a-2	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		> 240	β
I-1-a-3	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		211	β
I-1-a-4	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₂ -		>230	β
I-1-a-5	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>240	-
I-1-a-6	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	>240	-
I-1-a-7	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		188	β
I-1-a-8	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		165-167	-
I-1-a-9	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-10	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>240	β
I-1-a-11	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	>240	-
I-1-a-12	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	>240	-
I-1-a-13	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	218	-
I-1-a-14	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₅ -		>240	-
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		135	β
I-1-a-16	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ CHOCH ₃ (CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-17	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>235	-
I-1-a-18	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ CHOC ₂ H ₅ (CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-19	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>245	β
I-1-a-20	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		>245	β
I-1-a-21	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₄ -		H	>240	-
I-1-a-22	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	i-C ₃ H ₇	H	H	>249	-
I-1-a-23	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		148	-
I-1-a-24	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-a-25	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		>250	-
I-1-a-26	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₅ -		>250	-
I-1-a-27	CH ₃	Cl	3-CF ₃	5-CF ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		>250	-
I-1-a-28	CH ₃	Cl	4-CF ₃	H	H	-(CH ₂) ₅ -		>250	-
I-1-a-29	CH ₃	Cl	2-Cl	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		>250	-
I-1-a-30	CH ₃	Cl	3-Cl	5-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		>250	-
I-1-a-31	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>250	-
I-1-a-32	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	3-CF ₃	5-CF ₃	H	-(CH ₂) ₂ CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		242-244	β

【表 1 4】

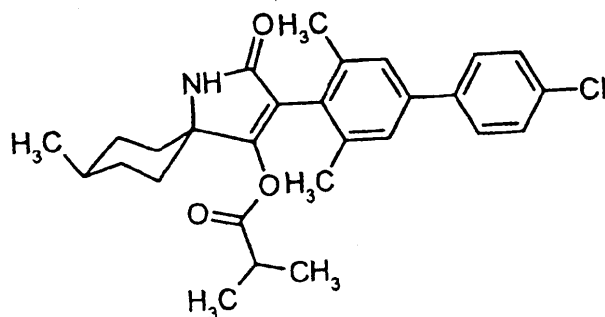
実施例 番号	X	Z	V ¹	V ²	D	A	B	融点℃	異性体
I-1-a-33	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-CF ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>250	β
I-1-a-34	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	Wax	-
I-1-a-35	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	2-Cl	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>250	β
I-1-a-36	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	3-Cl	5-Cl	H	-(CH ₂) ₂ CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>250	β
I-1-a-37	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	115-117	-
I-1-a-38	CH ₃	CH ₃	3-Cl	5-Cl	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	233-234	-
I-1-a-39	C ₂ H ₅	Cl	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	>250	-
I-1-a-40	C ₂ H ₅	Cl	3-Cl	5-Cl	H	CH ₃	CH ₃	125-127	-
I-1-a-41	CH ₃	Cl	4-Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	>250	-
I-1-a-42	CH ₃	Cl	3-CF ₃	5-CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	>250	-
I-1-a-43	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	i-C ₃ H ₇	CH ₃	>250	-
I-1-a-44	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>235	β
I-1-a-45	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-F	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>235	β
I-1-a-46	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		168	β
I-1-a-47	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			β
I-1-a-48	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		238	β
I-1-a-49	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		188	β
I-1-a-50	CH ₃	CH ₃	2-Cl	3-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>235	β

【0674】

実施例 I-1-b-1

【0675】

【化142】



【0676】

最初に0.67ml (4.8ミリモル) のトリエチルアミンをそして次に還流温度において5ml の無水酢酸エチル中の0.5ml (0.005モル) の塩化イソブチルを40ml の無水酢酸エチル中の1.58gの実施例 I-1-a-19の化合物に加える。反応が終了するまで (薄層クロマトグラフィーにより監視される) この温度で攪拌を続ける。混合物を次に濃縮しそして残渣を塩化メチレン中に加え、30ml の0.5N NaOHで2回洗浄し、乾燥しそして濃縮する。残渣をメチルtert-ブチルエーテル (MTB

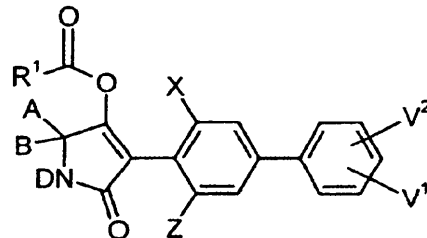
E) / n-ヘキサンから再結晶化させる。収量 1.27 g (理論値の 68%)。融点: > 247 °C。

【0677】

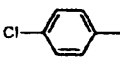
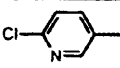
実施例 (I-1-b-1) の方法により、および/または式 (I-1-b) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (I-1-b) の化合物が得られる:

【0678】

【表 15】



(I-1-b)

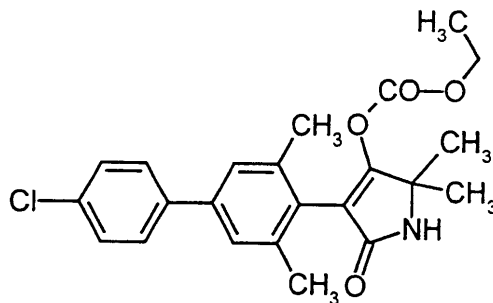
実施例 番号	X	Z	V ¹	V ²	D	A	B	R ¹	融点°C	異性体
I-1-b-2	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	>247	β
I-1-b-3	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇ -	>247	β
I-1-b-4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -			>254	β
I-1-b-5	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇ -	236	β
I-1-b-6	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			>247	β
I-1-b-7	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇ -	238	β

【0679】

実施例 I-1-c-1

【0680】

【化 143】



【0681】

-10 °C ~ 0 °C において、5 ml の塩化メチレン中の 0.15 g のクロロ蟻酸を 30 ml の塩化メチレン中の 0.35 g の実施例 I-1-a-12 の化合物および 0.15 ml のトリエチルアミンに加え、そして混合物を室温で 2 時間攪拌する。反応混合物をシリカゲルを通して塩化メチレン/酢酸エチル 5 : 3 を移動相として用いて濾過し、そして次に濃縮しそして少量の塩化メチレン中に溶解し、そしてヘキサンの添加により生成物を沈澱させる。

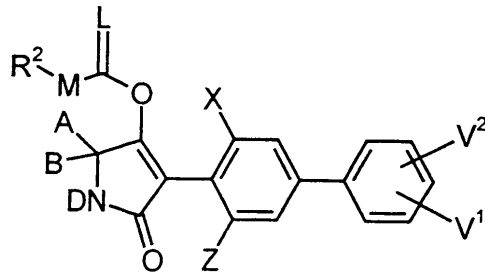
収量 0.23 g (理論値の 56%)。融点: 129 °C。

【0682】

実施例（I-1-c-1）の方法により、および／または式（I-1-c）の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式（I-1-c）の化合物が得られる：

【0683】

【化144】



(I-1-c)

10

【0684】

【表16】

実施 例 番号	X	Z	V ¹	V ²	D	A	B	L	M	R ²	融点 °C	異性体
I-1-c-2	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O	C ₂ H ₅ -	>240	β
I-1-c-3	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		O	O	C ₂ H ₅ -	>240	β
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O	C ₂ H ₅ -	202	β
I-1-c-5	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O	C ₂ H ₅ -	214	β
I-1-c-6	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		248	β
I-1-c-7	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	O		239	β

20

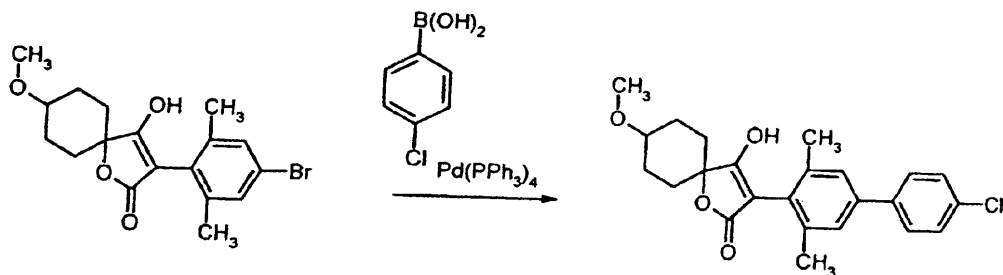
30

【0685】

実施例 I-2-a-1

【0686】

【化145】



40

【0687】

1. 0 g（2.6ミリモル）のWO97/02243からの実施例 I-2-a-15 に従う 3-[(2,6-ジメチル-4-ブromo)-フェニル]-5,5-[(3-メトキシ)-ペンタメチレン]-4-ヒドロキシ- Δ^3 -ジヒドロフラン-2-オンを 20 ml のジエトキシエタン中に懸濁させ、0.5 g（3.2ミリモル）の 4-クロロフェニルボロン酸および 180 mg（0.156ミリモル）のテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムを加えそして混合物を室温で 15 分間攪拌し、その後に 13 ml の 20% 強度

50

炭酸ナトリウム溶液を加え、そして攪拌を 80℃で 24 時間続ける。

【0688】

処理のために、混合物を濃縮し、水性クエン酸および塩化メチレンの間に分配し、乾燥しそして濃縮する。さらなる精製のために、粗製生成物を 1N NaOH および塩化メチレンの間に分配し、水相を酸性化しそして沈澱した生成物を吸引濾過しそして乾燥する。

収量：0.38 g (理論値の 35%) の結晶性固体

融点：215 – 217℃

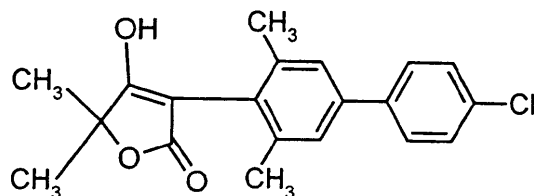
【0689】

実施例 I-2-a-5

【0690】

10

【化146】



【0691】

9.4 ml のカリウム tert-ブトキシドの DMF 中 1 M 溶液を 10 ml の DMF 中の 7.82 ミリモルの実施例 (III-1) の化合物にゆっくり滴下し、そして混合物を室温で一夜攪拌する。溶媒を蒸留除去し、残渣を水中に加えそして希塩酸で酸性化する。混合物をさらに 2 時間攪拌しそして次に吸引濾過する。

20

収量：2.78 g、融点 285 – 287℃。

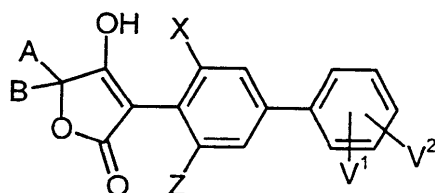
【0692】

実施例 (I-2-a-1) および (I-2-a-5) の方法により、そして (I-2-a) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (I-2-a) の化合物が得られる：

【0693】

【化147】

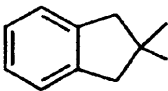
30



(I-2-a)

【0694】

【表 17】

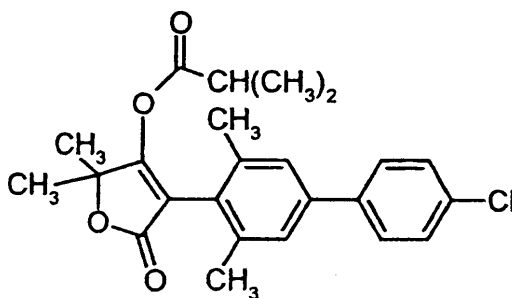
実施例 番号	X	Z	V ¹	V ²	A	B	融点 °C
I-2-a-2	Cl	H	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		223-225
I-2-a-3	CH ₃	Cl	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		157-160
I-2-a-4	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		212-215
I-2-a-5	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃	285-287
I-2-a-6	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_4-$		263-266
I-2-a-7	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_5-$		242-244
I-2-a-8	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		221-223
I-2-a-9	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		249-251
I-2-a-10	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		255-258
I-2-a-11	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		274-276
I-2-a-12	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-CH_2-CHCH_3-O-(CH_2)_2-$		168-170
I-2-a-13	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5(CH_2)_2$		214-217
I-2-a-14	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H			225-228

【0695】

実施例 I-2-b-1

【0696】

【化148】



【0697】

0.32 g のトリエチルアミンおよび次に 0.33 g の塩化イソブチルを 20 ml の塩化メチレン中の 1.03 g の実施例 I-2-a-5 の化合物に加える。混合物を一夜攪拌しそして次に希水性クエン酸および 1 N NaOH と共に振り、そして有機相を乾燥しそして濃縮する。収量 1.16 g。

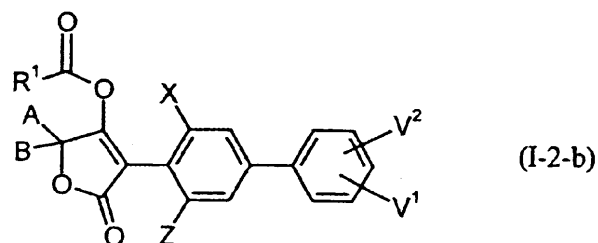
¹H NMR (CDCl₃) : 1.05 ppm (d, 6H)、1.55 ppm (s, 6H)、2.25 ppm (s, 6H)、2.65 ppm (m, 1H)、7.25-7.50 ppm (m, 6H)。

【0698】

実施例 (I-2-b-1)、および／または (I-2-b) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (I-2-b) の化合物が得られる：

【0699】

【表 18】



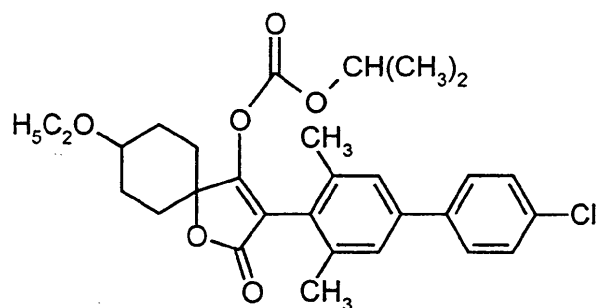
実施例 番号	X	Z	V¹	V²	A	B	R¹	融点 °C
I-2-b-2	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-(CH₂)₄-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-3	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-(CH₂)₅-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-4	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-CH₂-CHCH₃-(CH₂)₃-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-5	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-(CH₂)₂-CHCH₃-(CH₂)₂-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-6	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-CH₂-O-(CH₂)₃-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-7	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-8	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-CH₂-CHCH₃-O-(CH₂)₂-		i-C₃H₇-	油
I-2-b-9	CH₃	CH₃	4-Cl	H	-(CH₂)₂-CHOC₂H₅-(CH₂)₂-		i-C₃H₇-	油

【0700】

実施例 I-2-c-1

【0701】

【化149】



【0702】

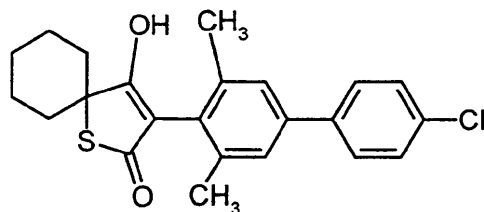
実施例 (I-2-b-1) の方法により、以上で示された化合物が実施例 (1-2-a-13) の化合物およびクロロ蟻酸イソプロピルから出発して得られる。

【0703】

実施例 I-3-a-1

【0704】

【化 1 5 0】



【0 7 0 5】

10

9 ml のトリフルオロ酢酸および 210 ml のトルエン中の 45.0 g (81 ミリモル) の実施例 (I V-1) の化合物を一夜加熱還流する。混合物を濃縮し、そして残渣を 200 ml の MTBE および 600 ml の水の中に加えそして NaOH の添加により pH 14 に調節する。有機相を 1 リットルの 1 N HCl に滴下し、混合物を 2 時間攪拌し、生成物を吸引濾別し、シクロヘキサンで洗浄しそして乾燥する。収量 18.3 g (理論値の 57%) 融点: > 250 °C。

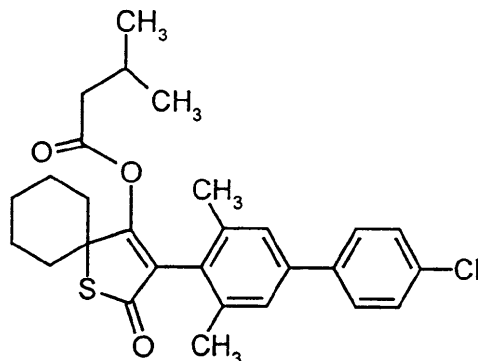
【0 7 0 6】

実施例 I-3-b-1

【0 7 0 7】

【化 1 5 1】

20



30

【0 7 0 8】

氷冷しながら、0.79 ml の塩化イソバレリルの 3 ml の無水塩化メチレン中溶液を 15 ml の塩化メチレン中の 2.0 g の実施例 (I-3-a-1) の化合物および 1.04 ml のトリエチルアミンに滴下し、そして混合物を室温で 2 時間攪拌する。混合物を 10% 強度水性クエン酸で洗浄しそして塩化メチレンで抽出する。有機相を 1 N NaOH で洗浄し、乾燥しそして濃縮する。収量 2.1 g (理論値の 87%) の油。

^1H NMR (400 MHz、CDCl₃): δ = 0.9 / (dd, 6 H, CH/CH₃)₂, 1.4-2.0 (m, 10 H, シクロヘキシル) 2.15 (s, 6 H, 2 × Ar-CH₃), 7.4-7.7 (m, 6 H, Ar-H) ppm。

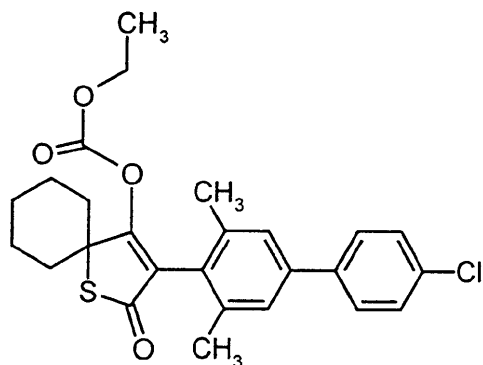
40

【0 7 0 9】

実施例 I-3-c-1

【0 7 1 0】

【化 1 5 2】



10

【0 7 1 1】

実施例（I-3-b-1）の方法により、実施例（I-3-a-1）の化合物をクロロ
蟻酸エチルと反応させることにより以上で示された化合物が得られる。

収量 2.1 g（理論値の 89 %）。融点 167 ~ 170 °C。

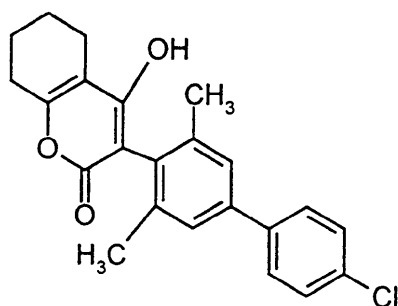
【0 7 1 2】

実施例（I-5-a-1）

【0 7 1 3】

【化 1 5 3】

20



30

【0 7 1 4】

1. 8 g の 4-クロロフェニルボロン酸および 266.3 mg のビス（トリフェニルホ
スフィン）-パラジウム（II）クロリドを 21 ml のジメトキシエタンおよび 18 ml
の 1N Na₂CO₃ 溶液中の 2.6 g の WO97/02243 からの実施例（I-5-
a-1）の化合物に加える。混合物を一夜還流下で攪拌し、希 HCl で酸性化しそして濃
縮する。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにより精製する（移動相シクロヘキサン/
酢酸エチル 4/1 → 2/1）。収量 2.55 g（理論値の 89 %）、融点：> 250 °C。

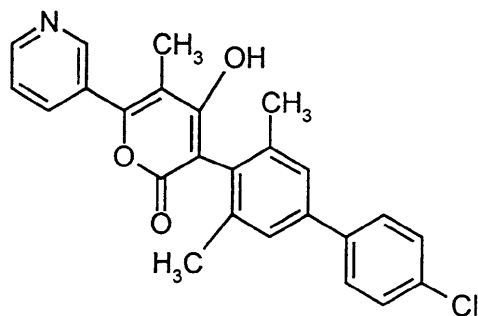
【0 7 1 5】

実施例（I-5-a-2）

【0 7 1 6】

40

【化 1 5 4】



10

【0 7 1 7】

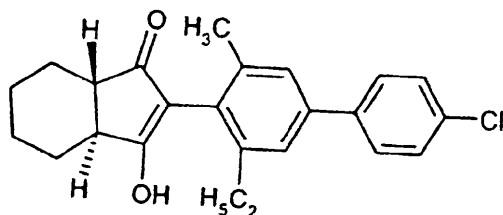
実施例 I-5-a-1 の方法により、WO 97/02243 からの実施例 (I-5-a-6) の化合物から出発して以上で示された化合物が得られる。融点 107-108 °C。

【0 7 1 8】

実施例 I-7-a-1

【0 7 1 9】

【化 1 5 5】



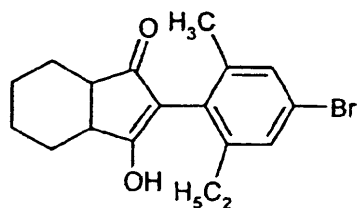
20

【0 7 2 0】

1.5 g (4.3 ミリモル) の式

【0 7 2 1】

【化 1 5 6】



(WO 96/04 283 参照)

30

【0 7 2 2】

の化合物を 10 ml のジメトキシエタン中に溶解しそして 10 ml の 1M Na_2CO_3 溶液と混合する。1.0 g (6.45 ミリモル) の p-クロロフェニルボロン酸および最後に触媒として 254 mg (0.22 ミリモル) の $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (Ph =フェニル) を加える。混合物を一夜加熱還流しそして次に濾過し、そしてフィルターケーキを酢酸エチルですすぐ。濾液を水と混合しそして酢酸エチルおよびメチル tert-ブチルエーテル (MTBE) で各々 3 回抽出する。一緒にした有機相を水および飽和 NaCl 溶液で洗浄し、乾燥しそして濃縮する。

40

粗収量: 1.85 g。

【0 7 2 3】

シクロヘキサン/酢酸エチル 15/1 を用いるシリカゲルカラムクロマトグラフィーで 100 mg の以上で示された化合物を与える。

【0 7 2 4】

シス異性体の回転異性体の 2 種の他の画分 (300 mg および 400 mg) が得られる

50

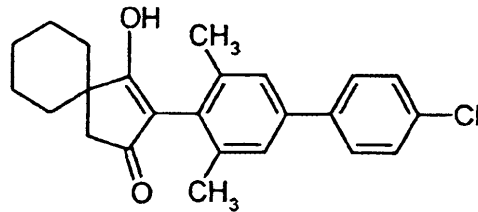
。

【0725】

実施例 I-7-a-2

【0726】

【化157】



10

【0727】

50 ml の無水 DMF 中の 20.5 g の実施例 (X-1) の化合物を 8.44 g のカリウム tert-ブトキシドと混合しそして 80 °C に 1 時間加熱する。氷冷しながら、混合物を 2 リットルの 1 N HCl にゆっくり加える。混合物を塩化メチレンで抽出しそして抽出物を乾燥しそして濃縮する。収量 18 g (理論値の 95%)、融点: 192-195 °C。

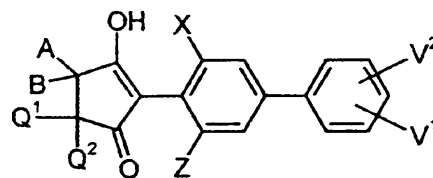
【0728】

実施例 (I-7-a-1) および (I-7-a-2) の方法により、および/または式 (I-7-a) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (I-7-a) の化合物が得られる:

20

【0729】

【表19】



30

実施例番号	X	Z	V ¹	V ²	B	A	Q ¹	Q ²	融点 °C
I-7-a-3	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H		-(CH ₂) ₅	H	H	>250
I-7-a-4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	>250
I-7-a-5	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	211-213
I-7-a-6	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H		-(CH ₂) ₃ -CHCH ₃ -CH ₂ -	H	H	243-244
I-7-a-7	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H		-(CH ₂) ₃ -CHCH ₃ -CH ₂ -	H	H	ワックス

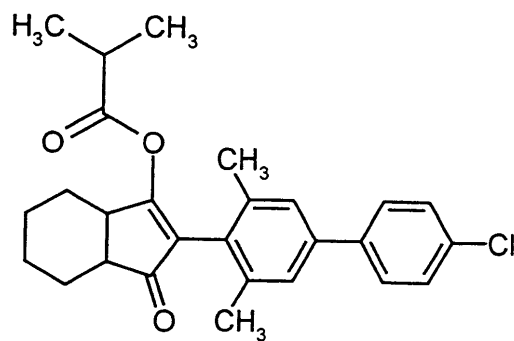
40

【0730】

実施例 I-7-b-1

【0731】

【化 1 5 8】



10

【0 7 3 2】

実施例（I-3-b-1）の方法により、式（I-7-a-1）の化合物を塩化イソブチリルと反応させることにより以上で示された化合物が得られる。融点：油。

^1H NMR（400 MHz、DMSO）： $\delta = 0.9 - 1.0$ （d, 6 H, $\text{HC}-\text{CH}_3$ ）、 $1.2 - 2.0$ （m, 8 H, シクロヘキシル-H）、 $2.1 - 2.15$ （s, 6 H, $2 \times \text{ArCH}_3$ ）、 2.65 （m, 1 H, CHCH_3 ）、 7.4 （s, 2 H, $\text{Ar}-\text{H}$ ）、 $7.5 - 7.7$ （d, 4 H, $\text{Ar}-\text{H}$ ） ppm。

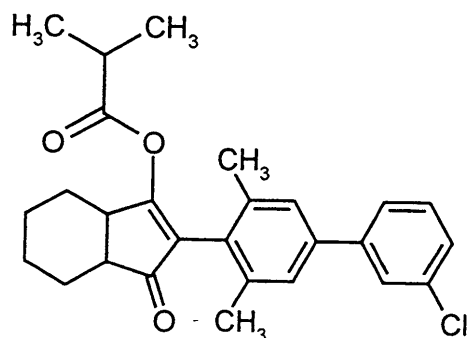
【0 7 3 3】

実施例 I-7-b-2

20

【0 7 3 4】

【化 1 5 9】



30

【0 7 3 5】

実施例（I-3-b-1）の方法により、実施例（I-7-a-5）の化合物を塩化イソブチリルと反応させることにより以上で示された化合物が油状で得られる。

^1H NMR（400 MHz、DMSO）： $\delta = 1 - 1.1$ （d, 6 H, $\text{CH}-\text{CH}_3$ ）、 $4.2 - 4.4$ （m, 8 H, シクロヘキシル-H）、 $2.15 - 2.2$ （s, 6 H, $2 \times \text{ArCH}_3$ ）、 2.6 （m, 1 H, $\text{CH}-\text{CH}_3$ ）、 $2.9 - 3.4$ （m, 2 H, シクロヘキシル C-H）、 $7.3 - 7.6$ （m, 6 H, $\text{Ar}-\text{H}$ ） ppm。

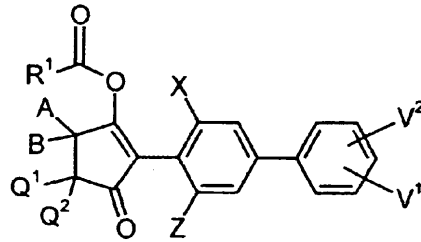
【0 7 3 6】

40

実施例（I-7-b-1）の方法により、および／または式（I-7-b）の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式（I-7-b）の化合物が得られる：

【0 7 3 7】

【表 20】



実施例番号	X	Z	V ¹	V ²	B	A	Q ¹	Q ²	R ¹	融点℃
I-7-b-3	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H		-(CH ₂) ₅ -	H	H	i-C ₄ H ₉	油

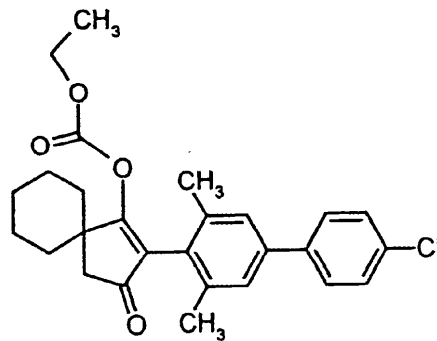
10

【0738】

実施例 I-7-c-1

【0739】

【化160】



20

【0740】

実施例 (I-3-b-1) の方法により、実施例 (I-7-a-2) の化合物をクロロ
 蟻酸エチルと反応させることにより以上で示された化合物がワックス状で得られる。

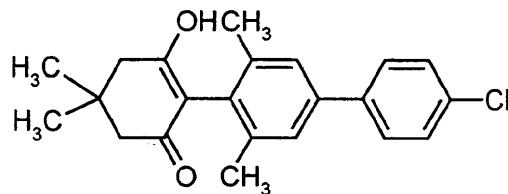
30

【0741】

実施例 I-8-a-1

【0742】

【化161】



40

【0743】

6.0 g の実施例 (XI-1) の化合物を最初に 20 ml の DMF 中に充填し、2.63 g のカリウム *tert*-ブトキシドと混合しそして 80℃ に 1 時間加熱する。氷冷しながら、混合物を次に 1 リットルの 1 N HCl にゆっくり加え、そして生成物を吸引濾別しそして乾燥する。収量 5.15 g (理論値の 93%)。融点 222-224℃。

【0744】

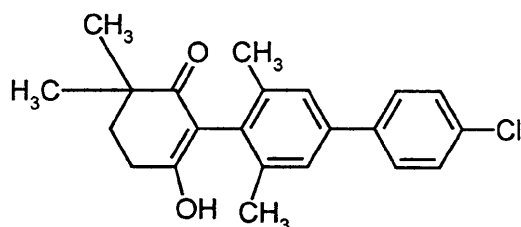
実施例 I-8-a-2

実施例 (I-8-a-1) の方法により、融点 117-122℃ の

【0745】

50

【化 1 6 2】



【 0 7 4 6 】

10

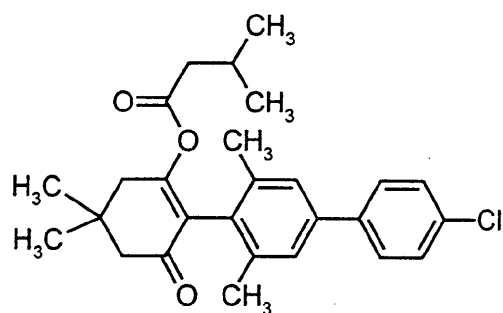
が得られる。

【 0 7 4 7 】

実施例 I - 8 - b - 1

【 0 7 4 8 】

【化 1 6 3】



20

【 0 7 4 9 】

実施例 (I - 3 - b - 1) の方法により、実施例 (I - 8 - a - 1) の化合物を塩化イソバレリルと反応させることにより以上で示された化合物が油状で得られる。

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : $\delta = 0.55$ (d, 6 H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$)、 1.2 (s, 6 H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$)、 1.6 (m, 1 H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$)、 2.1 (s, 6 H, $2 \times \text{Ar}-\text{CH}_3$)、 $7.3-7.65$ (m, 6 H, Ar-H) ppm。

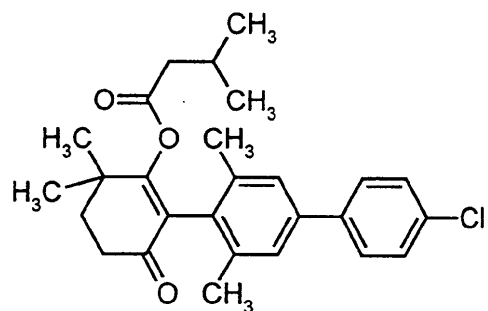
30

【 0 7 5 0 】

実施例 I - 8 - b - 2

【 0 7 5 1 】

【化 1 6 4】



40

【 0 7 5 2 】

実施例 (I - 3 - b - 1) の方法により、実施例 (I - 8 - a - 2) の化合物を塩化イソバレリルと反応させることにより以上で示された化合物が油状で得られる。

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : $\delta = 0.55$ (d, 6 H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$)、 1.2 (s, 6 H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$)、 1.6 (m, 1 H, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$)、 2.0 ; 2.7 (t, $2 \times \text{H}$, CH_2-CH_2)、 2.05 (s, 6 H, $2 \times \text{Ar}-\text{CH}_3$)

50

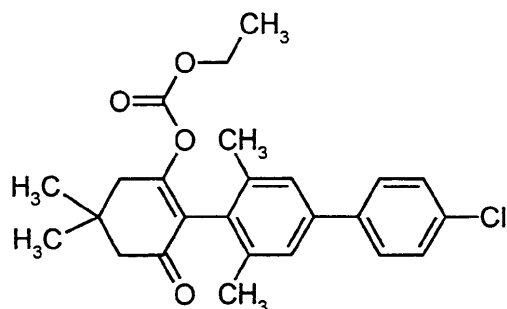
3)、7.3-7.65 (m, 6H, Ar-H) ppm。

【0753】

実施例 I-8-c-1

【0754】

【化165】



10

【0755】

実施例 (I-3-b-1) の方法により、実施例 (I-8-a-1) の化合物をクロロ蟻酸エチルと反応させることにより以上で示された化合物がワックス様物質として得られる。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): $\delta = 1.05$ (t, 3H, CH_2CH_3), 1.2 (s, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 2.1 (s, 6H, $2 \times \text{Ar-CH}_3$), 2.45; 2.7 (s, $2 \times 2\text{H}$, CH_2), 4.1 (q, 2H, $\text{CH}_2\text{-CH}_3$), 7.35-7.7 (m, 6H, Ar-H) ppm。

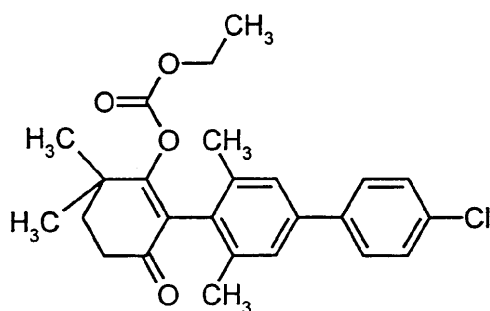
20

【0756】

実施例 I-8-c-2

【0757】

【化166】



30

【0758】

実施例 I-3-b-1 の方法により、実施例 (I-8-a-2) の化合物をクロロ蟻酸エチルと反応させることにより以上で示された化合物がワックス様物質として得られる。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): $\delta = 1.05$ (t, 3H, CH_2CH_3), 1.15 (s, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 2.0; 2.7 (t, $2 \times 2\text{H}$, $\text{CH}_2\text{-CH}_2$), 2.05 (s, 6H, Qx, Ar- CH_3), 4.05 (q, 2H, $\text{CH}_2\text{-CH}_3$) 7.3-7.7 (m, 6H, Ar-H) ppm。

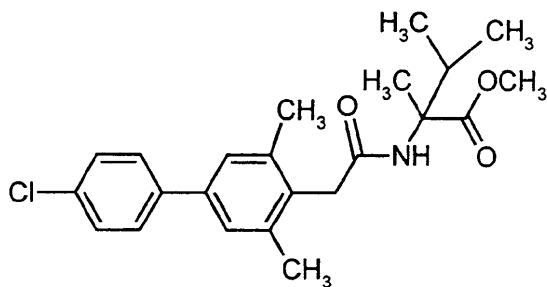
40

【0759】

実施例 II-1

【0760】

【化 1 6 7】



10

【0 7 6 1】

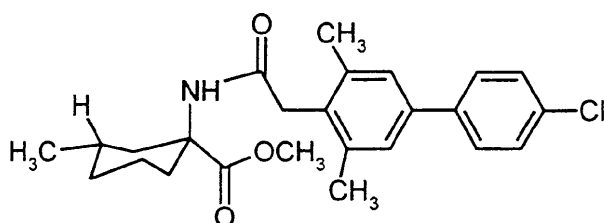
30～40℃の温度で、80mlの塩化メチレン中の7.75gの実施例XXIX-1の化合物を10.3gの濃硫酸に滴下し、そして混合物をこの温度で2時間攪拌する。14mlのメタノールを次に滴下し、そして混合物を70℃でさらに6時間攪拌する。混合物を次に110gの水上に注ぎそして塩化メチレンで抽出し、そして有機相をNaHCO₃水溶液で洗浄し、乾燥しそして濃縮する。残渣をMTBE/n-ヘキサンから再結晶化させそして次にシリカゲルクロマトグラフィー（移動相塩化メチレン／酢酸エチル5／3）により精製する。収量4.24g（理論値の50％）。融点：142℃。

実施例II-2

【0 7 6 2】

20

【化 1 6 8】



【0 7 6 3】

30

5～10℃で、10mlのアセトニトリル中の5.86gの実施例（XXIV-1）に従う2,6-ジメチル-4-(4-クロロフェニル)-フェニルアセチルクロリドを20mlのアセトニトリル中の4.57gの3-メチル-1-アミノシクロヘキサンカルボン酸メチル×塩酸塩および10gの粉碎K₂CO₃に滴下し、そして混合物を室温で3時間攪拌する。混合物を200mlの水水中に加え、乾燥しそして濃縮する。残渣をMTBE/n-ヘキサンから再結晶化させる。収量7.12g（理論値の83％）、融点：169℃。

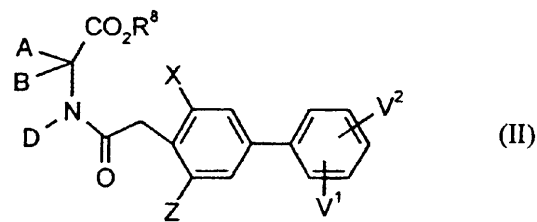
【0 7 6 4】

実施例（II-1）および（II-2）の方法により、および／または式（II）の化合物を製造するための一般的な方法に従い、下記の式（II）の化合物が得られる：

40

【0 7 6 5】

【表 2 1】



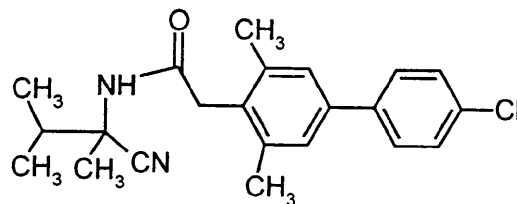
実施 例 番号	X	Z	V ¹	V ²	D	A	B	R ⁸	融点 °C	異 性 体
II-3	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	88	B
II-4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	127	B
II-5	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	75	B
II-6	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	179	-
II-7	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -OCHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	146	B
II-8	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	167	B
II-9	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	159	B
II-10	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-F	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	138	B
II-11	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	71	B
II-12	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	133	B
II-13	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	156	B
II-14	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	169	B
II-15	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	125	B
II-16	CH ₃	CH ₃	2-Cl	3-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	127	B
II-17	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₄ -		H	C ₂ H ₅	油	-
II-18	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂ -		H	C ₂ H ₅	81	-
II-19	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	i-C ₃ H ₇	H	H	C ₂ H ₅	119	-

【0766】

実施例 X X I X - 1

【0767】

【化169】



【0768】

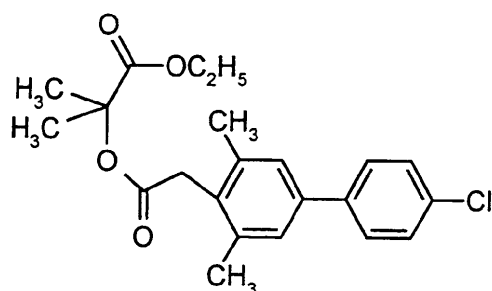
5-10℃で、15mlのアセトニトリル中の8.79gの2,6-ジメチル-4-(4-クロロフェニル)-フェニルアセチルクロリドを30mlのアセトニトリル中の3.7gの2-アミノ-2,3-ジメチルブチロニトリルおよび13.8gの粉砕K₂CO₃に加え、そして混合物を室温で3時間攪拌する。混合物を250mlの水水中に注ぎそして吸引濾別し、そして残渣を水で洗浄する。残渣を塩化メチレン中に加え、そして溶液を乾燥しそして濃縮する。生成物を引き続きシリカゲルクロマトグラフィー（移動相n-ヘキサン/酢酸エチル3/1）により精製する。収量8.24g（理論値の74%）、融点180℃。

【0769】

実施例 (I I I - 1)

【0770】

【化170】



10

【0771】

2. 29 g の実施例 (X X I V - 1) の化合物および 1. 03 g のヒドロキシイソ酪酸エチルの混合物を 140 °C に一夜加熱する。

GC/MS : m/e = 115 (8%), 179 (34%), 229 (100%), 256 (12%), 388 (20%)。

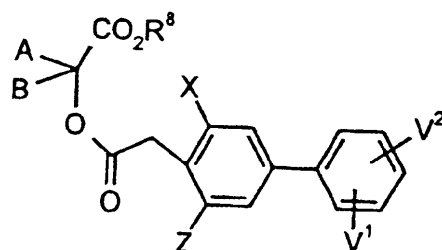
【0772】

実施例 (I I I - 1) の方法により、および／または式 (I I I) の化合物を製造するための一般的な方法に従い、下記の式 (I I I) の化合物が得られる：

20

【0773】

【化171】

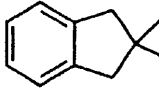


(III)

30

【0774】

【表 2 2】

実施 例 番号	X	Z	V ¹	V ²	A	B	R ⁸	融点 °C
III-2	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₄ -		C ₂ H ₅	油*
III-3	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₅ -		C ₂ H ₅	油*
III-4	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	油*
III-5	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	油*
III-6	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	油*
III-7	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	油*
III-8	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHCH ₃ -O-(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	油*
III-9	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	油*
III-10	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H			C ₂ H ₅	油*

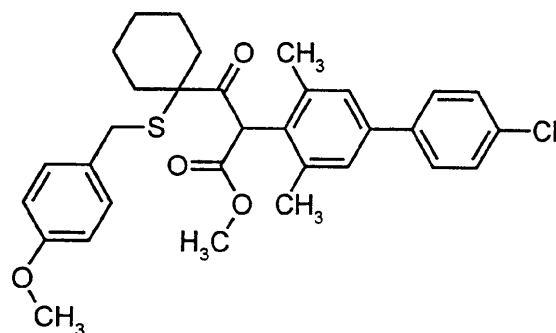
* 同定はGC/MSを用いて行われそして粗製生成物は式(1-2-a)の化合物を製造するために直接使用された。

【0775】

実施例(IV-1)

【0776】

【化172】

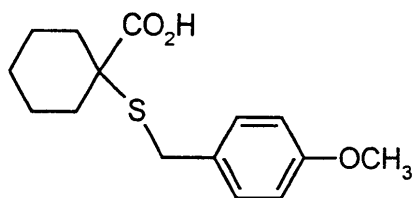


【0777】

A: 15.0 g の化合物、

【0778】

【化 1 7 3】



【0 7 7 9】

9. 63 g の塩化チオニルおよび 1 滴の DMF を室温で 5 分間攪拌しそして次に気体の発生が止むまで 100℃で攪拌する。混合物を次に濃縮しそして高真空下で乾燥する。

10

B: 0℃で、25.3 g の実施例 (XXXII-1) の化合物を 100 ml の無水テトラヒドロフラン (THF) 中の 45.8 ml (96.3 ミリモル) のリチウムジイソプロピルアミン (LDA) 溶液に滴下し、そして混合物をこの温度で 30 分間攪拌する。A に従い得られたアシルクロリドを次に 30 ml の THF に滴下し、冷却を停止しそして混合物をさらに 1 時間攪拌する。300 ml の MTBE および数滴の水を加えそして混合物を各回毎に 300 ml の 10% 塩化アンモニウム水溶液で 2 回洗浄し、乾燥しそして濃縮する。収量 45 g (理論値の 100%) の油。

^1H NMR (CDCl₃, 400 MHz): δ = 1.5–2.0 (m, 10 H, シクロヘキシル)、2.4 (s, 6 H, 2 × Ar-CH₃)、3.1; 3.3 (d, 2 H, S-CH₂)、3.6; 3.7 (s, 2 × 3 H, 2 × OCH₃)、6.8–7.7 (m, 10 H, Ar-H) ppm。

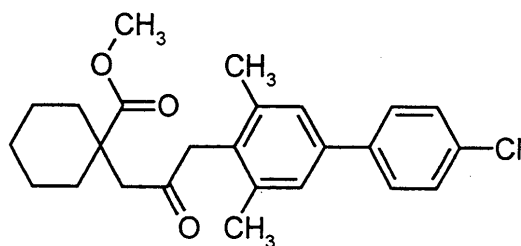
20

【0 7 8 0】

実施例 X-1

【0 7 8 1】

【化 1 7 4】



30

【0 7 8 2】

70.0 g の実施例 (XXXVII-1) の化合物、24.05 g の炭酸カリウムおよび 400 ml のアセトン中の 74.4 g のヨウ化メチルを還流下で 16 時間攪拌する。混合物を濾過しそして濾液を濃縮する。残渣をシリカゲル上でクロマトグラフィーにかける (移動相塩化メチレン/石油エーテル 4/1)。収量 20.5 g (理論値の 41%) の油。

40

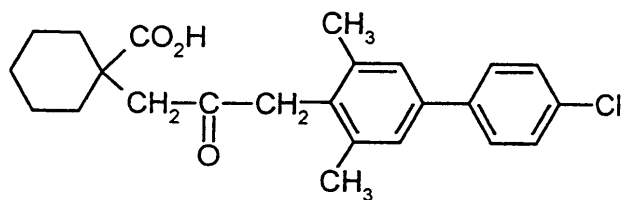
^1H NMR (CDCl₃, 400 MHz): δ = 1.3–1.8 (m, 10 H, シクロヘキシル)、2.2 (s, 6 H, 2 × Ar-CH₃)、2.95 (s, 2 H, CH₂CO)、3.55 (s, 3 H, OCH₃)、3.85 (s, 2 H, Ar-CH₂)、7.3–7.65 (m, 6 H, Ar-H) ppm。

【0 7 8 3】

実施例 (XXXVII-1)

【0 7 8 4】

【化 1 7 5】

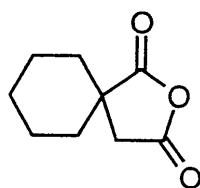


【0 7 8 5】

−15℃で、51.9 gの実施例 (X X X I I − 1) の80 mlのTHF中溶液を100 mlのLDA (2モル) の溶液および200 mlのTHFに滴下し、そして混合物を引き続き0℃で1時間攪拌する。−15℃で、20.2 gの化合物

【0 7 8 6】

【化 1 7 6】



【0 7 8 7】

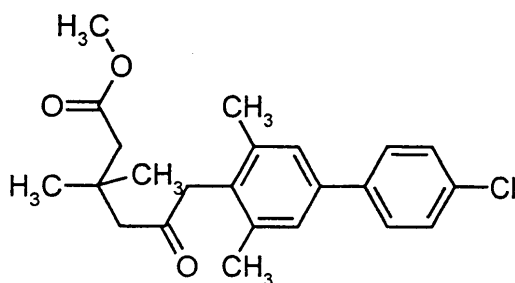
の30 mlのTHF中溶液を次に滴下する。混合物を室温で2時間攪拌し、300 mlの水および80 gの塩化アンモニウムを加え、そして混合物を濃HClで酸性化する。混合物をエーテルで抽出しそしてエーテル相を濃縮する。残渣を還流下で200 gのKOHおよび660 mlの水と共に2日間沸騰させる。冷却後に、混合物を濃HClで酸性化しそしてエーテルで抽出する。濃縮後に残る粗製の油状生成物をさらなる精製なしにさらに反応させる。収量70 g (理論値の100%)。

【0 7 8 8】

実施例 (X I − 1)

【0 7 8 9】

【化 1 7 7】



【0 7 9 0】

36 gの実施例 (X L I I − 1) の化合物、13.2 gの炭酸カリウムおよび200 mlのアセトン中の40.8 gのヨウ化メチルを還流下で16時間沸騰させる。混合物を濾過し、濾液を濃縮しそして残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (移動相塩化メチレン/石油エーテル2/1) により精製する。収量12 g (理論値の52%)、油。

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : δ = 1.05 (s, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$)、2.2 (s, 6H, $2 \times \text{Ar}-\text{CH}_3$)、2.4 : 2.7 (s, $2 \times 2\text{H}$, $\text{CO}-\text{CH}_2$)、3.6 (s, 3H, OCH_3)、3.85 (s, 2H, $\text{Ar}-\text{CH}_2$)、7.3–7.65 (m, 6H, $\text{Ar}-\text{H}$) ppm。

【0 7 9 1】

10

20

30

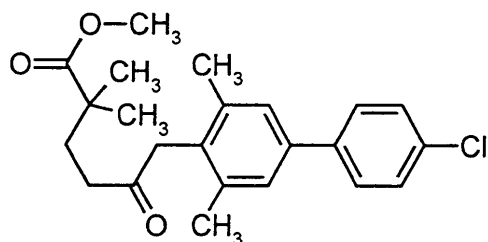
40

50

実施例 (X I - 2)

【0792】

【化178】



10

【0793】

実施例 (X I - 1) の方法により、以上で示された化合物が同様に油状で得られる。

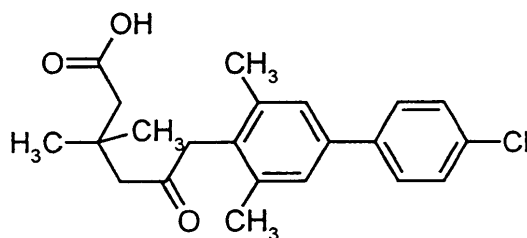
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): $\delta = 1.1$ (s, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$)、 1.75 、 2.55 (t, $2 \times 2\text{H} \times \text{CH}_2\text{CH}_2$)、 2.2 (s, 6H, $2 \times \text{Ar}-\text{CH}_3$)、 3.6 (s, 3H, OCH_3)、 3.9 (s, 2H, ArCH_2)、 7.3 – 7.7 (m, 6H, $\text{Ar}-\text{H}$) ppm。

【0794】

実施例 (X L I I - 1)

【0795】

【化179】



20

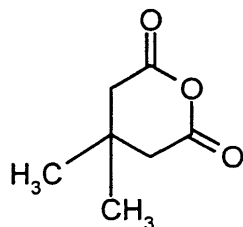
【0796】

-15°C で、 27 g の実施例 (X X X I I - 1) の化合物の 30 ml の THF 中溶液を 100 ml の THF 中の 50 ml の LDA (2 モル) の溶液に滴下しそして混合物を 0°C で1時間攪拌する。 -15°C で、 8.6 g の化合物

30

【0797】

【化180】



40

【0798】

の 20 ml の THF 中溶液を次に滴下する。混合物を室温で2時間攪拌し、その後に 150 ml の水および 40 g の塩化アンモニウムを加え、そして混合物を濃 HCl で酸性化する。混合物をエーテルで抽出しそしてエーテル相を濃縮する。残渣を還流下で 100 g の KOH および 330 ml の水と共に2日間沸騰させる。冷却後に、混合物を濃 HCl で酸性化しそしてエーテルで抽出する。濃縮後に残る粗製生成物 (36 g) をさらなる精製なしにさらに反応させる。

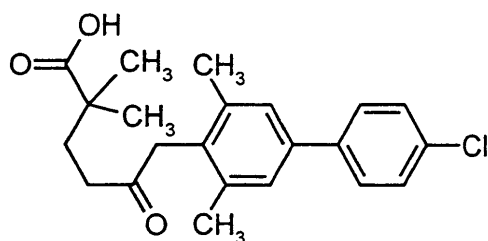
50

【0799】

実施例 (L X I I - 2)

【0800】

【化181】



10

【0801】

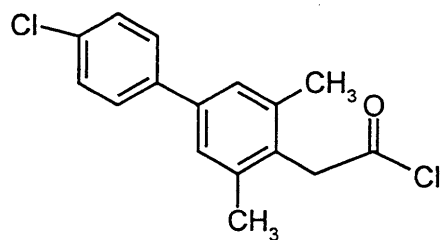
実施例 (L X I I - 1) の方法により、以上で示された化合物が得られる。

【0802】

実施例 X X I V - 1

【0803】

【化182】



20

【0804】

69 g の実施例 X X V I I - 1 の酸を 55 ml の塩化チオニルと共に 70 °C で気体の発生が止むまで加熱する。

【0805】

過剰の塩化チオニルを引き続き減圧下で除去する。収量 54.9 g (理論値の 74%)、融点: 102 °C。

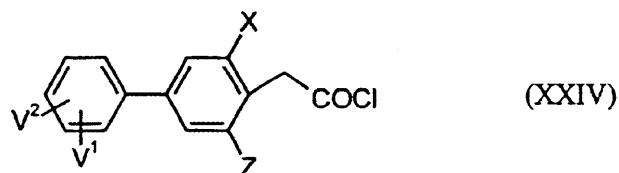
【0806】

実施例 (X X I V - 1) の方法により、および／または式 (X X I V) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (X X I V) の化合物が得られる。

【0807】

30

【表 2 3】



実施例番号	X	Z	V ¹	V ²	融点 °C
XXIV-2	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	*
XXIV-3	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	*
XXIV-4	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	*
XXIV-5	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-F	*
XXIV-6	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	*
XXIV-7	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	3-CH ₃	*
XXIV-8	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃	H	*
XXIV-9	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	*
XXIV-10	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	*
XXIV-11	CH ₃	CH ₃	2-Cl	3-Cl	*

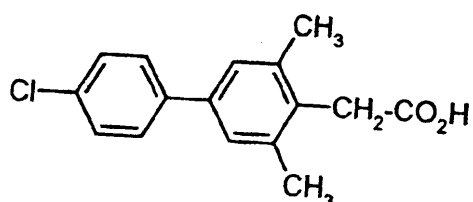
* アシルクロリド類はさらなる精製なしに式 (II) の化合物の合成用に使用された。

【0808】

実施例 (XXVII-1)

【0809】

【化183】



【0810】

室温で、6 g の実施例 (XXXVII-1) の化合物、1.2 g の水酸化リチウム、20 ml のエタノール、100 ml の水および100 ml のTHFを一夜攪拌する。THFを減圧下で除去し、そして残っている水溶液を塩化メチレンで繰り返し抽出する。水相を濃HClで酸性化しそして沈澱した生成物を吸引濾別する。

収量 5 g (理論値の96%)、融点 205 °C。

【0811】

実施例 (XXVII-1) の方法により、および／または式 (XXVII) の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式 (XXVII) の化合物が得られる：

【0812】

10

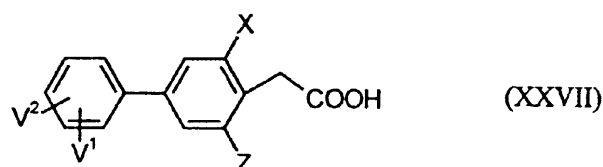
20

30

40

50

【表 2 4】



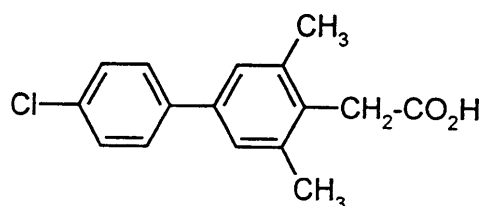
実施例番号	X	Z	V ¹	V ²	融点 °C
XXVII-2	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	143
XXVII-3	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	129
XXVII-4	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	154
XXVII-5	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-F	120
XXVII-6	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	141
XXVII-7	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	3-CH ₃	155
XXVII-8	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃	H	151
XXVII-9	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	173
XXVII-10	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	166
XXVII-11	CH ₃	CH ₃	2-Cl	3-Cl	158

【0813】

実施例 (XXXII-1)

【0814】

【化184】



【0815】

30 g の実施例 (XLV-1) の化合物を還流下で 1000 ml のメタノール中の 19 . 8 g の 88 % 強度 KOH と共に還流下で一夜沸騰させる。冷却後に、混合物を 20 ml の濃硫酸と混合しそして還流下で 1 時間沸騰させる。固体を吸引濾別しそしてメタノールで洗浄する。濾液中のメタノールを減圧下で除去し、そして残渣を水と混合しそして塩化メチレンで抽出する。有機相を乾燥しそして濃縮する。収量 1 g (理論値の 10 %)、油。

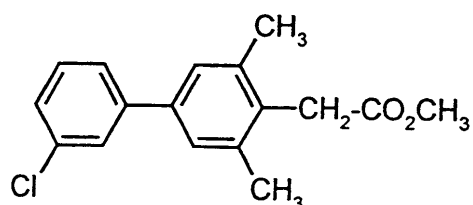
¹H NMR (400 MHz、CDCl₃) : δ = 2.38 (s, 6H, Ar-CH₃)、3.70 (s, 3H, OCH₃)、3.73 (s, 2H, CH₂)、7.23 (s, 2H, ArH)、7.36-7.39 (AA', BB', 2H, ArH)、7.48-7.51 (AA', BB', 2H, Ar-H) ppm。

【0816】

実施例 (XXXII-2)

【0817】

【化 1 8 5】



【0 8 1 8】

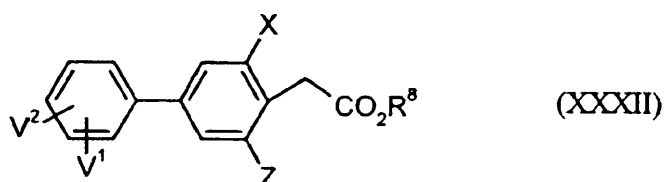
アルゴン下で、6.1 g の 3-クロロフェニルホウ素酸、0.15 g のビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリドおよび 65 ml の 1M Na_2CO_3 溶液を 85 ml のジメトキシエタン中の 7.68 g の 4-ブロモ-2,6-ジメチルフェニル酢酸メチルに加え、そして混合物を還流下で一晩攪拌する。混合物を水で希釈しそして酢酸エチルで抽出する。有機相を塩化アンモニウム溶液、水および飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、乾燥しそして濃縮する。収量 4.3 g（理論値の 36%）、融点：56℃。

【0 8 1 9】

実施例（XXXII-1）および（XXXII-2）の方法により、および／または式（XXXII）の化合物を製造するための一般的工程に従い、下記の式（XXXII）の化合物が得られる：

【0 8 2 0】

【表 2 5】



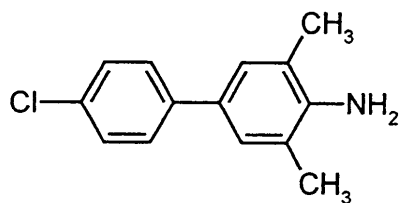
実施例番号	X	Z	V ¹	V ²	R ⁸	融点 °C
XXXII-2	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	CH ₃	56
XXXII-3	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	CH ₃	油
XXXII-4	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H	CH ₃	137
XXXII-5	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-F	CH ₃	油
XXXII-6	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	5-CH ₃	CH ₃	油
XXXII-7	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	3-CH ₃	CH ₃	油
XXXII-8	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃	H	CH ₃	85
XXXII-9	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	CH ₃	油
XXXII-10	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	CH ₃	油
XXXII-11	CH ₃	CH ₃	2-Cl	3-Cl	CH ₃	油

【0 8 2 1】

実施例 XLV I - 1

【0 8 2 2】

【化 1 8 6】



【0 8 2 3】

48. 8 ml の 1 M Na_2CO_3 溶液および 65 ml のジメトキシエタン中の 5 g の 4-ブロモ-2,6-ジメチルアニリン、3.88 g の 4-クロロフェニルホウ素酸および 0.11 g のビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリドを還流下で一夜加熱する。混合物を水と混合しそして酢酸エチルで抽出する。有機相を塩化アンモニウム溶液、水および飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、乾燥しそして濃縮する。収量 4 g (理論値の 77%)、融点：96 °C。

10

フロントページの続き

- (72)発明者 ライナー・フィシャー
ドイツ・デー－４０７８９モンハイム・ネリーーザクスーシュトラッセ２３
- (72)発明者 アラン・グラフ
ドイツ・デー－５１０６１ケルン・ゲルステンカンフ１９
- (72)発明者 ウド・シュナイダー
ドイツ・デー－５１３７３レーフェルクーゼン・モルトケシュトラッセ１２
- (72)発明者 トマス・プレチュナイダー
ドイツ・デー－５３７９７ローマー・タルシュトラッセ２９ベー
- (72)発明者 クリストフ・エルデレン
ドイツ・デー－４２７９９ライヒリンゲン・ウンテルビュシャーホフ１５
- (72)発明者 ボルフラム・アンデルシュ
ドイツ・デー－５１４６９ベルギツシュグラートバツハ・シュロツダーデイヒヤーベーク７７
- (72)発明者 マークービルヘルム・ドリューズ
ドイツ・デー－４０７６４ランゲンフェルト・ゲーテシュトラッセ３８
- (72)発明者 マルクス・ドリンガー
アメリカ合衆国カンザス州６６２１３オーバーランドパーク・ノックス１３２１０
- (72)発明者 インゴ・ベトコロウスキ
ブラジル・エスピー・シーイーピーー１３２８０－０００ビンヘッド・コンドエスタンシアマラムバ
イア・ルアアバレ５００
- (72)発明者 ランデイ・アレン・マイヤース
ドイツ・デー－４０４８９デュツセルドルフ・ヘルトルフアーマルク４７

審査官 前田 憲彦

- (56)参考文献 仏国医薬特別特許第５７３７（FR, M）
特開昭６１－０７８７６５（JP, A）
特開昭５６－１２５３３３（JP, A）
特開昭５０－１０８２５６（JP, A）
特開昭６２－１２９２４３（JP, A）
特開昭５６－１２５３３９（JP, A）
特開昭５３－０５０１６１（JP, A）
特開昭５２－１３９０５５（JP, A）
特開昭５２－１２２３６７（JP, A）
特開昭４８－０８６８６３（JP, A）
スイス国特許発明第００５８９５９５（CH, A５）
Endocrinology, １９６５年, 76(1), p.115-121

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C 07 C 57/00
C 07 C 69/00
CAplus/REGISTRY (STN)