

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7277445号
(P7277445)

(45)発行日 令和5年5月19日(2023.5.19)

(24)登録日 令和5年5月10日(2023.5.10)

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 N 47/02 (2006.01)

A 0 1 N 47/02

A 0 1 M 1/20 (2006.01)

A 0 1 M 1/20

A

A 0 1 N 43/40 (2006.01)

A 0 1 N 43/40

1 0 1 C

A 0 1 P 7/02 (2006.01)

A 0 1 P 7/02

A 0 1 P 7/04 (2006.01)

A 0 1 P 7/04

請求項の数 11 (全129頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2020-516756(P2020-516756)

(86)(22)出願日 平成30年9月19日(2018.9.19)

(65)公表番号 特表2020-534334(P2020-534334
A)

(43)公表日 令和2年11月26日(2020.11.26)

(86)国際出願番号 PCT/JP2018/036162

(87)国際公開番号 WO2019/059412

(87)国際公開日 平成31年3月28日(2019.3.28)

審査請求日 令和3年6月4日(2021.6.4)

(31)優先権主張番号 特願2017-179947(P2017-179947)

(32)優先日 平成29年9月20日(2017.9.20)

(33)優先権主張国・地域又は機関

日本国(JP)

前置審査

(73)特許権者 303020956

三井化学クロップ&ライフソリューション株式会社

東京都中央区日本橋一丁目19番1号

(74)代理人 110001519

弁理士法人太陽国際特許事務所

(72)発明者 青木 要治

千葉県茂原市東郷1144 三井化学ア
グロ株式会社内

(72)発明者 番場 伸一

千葉県茂原市東郷1144 三井化学ア
グロ株式会社内

(72)発明者 マルクス・ベルガー

ドイツ連邦共和国 12167 ベルリン
アルプレヒトシュトラッセ83番

最終頁に続く

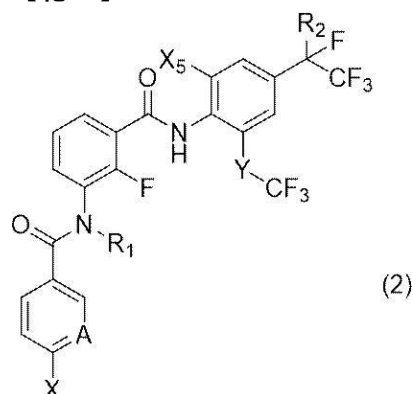
(54)【発明の名称】 動物用外部寄生虫長期防除剤

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(2)で表される化合物を含む動物用外部寄生虫防除剤：

【化1】



式中、

R₁は水素原子又はC₁－C₄アルキル基を表し、R₂はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

Xはフッ素原子、ジフルオロメチル基、又はトリフルオロメチル基を表し、

X₅は臭素原子又はヨウ素原子を表し、

A は窒素原子を表し、及び

Y は単結合、O、S、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【請求項 2】

前記外部寄生虫防除剤は経口経路で全身投与される、請求項 1 に記載の外部寄生虫防除剤。

【請求項 3】

前記外部寄生虫防除剤は非経口経路で全身投与される、請求項 1 に記載の外部寄生虫防除剤。

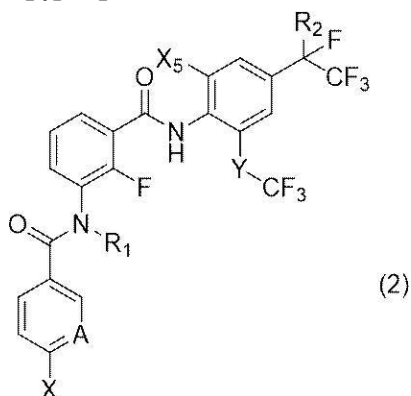
【請求項 4】

前記外部寄生虫防除剤は皮膚経路で全身投与される、請求項 1 に記載の外部寄生虫防除剤。

【請求項 5】

下記式 (2) で表される化合物を含む、動物における外部寄生虫の防除に使用するための全身投与のための調製物：

【化 2】



式中、

R₁ は水素原子又は C₁ - C₄ アルキル基を表し、

R₂ はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

X はフッ素原子、ジフルオロメチル基、又はトリフルオロメチル基を表し、

X₅ は臭素原子又はヨウ素原子を表し、

A は窒素原子を表し、及び

Y は単結合、O、S、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【請求項 6】

前記調製物は経口的に使用するためのものである、請求項 5 に記載の調製物。

【請求項 7】

前記調製物は非経口的に使用するためのものである、請求項 5 に記載の調製物。

【請求項 8】

前記調製物は皮膚に使用するためのものである、請求項 5 に記載の調製物。

【請求項 9】

前記調製物は単回投与調製物である、請求項 5 ～ 請求項 8 のいずれか一項に記載の調製物。

【請求項 10】

下記式 (2) で表される化合物を全身投与することを含む、動物（ヒトを除く）における外部寄生虫の防除のための方法：

10

20

30

40

50

(2)

動物における外部寄生虫の防除のための薬剤を調製するための、下記式（２）で表される化合物の使用であって、前記薬剤は前記動物に全身投与される使用：

CC1=CC=C(C=C1C(=O)N2C(=O)c3cc(C(F)(F)F)cc(C(F)(F)F)c3N2C(=O)N(C)C4=CC=C(C=C4)C(=O)N5C(=O)c6cc(C(F)(F)F)cc(C(F)(F)F)c6N5)C(F)(F)F

国際公開第2005／073165号、国際公開第2010／018714号、及び国

際公開第2011/093415号では、特定のカルボキサミド誘導体及びそれらの殺虫活性が開示されている。そのような化合物並びに特定の中間体の合成方法が、国際公開第2010/013567号及び国際公開第2010/018857号に記載されている。さらに、国際公開第2007/013150号にはカルボキサミド誘導体を他の化合物と組み合わせて含む害虫駆除組成物が記載されている。

【発明の概要】

【0003】

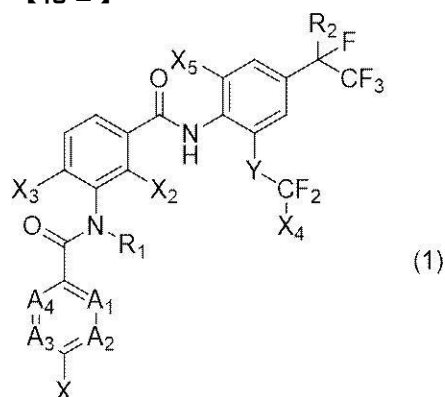
驚くべきことに、本明細書に開示の化合物は、有害生物からの保護について優れた活性を示すことが分かった。特に、この化合物は優れた殺虫活性を有すること、さらに前記化合物は動物への全身投与時に外部寄生虫に対して長期残効性を有し、したがって動物における外部寄生虫の長期防除に適していることも見出された。これらの知見に基づいて、本開示は、動物用外部寄生虫長期防除剤、動物における外部寄生虫の長期防除に使用するための全身投与用調製物、動物における外部寄生虫の長期防除のための方法、動物における外部寄生虫の長期防除のための薬剤を調製するための本明細書に開示の化合物の使用、園芸用又は農業用殺虫剤、作物を有害生物から保護する方法、不活性キャリアと混合され、任意に補助剤と混合された本明細書に開示の化合物を含む組成物、少なくとも1種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて本明細書に開示の化合物を含む混合物、及び特定の化学式で表される化合物を提供する。

【0004】

本発明は以下の態様に関する。

【1】下記式(1)で表される動物用外部寄生虫長期防除剤：

【化1】



式中、

A₁、A₂、及びA₃はそれぞれ独立して窒素原子又はC-X₁基を表し、ただしA₁及びA₂のうちの少なくとも1つはC-X₁基を表し、また、A₃が窒素原子を表す場合、A₁はC-X₁を表し、かつ、A₂は窒素原子を表し、

A₄はC-X₁基を表し、

R₁は水素原子又はC₁-C₄アルキル基を表し、

R₂はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

Xはハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄アルコキシル基、C₁-C₄ハロアルコキシル、C₁-C₄アルキルチオ基、C₁-C₄ハロアルキルチオ基、C₁-C₄アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、C₁-C₄ハロアルキルスルホニル基、アミノスルフィニル基、アミノスルホニル基、スルファモイル基、ニトロ基、又はシアノ基を表し、

X₁はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄アルコキシル基、C₁-C₄ハロアルコキシル又はシアノ基を表し、ただし、X及びX₁が隣接する炭素原子に結合している場合、X及びX₁は前記炭素原子と共に、芳香族でも非芳香族でもよい5員環系又は6員環系を形成してもよく、前記環は、環員としてN、O、及びSからそれぞれ独立して選択される0、1、2、又は3個

のヘテロ原子を含み、

X_2 、 X_3 、及び X_4 はそれぞれ独立して水素原子又はフッ素原子を表し、

X_5 は塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を表し、及び

Y は単結合、 O 、 S 、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【0005】

〔2〕 A_1 及び A_3 はそれぞれ独立して $C-X_1$ 基を表し、

A_2 は窒素原子又は $C-X_1$ 基を表し、

A_4 は $C-X_1$ 基を表し、

R_1 は水素原子又は C_1-C_4 アルキル基を表し、

R_2 はトリフルオロメチル基を表し、

X はハロゲン原子又は C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、

X_1 は水素原子を表し、

X_2 及び X_4 はそれぞれフッ素原子を表し、

X_3 は水素原子を表し、

X_5 は臭素原子又はヨウ素原子を表し、及び

Y は単結合又はスルホニル基を表す、〔1〕に記載の動物用外部寄生虫長期防除剤。

【0006】

〔3〕前記外部寄生虫長期防除剤は経口経路で全身投与される、〔1〕又は〔2〕に記載の外部寄生虫長期防除剤。

〔4〕前記外部寄生虫長期防除剤は非経口経路で全身投与される、〔1〕又は〔2〕に記載の外部寄生虫長期防除剤。

〔5〕前記外部寄生虫長期防除剤は皮膚経路で全身投与される、〔1〕又は〔2〕に記載の外部寄生虫長期防除剤。

〔6〕式（1）で表される化合物を含む、動物における外部寄生虫の長期防除に使用するための全身投与用調製物。

【0007】

〔7〕前記調製物は経口的に使用するためのものである、〔6〕に記載の調製物。

〔8〕前記調製物は非経口的に使用するためのものである、〔6〕に記載の調製物。

〔9〕前記調製物は皮膚に使用するためのものである、〔6〕に記載の調製物。

〔10〕前記調製物は単回投与調製物である、〔6〕～〔9〕のいずれか一つに記載の調製物。

【0008】

〔11〕式（1）で表される化合物を全身投与することを含む、動物における外部寄生虫の長期防除のための方法。

〔12〕動物における外部寄生虫の長期防除のための薬剤を調製するための、式（1）で表される化合物の使用であって、前記薬剤は前記動物に全身投与される、前記化合物の使用。

〔13〕式（1）で表される化合物を有効成分として含む園芸用又は農業用殺虫剤。

【0009】

〔14〕作物を、又は作物のための土壌を有効量の式（1）で表される化合物で処置することを含む、有害生物から作物を保護する方法。

〔15〕不活性キャリアと混合され、任意に補助剤と混合された、式（1）で表される化合物を含む組成物。

〔16〕少なくとも1種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて式（1）で表される化合物を含む混合物。

〔17〕下記式（2）で表される化合物：

10

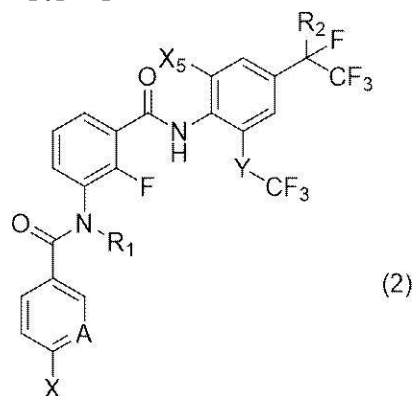
20

30

40

50

【化 2】



式中、

R_1 は水素原子又は $C_1 - C_4$ アルキル基を表し、

R_2 はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

X はフッ素原子、ジフルオロメチル基、又はトリフルオロメチル基を表し、

X_5 は臭素原子又はヨウ素原子を表し、

A は窒素原子又は $C-H$ 基を表し、及び

A が窒素原子を表す場合、 Y は単結合、 O 、 S 、スルホキシド基、又はスルホニル基を表し、 A が $C-H$ 基を表す場合、 Y は S 、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【0010】

【18】前記化合物が、 $N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド$ 、

$N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド$ 、

$6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)ニコチンアミド$ 、

$6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチルニコチンアミド$ 、

$2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-((トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミド$ 、及び

$2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-((トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミド$ からなる群から選択される、【17】に記載の化合物。

【0011】

本開示によれば、動物用外部寄生虫長期防除剤、動物における外部寄生虫の長期防除に使用するための全身投与用調製物、動物における外部寄生虫の長期防除のための方法、動物における外部寄生虫の長期防除のための薬剤を調製するための本明細書に開示の化合物の使用、園芸用又は農業用殺虫剤、作物を有害生物から保護する方法、不活性キャリアと混合され、任意に補助剤と混合された本明細書に開示の化合物を含む組成物、少なくとも1種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて本明細書に開示の化合物を含む混合物、及び特定の化学式で表される化合物が提供される。

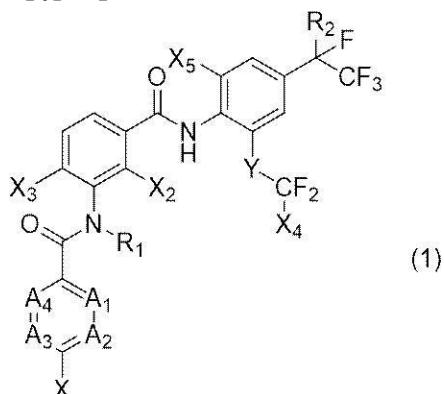
【発明を実施するための形態】

【0012】

本開示において、以下の式(1)で表される化合物は、本明細書に記載の様々な用途に

使用することができる。

【化 3】



式 (1) において、

A₁、A₂、及び A₃ はそれぞれ独立して窒素原子又は C-X₁ 基を表し、ただし A₁ 及び A₂ のうちの少なくとも 1 つは C-X₁ 基を表し、また、A₃ が窒素原子を表す場合、A₁ は C-X₁ を表し、かつ、A₂ は窒素原子を表し、

A₄ は C-X₁ 基を表し、

R₁ は水素原子又は C₁-C₄ アルキル基を表し、

R₂ はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

X はハロゲン原子、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ ハロアルキル基、C₁-C₄ アルコキシル基、C₁-C₄ ハロアルコキシル、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ ハロアルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ ハロアルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ ハロアルキルスルホニル基、アミノスルフィニル基、アミノスルホニル基、スルファモイル基、ニトロ基、又はシアノ基を表し、

X₁ はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ ハロアルキル基、C₁-C₄ アルコキシル基、C₁-C₄ ハロアルコキシル又はシアノ基を表し、ただし、X 及び X₁ が隣接する炭素原子に結合している場合、X 及び X₁ は前記炭素原子と共に、芳香族でも非芳香族でもよい 5 員環系又は 6 員環系を形成してもよく、前記環は、環員として N、O、及び S からそれぞれ独立して選択される 0、1、2、又は 3 個のヘテロ原子を含み、

X₂、X₃、及び X₄ はそれぞれ独立して水素原子又はフッ素原子を表し、

X₅ は塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を表し、及び

Y は単結合、O、S、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【0013】

式 (例えば式 (1)) で使用される用語の意味は、以下の通りである。

【0014】

本明細書で使用される用語「n-」、「i-」、「s-」、及び「t-」は、それぞれ「直鎖 (normal)」、「イソ (iso-)」、「第二級 (secondary)」、及び第三級 (tertiary)」を意味する。

本発明における用語「C₁-C₄ アルキル基」は、例えば、炭素原子数が 1~4 個の直鎖状又は分岐状アルキル基を表し、その例としてはメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチルが挙げられる。

本発明における用語「ハロゲン原子」は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を表す。

【0015】

本発明における用語「C₁-C₄ ハロアルキル基」は、例えば、互いに同じでも異なってもよい 1 又は複数のハロゲン原子で置換された炭素原子数が 1~4 個の直鎖状又は分岐状アルキル基を表し、その例としては、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロ-i-プロピル、2,2-ジフルオロ

エチル、2, 2-ジクロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2, 2, 2-トリブロモエチル、1, 3-ジフルオロ-2-プロピル、1, 3-ジクロロ-2-プロピル、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロピル、1, 1, 1-トリフルオロ-2-プロピル、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-n-プロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロピル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-2-プロピル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-n-プロピル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-n-プロピル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-1-ブロモ-2-プロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-n-プロピル、3-フルオロ-n-プロピル、3-クロロ-n-プロピル、3-ブロモ-n-プロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-i-ブチル、ノナフルオロ-s-ブチル、ノナフルオロ-t-ブチルが挙げられる。好ましくは、前記C₁-C₄ハロアルキル基は、C₁-C₄フルオロアルキル基、特にC₁-C₄パーフルオロアルキル基である。

【0016】

本発明における用語「C₁-C₄アルコキシ基」は、例えば、炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルコキシ基を表し、その例としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシが挙げられる。

【0017】

本発明における用語「C₁-C₄ハロアルコキシ基」は、例えば、互いに同じでも異なっているよい1又は複数のハロゲン原子で置換された炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルコキシ基を表し、その例としては、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ、ヘプタフルオロ-n-プロポキシ、ヘプタフルオロ-i-プロポキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、2, 2, 2-トリブロモエトキシ、1, 3-ジフルオロ-2-プロポキシ、1, 3-ジクロロ-2-プロポキシ、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロポキシ、1, 1, 1-トリフルオロ-2-プロポキシ、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-n-プロポキシ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロポキシ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロポキシ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-2-プロポキシ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-n-プロポキシ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-n-プロポキシ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-1-ブロモ-2-プロポキシ、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-n-プロポキシ、3-フルオロ-n-プロポキシ、3-クロロ-n-プロポキシ、3-ブロモ-n-プロポキシ、ノナフルオロ-n-ブトキシ、ノナフルオロ-i-ブトキシ、ノナフルオロ-s-ブトキシ、ノナフルオロ-t-ブトキシが挙げられる。好ましくは、前記C₁-C₄ハロアルコキシ基は、C₁-C₄フルオロアルコキシ基、特にC₁-C₄パーフルオロアルコキシ基である。

【0018】

本発明における用語「C₁-C₄アルキルチオ基」は、例えば、炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルキルチオ基を表し、その例としては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオが挙げられる。

【0019】

本発明における用語「C₁-C₄ハロアルキルチオ基」は、例えば、互いに同じでも異なっているよい1又は複数のハロゲン原子で置換された炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルキルチオ基を表し、その例としては、ジフルオロメチルチオ、トリフルオ

ロメチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、ヘプタフルオロ-*n*-プロピルチオ、ヘプタフルオロ-*i*-プロピルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2-ジクロロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2-ブロモエチルチオ、2-ヨードエチルチオ、2, 2, 2-トリクロロエチルチオ、2, 2, 2-トリブロモエチルチオ、1, 3-ジフルオロ-2-プロピルチオ、1, 3-ジクロロ-2-プロピルチオ、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロピルチオ、1, 1, 1-トリフルオロ-2-プロピルチオ、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-*n*-プロピルチオ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロピルチオ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロピルチオ、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-2-プロピルチオ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-*n*-プロピルチオ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-*n*-プロピルチオ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-1-ブロモ-2-プロピルチオ、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-*n*-プロピルチオ、3-フルオロ-*n*-プロピルチオ、3-クロロ-*n*-プロピルチオ、3-ブロモ-*n*-プロピルチオ、ノナフルオロ-*n*-ブチルチオ、ノナフルオロ-*i*-ブチルチオ、ノナフルオロ-*s*-ブチルチオ、ノナフルオロ-*t*-ブチルチオが挙げられる。好ましくは、前記C₁-C₄ハロアルキルチオ基は、C₁-C₄フルオロアルキルチオ基、特にC₁-C₄パーフルオロアルキルチオ基である。

【0020】

本発明における用語「C₁-C₄アルキルスルフィニル基」は、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、*n*-プロピルスルフィニル、*i*-プロピルスルフィニル、*n*-ブチルスルフィニル、*i*-ブチルスルフィニル、*s*-ブチルスルフィニル、又は*t*-ブチルスルフィニルなどの、炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルキルスルフィニル基を表す。

【0021】

本発明における用語「C₁-C₄ハロアルキルスルフィニル基」は、例えば、互いに同じでも異なってもよい1又は複数のハロゲン原子で置換された炭素原子数が1~4個の直鎖状又は分岐状アルキルスルフィニル基を表し、その例としては、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピルスルフィニル、ヘプタフルオロ-*i*-プロピルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジクロロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2-クロロエチルスルフィニル、2-ブロモエチルスルフィニル、2-ヨードエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリクロロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリブロモエチルスルフィニル、1, 3-ジフルオロ-2-プロピルスルフィニル、1, 3-ジクロロ-2-プロピルスルフィニル、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロピルスルフィニル、1, 1, 1-トリフルオロ-2-プロピルスルフィニル、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-*n*-プロピルスルフィニル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-プロピルスルフィニル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロピルスルフィニル、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-2-プロピルスルフィニル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-*n*-プロピルスルフィニル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-ブロモ-*n*-プロピルスルフィニル、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-1-ブロモ-2-プロピルスルフィニル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-*n*-プロピルスルフィニル、3-フルオロ-*n*-プロピルスルフィニル、3-クロロ-*n*-プロピルスルフィニル、3-ブロモ-*n*-プロピルスルフィニル、ノナフルオロ-*n*-ブチルスルフィニル、ノナフルオロ-*i*-ブチルスルフィニル、ノナフルオロ-*s*-ブチルスルフィニル、ノナフルオロ-*t*-ブチルスルフィニルが挙げられる。好ましくは、前記C₁-C₄ハロアルキルスルフィニル基は、C₁-C₄フルオロアルキルスルフィニル基、特にC₁-C₄パーフルオロアルキルスルフィニル基である。

【0022】

本発明における用語「 C_1-C_4 アルキルスルホニル基」は、例えば、炭素原子数が1～4個の直鎖状又は分岐状アルキルスルホニル基を表し、その例としては、メチルスルホニル、エチルスルホニル、 n -プロピルスルホニル、 i -プロピルスルホニル、 n -ブチルスルホニル、 i -ブチルスルホニル、 s -ブチルスルホニル、 t -ブチルスルホニルなどが挙げられる。

【0023】

本発明における用語「 C_1-C_4 ハロアルキルスルホニル基」は、例えば、互いに同じでも異なってもよい1又は複数のハロゲン原子で置換された炭素原子数が1～4個の直鎖状又は分岐状アルキルスルホニル基を表し、その例としては、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、ヘプタフルオロ- n -プロピルスルホニル、ヘプタフルオロ- i -プロピルスルホニル、2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2-ジクロロエチルスルホニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2-ブromoエチルスルホニル、2-ヨードエチルスルホニル、2,2,2-トリクロロエチルスルホニル、2,2,2-トリブromoエチルスルホニル、1,3-ジフルオロ-2-プロピルスルホニル、1,3-ジクロロ-2-プロピルスルホニル、1-クロロ-3-フルオロ-2-プロピルスルホニル、1,1,1-トリフルオロ-2-プロピルスルホニル、2,3,3,3-テトラフルオロ- n -プロピルスルホニル、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-プロピルスルホニル、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-クロロ-2-プロピルスルホニル、1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-ブromo-2-プロピルスルホニル、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-クロロ- n -プロピルスルホニル、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-ブromo- n -プロピルスルホニル、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-ブromo-2-プロピルスルホニル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロ- n -プロピルスルホニル、3-フルオロ- n -プロピルスルホニル、3-クロロ- n -プロピルスルホニル、3-ブromo- n -プロピルスルホニル、ノナフルオロ- n -ブチルスルホニル、ノナフルオロ- i -ブチルスルホニル、ノナフルオロ- s -ブチルスルホニル、ノナフルオロ- t -ブチルスルホニルが挙げられる。好ましくは、前記 C_1-C_4 ハロアルキルスルホニル基は、 C_1-C_4 フルオロアルキルスルホニル基、特に C_1-C_4 パーフルオロアルキルスルホニル基である。

【0024】

本発明に係る式(1)で表される化合物は、その構造式に1又は複数のキラル炭素原子又はキラル中心を含む場合があり、したがって2以上の光学異性体(エナンチオマー又はジアステレオマー)が存在し得る。しかしながら、本発明の範囲には、光学異性体のそれぞれ、及び複数の光学異性体の任意の割合での混合物が含まれる。

【0025】

式(1)において、置換基の好ましい定義には以下を含む。

好ましくは、 X はフッ素原子又はトリフルオロメチル基を表す。

好ましくは、 R_1 は水素原子又はメチル基を表す。

好ましくは、 X_1 は、水素原子又はフッ素原子を表す。

【0026】

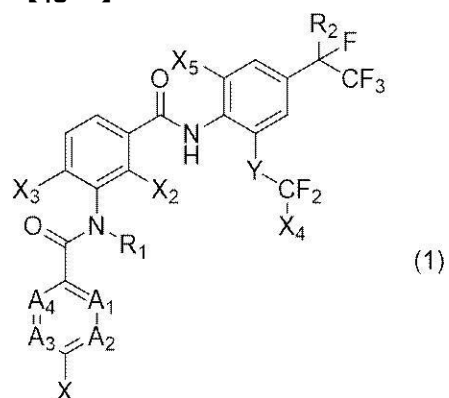
一実施形態では、式(1)で表される化合物は、 A_1 及び A_3 がそれぞれ独立して $C-X_1$ 基を表し、 A_2 が窒素原子又は $C-X_1$ 基を表し、 A_4 が $C-X_1$ 基を表し、 R_1 が水素原子又は C_1-C_4 アルキル基を表し、 R_2 がトリフルオロメチル基を表し、 X がハロゲン原子又は C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、 X_1 が水素原子を表し、 X_2 及び X_4 がそれぞれフッ素原子を表し、 X_3 が水素原子を表し、 X_5 が臭素原子又はヨウ素原子を表し、 Y が単結合又はスルホニル基を表す化合物である。

【0027】

本発明で使用可能な式(1)で表される化合物の例としては、表1に記載の化合物が挙

げられる。表 1 に記載の化合物は、下記式（式（1））で表され、 R_1 が CH_3 であり、 R_2 が CF_3 であり、 X_2 が F であり、 X_3 が H であり、 X_4 が F であり、 X_5 が I であり、 Y が単結合であり、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、及び X が表 1 に示す通りである化合物である。

【化 4】



【 0 0 2 8 】

10

20

30

40

50

【表 1 - 1】

表 1

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	CH	CH	CH	F	
CH	CH	CH	CH	Cl	
CH	CH	CH	CH	Br	
CH	CH	CH	CH	I	
CH	CH	CH	CH	CH ₃	10
CH	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	CH	CH	CH	CF ₃	
CH	CH	CH	CH	CHF ₂	
CH	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	CH	CH	CH	OCH ₃	
CH	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	CH	CH	CH	OCF ₃	
CH	CH	CH	CH	OCHF ₂	
CH	CH	CH	CH	SCH ₃	
CH	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	CH	CH	CH	SCF ₃	
CH	CH	CH	CH	SOCH ₃	
CH	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	CH	CH	CH	SOCF ₃	
CH	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	CH	CH	CH	NO ₂	
CH	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 2 9 】

【表 1 - 2】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CF	CH	CH	CH	F	
CF	CH	CH	CH	Cl	
CF	CH	CH	CH	Br	
CF	CH	CH	CH	I	
CF	CH	CH	CH	CH ₃	10
CF	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CF	CH	CH	CH	CF ₃	
CF	CH	CH	CH	CHF ₂	
CF	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CF	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CF	CH	CH	CH	OCH ₃	
CF	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CF	CH	CH	CH	OCF ₃	
CF	CH	CH	CH	OCHF ₂	
CF	CH	CH	CH	SCH ₃	
CF	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CF	CH	CH	CH	SCF ₃	
CF	CH	CH	CH	SOCH ₃	
CF	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CF	CH	CH	CH	SOCF ₃	
CF	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CF	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CF	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CF	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CF	CH	CH	CH	NO ₂	
CF	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 0 】

【表 1 - 3】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	CF	CH	CH	F	
CH	CF	CH	CH	Cl	
CH	CF	CH	CH	Br	
CH	CF	CH	CH	I	
CH	CF	CH	CH	CH ₃	10
CH	CF	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	CF	CH	CH	CF ₃	
CH	CF	CH	CH	CHF ₂	
CH	CF	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	CF	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	CF	CH	CH	OCH ₃	
CH	CF	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	CF	CH	CH	OCF ₃	
CH	CF	CH	CH	OCHF ₂	
CH	CF	CH	CH	SCH ₃	
CH	CF	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	CF	CH	CH	SCF ₃	
CH	CF	CH	CH	SOCH ₃	
CH	CF	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	CF	CH	CH	SOCF ₃	
CH	CF	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	CF	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	CF	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	CF	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	CF	CH	CH	NO ₂	
CH	CF	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 1】

【表 1 - 4】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCl	CH	CH	CH	F	
CCl	CH	CH	CH	Cl	
CCl	CH	CH	CH	Br	
CCl	CH	CH	CH	I	
CCl	CH	CH	CH	CH ₃	10
CCl	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCl	CH	CH	CH	CF ₃	
CCl	CH	CH	CH	CHF ₂	
CCl	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCl	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCl	CH	CH	CH	OCH ₃	
CCl	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCl	CH	CH	CH	OCF ₃	
CCl	CH	CH	CH	OCHF ₂	
CCl	CH	CH	CH	SCH ₃	
CCl	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCl	CH	CH	CH	SCF ₃	
CCl	CH	CH	CH	SOCH ₃	
CCl	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCl	CH	CH	CH	SOCF ₃	
CCl	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCl	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCl	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCl	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCl	CH	CH	CH	NO ₂	
CCl	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 2 】

【表 1 - 5】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	CCl	CH	CH	F	
CH	CCl	CH	CH	Cl	
CH	CCl	CH	CH	Br	
CH	CCl	CH	CH	I	10
CH	CCl	CH	CH	CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	CF ₃	
CH	CCl	CH	CH	CHF ₂	
CH	CCl	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	CCl	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	CCl	CH	CH	OCH ₃	20
CH	CCl	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	OCF ₃	
CH	CCl	CH	CH	OCHF ₂	
CH	CCl	CH	CH	SCH ₃	
CH	CCl	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	SCF ₃	
CH	CCl	CH	CH	SOCH ₃	30
CH	CCl	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	SOCF ₃	
CH	CCl	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	CCl	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	CCl	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	CCl	CH	CH	NO ₂	
CH	CCl	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 3 】

【表 1 - 6】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCH ₃	CH	CH	CH	F	
CCH ₃	CH	CH	CH	Cl	
CCH ₃	CH	CH	CH	Br	
CCH ₃	CH	CH	CH	I	
CCH ₃	CH	CH	CH	CH ₃	10
CCH ₃	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	CF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	CHF ₂	
CCH ₃	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCH ₃	CH	CH	CH	OCH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCH ₃	CH	CH	CH	OCF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	OCHF ₂	
CCH ₃	CH	CH	CH	SCH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SCF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SOCH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCH ₃	CH	CH	CH	SOCF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCH ₃	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCH ₃	CH	CH	CH	NO ₂	
CCH ₃	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 4】

【表 1 - 7】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	CCH ₃	CH	CH	F	
CH	CCH ₃	CH	CH	Cl	
CH	CCH ₃	CH	CH	Br	
CH	CCH ₃	CH	CH	I	
CH	CCH ₃	CH	CH	CH ₃	10
CH	CCH ₃	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	CF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	CHF ₂	
CH	CCH ₃	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	CCH ₃	CH	CH	OCH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	CCH ₃	CH	CH	OCF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	OCHF ₂	
CH	CCH ₃	CH	CH	SCH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SCF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SOCH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	CCH ₃	CH	CH	SOCF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	CCH ₃	CH	CH	NO ₂	
CH	CCH ₃	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 5 】

【表 1 - 8】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCF ₃	CH	CH	CH	F	
CCF ₃	CH	CH	CH	Cl	
CCF ₃	CH	CH	CH	Br	
CCF ₃	CH	CH	CH	I	10
CCF ₃	CH	CH	CH	CH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	CHF ₂	
CCF ₃	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCF ₃	CH	CH	CH	OCH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCF ₃	CH	CH	CH	OCF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	OCHF ₂	
CCF ₃	CH	CH	CH	SCH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SCF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SOCH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCF ₃	CH	CH	CH	SOCF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCF ₃	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCF ₃	CH	CH	CH	NO ₂	
CCF ₃	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 6】

【表 1 - 9】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	CCF ₃	CH	CH	F	
CH	CCF ₃	CH	CH	Cl	
CH	CCF ₃	CH	CH	Br	
CH	CCF ₃	CH	CH	I	
CH	CCF ₃	CH	CH	CH ₃	10
CH	CCF ₃	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	CHF ₂	
CH	CCF ₃	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	CCF ₃	CH	CH	OCH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	CCF ₃	CH	CH	OCF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	OCHF ₂	
CH	CCF ₃	CH	CH	SCH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SCF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SOCH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	CCF ₃	CH	CH	SOCF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	CCF ₃	CH	CH	NO ₂	
CH	CCF ₃	CH	CH	-CN	40

【 0 0 3 7 】

【表 1 - 1 0】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	N	CH	F	
CH	N	N	CH	Cl	
CH	N	N	CH	Br	
CH	N	N	CH	I	
CH	N	N	CH	CH ₃	10
CH	N	N	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	N	CH	CF ₃	
CH	N	N	CH	CHF ₂	
CH	N	N	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	N	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	N	CH	OCH ₃	
CH	N	N	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	N	CH	OCF ₃	
CH	N	N	CH	OCHF ₂	
CH	N	N	CH	SCH ₃	
CH	N	N	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	N	CH	SCF ₃	
CH	N	N	CH	SOCH ₃	
CH	N	N	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	N	CH	SOCF ₃	
CH	N	N	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	N	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	N	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	N	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	N	CH	NO ₂	
CH	N	N	CH	-CN	40

【 0 0 3 8】

【表 1 - 1 1】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CF	N	N	CH	F	
CF	N	N	CH	Cl	
CF	N	N	CH	Br	
CF	N	N	CH	I	
CF	N	N	CH	CH ₃	10
CF	N	N	CH	CH ₂ CH ₃	
CF	N	N	CH	CF ₃	
CF	N	N	CH	CHF ₂	
CF	N	N	CH	CF ₂ CF ₃	
CF	N	N	CH	CF(CF ₃) ₂	
CF	N	N	CH	OCH ₃	
CF	N	N	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CF	N	N	CH	OCF ₃	
CF	N	N	CH	OCHF ₂	
CF	N	N	CH	SCH ₃	
CF	N	N	CH	SCH ₂ CH ₃	
CF	N	N	CH	SCF ₃	
CF	N	N	CH	SOCH ₃	
CF	N	N	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CF	N	N	CH	SOCF ₃	
CF	N	N	CH	SO ₂ CH ₃	
CF	N	N	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CF	N	N	CH	SO ₂ CF ₃	
CF	N	N	CH	SO ₂ NH ₂	
CF	N	N	CH	NO ₂	
CF	N	N	CH	-CN	40

【 0 0 3 9】

【表 1 - 1 2】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCl	N	N	CH	F	
CCl	N	N	CH	Cl	
CCl	N	N	CH	Br	
CCl	N	N	CH	I	10
CCl	N	N	CH	CH ₃	
CCl	N	N	CH	CH ₂ CH ₃	
CCl	N	N	CH	CF ₃	
CCl	N	N	CH	CHF ₂	
CCl	N	N	CH	CF ₂ CF ₃	
CCl	N	N	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCl	N	N	CH	OCH ₃	
CCl	N	N	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCl	N	N	CH	OCF ₃	
CCl	N	N	CH	OCHF ₂	
CCl	N	N	CH	SCH ₃	
CCl	N	N	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCl	N	N	CH	SCF ₃	
CCl	N	N	CH	SOCH ₃	
CCl	N	N	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCl	N	N	CH	SOCF ₃	
CCl	N	N	CH	SO ₂ CH ₃	
CCl	N	N	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCl	N	N	CH	SO ₂ CF ₃	
CCl	N	N	CH	SO ₂ NH ₂	
CCl	N	N	CH	NO ₂	
CCl	N	N	CH	-CN	40

【 0 0 4 0】

【表 1 - 1 3】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCH ₃	N	N	CH	F	
CCH ₃	N	N	CH	Cl	
CCH ₃	N	N	CH	Br	
CCH ₃	N	N	CH	I	
CCH ₃	N	N	CH	CH ₃	10
CCH ₃	N	N	CH	CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	CF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	CHF ₂	
CCH ₃	N	N	CH	CF ₂ CF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCH ₃	N	N	CH	OCH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCH ₃	N	N	CH	OCF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	OCHF ₂	
CCH ₃	N	N	CH	SCH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SCF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SOCH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCH ₃	N	N	CH	SOCF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SO ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SO ₂ CF ₃	
CCH ₃	N	N	CH	SO ₂ NH ₂	
CCH ₃	N	N	CH	NO ₂	
CCH ₃	N	N	CH	-CN	40

【 0 0 4 1】

【表 1 - 1 4】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCF ₃	N	N	CH	F	
CCF ₃	N	N	CH	Cl	
CCF ₃	N	N	CH	Br	
CCF ₃	N	N	CH	I	
CCF ₃	N	N	CH	CH ₃	10
CCF ₃	N	N	CH	CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	CF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	CHF ₂	
CCF ₃	N	N	CH	CF ₂ CF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCF ₃	N	N	CH	OCH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCF ₃	N	N	CH	OCF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	OCHF ₂	
CCF ₃	N	N	CH	SCH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SCF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SOCH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCF ₃	N	N	CH	SOCF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SO ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SO ₂ CF ₃	
CCF ₃	N	N	CH	SO ₂ NH ₂	
CCF ₃	N	N	CH	NO ₂	
CCF ₃	N	N	CH	-CN	40

【 0 0 4 2】

【表 1 - 1 5】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CH	CH	F	
N	CH	CH	CH	Cl	
N	CH	CH	CH	Br	
N	CH	CH	CH	I	
N	CH	CH	CH	CH ₃	10
N	CH	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CH	CF ₃	
N	CH	CH	CH	CHF ₂	
N	CH	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CH	CH	OCH ₃	
N	CH	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CH	CH	OCF ₃	
N	CH	CH	CH	OCHF ₂	
N	CH	CH	CH	SCH ₃	
N	CH	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CH	SCF ₃	
N	CH	CH	CH	SOCH ₃	
N	CH	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CH	CH	SOCF ₃	
N	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CH	CH	NO ₂	
N	CH	CH	CH	-CN	40

【 0 0 4 3】

【表 1 - 1 6】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CF	CH	CH	F	
N	CF	CH	CH	Cl	
N	CF	CH	CH	Br	
N	CF	CH	CH	I	
N	CF	CH	CH	CH ₃	10
N	CF	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CF	CH	CH	CF ₃	
N	CF	CH	CH	CHF ₂	
N	CF	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CF	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CF	CH	CH	OCH ₃	
N	CF	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
N	CF	CH	CH	OCF ₃	
N	CF	CH	CH	OCHF ₂	
N	CF	CH	CH	SCH ₃	
N	CF	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CF	CH	CH	SCF ₃	
N	CF	CH	CH	SOCH ₃	
N	CF	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CF	CH	CH	SOCF ₃	
N	CF	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CF	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CF	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CF	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CF	CH	CH	NO ₂	
N	CF	CH	CH	-CN	40

【 0 0 4 4】

【表 1 - 1 7】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CF	CH	F	
N	CH	CF	CH	Cl	
N	CH	CF	CH	Br	
N	CH	CF	CH	I	
N	CH	CF	CH	CH ₃	10
N	CH	CF	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CF	CH	CF ₃	
N	CH	CF	CH	CHF ₂	
N	CH	CF	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CF	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CF	CH	OCH ₃	
N	CH	CF	CH	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CF	CH	OCF ₃	
N	CH	CF	CH	OCHF ₂	
N	CH	CF	CH	SCH ₃	
N	CH	CF	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CF	CH	SCF ₃	
N	CH	CF	CH	SOCH ₃	
N	CH	CF	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CF	CH	SOCF ₃	
N	CH	CF	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CF	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CF	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CF	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CF	CH	NO ₂	
N	CH	CF	CH	-CN	40

【 0 0 4 5】

【表 1 - 1 8】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CH	CF	F	
N	CH	CH	CF	Cl	
N	CH	CH	CF	Br	
N	CH	CH	CF	I	
N	CH	CH	CF	CH ₃	10
N	CH	CH	CF	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CF	CF ₃	
N	CH	CH	CF	CHF ₂	
N	CH	CH	CF	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CF	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CH	CF	OCH ₃	
N	CH	CH	CF	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CH	CF	OCF ₃	
N	CH	CH	CF	OCHF ₂	
N	CH	CH	CF	SCH ₃	
N	CH	CH	CF	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CF	SCF ₃	
N	CH	CH	CF	SOCH ₃	
N	CH	CH	CF	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CH	CF	SOCF ₃	
N	CH	CH	CF	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CF	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CF	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CF	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CH	CF	NO ₂	
N	CH	CH	CF	-CN	40

【 0 0 4 6】

【表 1 - 1 9】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CCl	CH	CH	F	
N	CCl	CH	CH	Cl	
N	CCl	CH	CH	Br	
N	CCl	CH	CH	I	10
N	CCl	CH	CH	CH ₃	
N	CCl	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	CF ₃	
N	CCl	CH	CH	CHF ₂	
N	CCl	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CCl	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CCl	CH	CH	OCH ₃	20
N	CCl	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	OCF ₃	
N	CCl	CH	CH	OCHF ₂	
N	CCl	CH	CH	SCH ₃	
N	CCl	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	SCF ₃	
N	CCl	CH	CH	SOCH ₃	30
N	CCl	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	SOCF ₃	
N	CCl	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CCl	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CCl	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CCl	CH	CH	NO ₂	40
N	CCl	CH	CH	-CN	

【 0 0 4 7】

【表 1 - 2 0】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CCl	CH	F	
N	CH	CCl	CH	Cl	
N	CH	CCl	CH	Br	
N	CH	CCl	CH	I	10
N	CH	CCl	CH	CH ₃	
N	CH	CCl	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	CF ₃	
N	CH	CCl	CH	CHF ₂	
N	CH	CCl	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CCl	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CCl	CH	OCH ₃	20
N	CH	CCl	CH	OCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	OCF ₃	
N	CH	CCl	CH	OCHF ₂	
N	CH	CCl	CH	SCH ₃	
N	CH	CCl	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	SCF ₃	
N	CH	CCl	CH	SOCH ₃	30
N	CH	CCl	CH	SOCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	SOCF ₃	
N	CH	CCl	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCl	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CCl	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CCl	CH	NO ₂	
N	CH	CCl	CH	-CN	40

【 0 0 4 8】

【表 1 - 2 1】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CH	CCl	F	
N	CH	CH	CCl	Cl	
N	CH	CH	CCl	Br	
N	CH	CH	CCl	I	
N	CH	CH	CCl	CH ₃	10
N	CH	CH	CCl	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCl	CF ₃	
N	CH	CH	CCl	CHF ₂	
N	CH	CH	CCl	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCl	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CH	CCl	OCH ₃	
N	CH	CH	CCl	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CH	CCl	OCF ₃	
N	CH	CH	CCl	OCHF ₂	
N	CH	CH	CCl	SCH ₃	
N	CH	CH	CCl	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCl	SCF ₃	
N	CH	CH	CCl	SOCH ₃	
N	CH	CH	CCl	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CH	CCl	SOCF ₃	
N	CH	CH	CCl	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCl	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCl	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCl	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CH	CCl	NO ₂	
N	CH	CH	CCl	-CN	40

【 0 0 4 9】

【表 1 - 2 2】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CCH ₃	CH	CH	F	
N	CCH ₃	CH	CH	Cl	
N	CCH ₃	CH	CH	Br	
N	CCH ₃	CH	CH	I	10
N	CCH ₃	CH	CH	CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	CF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	CHF ₂	
N	CCH ₃	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CCH ₃	CH	CH	OCH ₃	20
N	CCH ₃	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	OCF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	OCHF ₂	
N	CCH ₃	CH	CH	SCH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SCF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SOCH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CCH ₃	CH	CH	SOCF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CCH ₃	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CCH ₃	CH	CH	NO ₂	
N	CCH ₃	CH	CH	-CN	40

【 0 0 5 0】

【表 1 - 2 3】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CCH ₃	CH	F	
N	CH	CCH ₃	CH	Cl	
N	CH	CCH ₃	CH	Br	
N	CH	CCH ₃	CH	I	10
N	CH	CCH ₃	CH	CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	CF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	CHF ₂	
N	CH	CCH ₃	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CCH ₃	CH	OCH ₃	20
N	CH	CCH ₃	CH	OCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	OCF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	OCHF ₂	
N	CH	CCH ₃	CH	SCH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SCF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SOCH ₃	30
N	CH	CCH ₃	CH	SOCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SOCF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CCH ₃	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CCH ₃	CH	NO ₂	
N	CH	CCH ₃	CH	-CN	40

【 0 0 5 1】

【表 1 - 2 4】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CH	CCH ₃	F	
N	CH	CH	CCH ₃	Cl	
N	CH	CH	CCH ₃	Br	
N	CH	CH	CCH ₃	I	
N	CH	CH	CCH ₃	CH ₃	10
N	CH	CH	CCH ₃	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	CF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	CHF ₂	
N	CH	CH	CCH ₃	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CH	CCH ₃	OCH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CH	CCH ₃	OCF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	OCHF ₂	
N	CH	CH	CCH ₃	SCH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SCF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SOCH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CH	CCH ₃	SOCF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCH ₃	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CH	CCH ₃	NO ₂	
N	CH	CH	CCH ₃	-CN	40

【 0 0 5 2】

【表 1 - 2 5】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CCF ₃	CH	CH	F	
N	CCF ₃	CH	CH	Cl	
N	CCF ₃	CH	CH	Br	
N	CCF ₃	CH	CH	I	10
N	CCF ₃	CH	CH	CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	CHF ₂	
N	CCF ₃	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CCF ₃	CH	CH	OCH ₃	20
N	CCF ₃	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	OCF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	OCHF ₂	
N	CCF ₃	CH	CH	SCH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SCF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SOCH ₃	30
N	CCF ₃	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SOCF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CCF ₃	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CCF ₃	CH	CH	NO ₂	
N	CCF ₃	CH	CH	-CN	40

【 0 0 5 3】

【表 1 - 2 6】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CCF ₃	CH	F	
N	CH	CCF ₃	CH	Cl	
N	CH	CCF ₃	CH	Br	
N	CH	CCF ₃	CH	I	
N	CH	CCF ₃	CH	CH ₃	10
N	CH	CCF ₃	CH	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	CF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	CHF ₂	
N	CH	CCF ₃	CH	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CCF ₃	CH	OCH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CCF ₃	CH	OCF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	OCHF ₂	
N	CH	CCF ₃	CH	SCH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SCF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SOCH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CCF ₃	CH	SOCF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CCF ₃	CH	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CCF ₃	CH	NO ₂	
N	CH	CCF ₃	CH	-CN	40

【 0 0 5 4】

【表 1 - 2 7】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
N	CH	CH	CCF ₃	F	
N	CH	CH	CCF ₃	Cl	
N	CH	CH	CCF ₃	Br	
N	CH	CH	CCF ₃	I	
N	CH	CH	CCF ₃	CH ₃	10
N	CH	CH	CCF ₃	CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	CHF ₂	
N	CH	CH	CCF ₃	CF ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	CF(CF ₃) ₂	
N	CH	CH	CCF ₃	OCH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	OCH ₂ CH ₃	20
N	CH	CH	CCF ₃	OCF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	OCHF ₂	
N	CH	CH	CCF ₃	SCH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SCH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SCF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SOCH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SOCH ₂ CH ₃	30
N	CH	CH	CCF ₃	SOCF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SO ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SO ₂ CF ₃	
N	CH	CH	CCF ₃	SO ₂ NH ₂	
N	CH	CH	CCF ₃	NO ₂	
N	CH	CH	CCF ₃	-CN	40

【 0 0 5 5 】

【表 1 - 2 8】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CH	CH	F	
CH	N	CH	CH	Cl	
CH	N	CH	CH	Br	
CH	N	CH	CH	I	10
CH	N	CH	CH	CH ₃	
CH	N	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CH	CF ₃	
CH	N	CH	CH	CHF ₂	
CH	N	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CH	CH	OCH ₃	20
CH	N	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CH	OCF ₃	
CH	N	CH	CH	OCHF ₂	
CH	N	CH	CH	SCH ₃	
CH	N	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CH	SCF ₃	
CH	N	CH	CH	SOCH ₃	
CH	N	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CH	CH	SOCF ₃	
CH	N	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CH	CH	NO ₂	
CH	N	CH	CH	-CN	40

【 0 0 5 6】

【表 1 - 2 9】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CF	N	CH	CH	F	
CF	N	CH	CH	Cl	
CF	N	CH	CH	Br	
CF	N	CH	CH	I	10
CF	N	CH	CH	CH ₃	
CF	N	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CF	N	CH	CH	CF ₃	
CF	N	CH	CH	CHF ₂	
CF	N	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CF	N	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CF	N	CH	CH	OCH ₃	
CF	N	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CF	N	CH	CH	OCF ₃	
CF	N	CH	CH	OCHF ₂	
CF	N	CH	CH	SCH ₃	
CF	N	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CF	N	CH	CH	SCF ₃	
CF	N	CH	CH	SOCH ₃	
CF	N	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CF	N	CH	CH	SOCF ₃	
CF	N	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CF	N	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CF	N	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CF	N	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CF	N	CH	CH	NO ₂	
CF	N	CH	CH	-CN	40

【 0 0 5 7 】

【表 1 - 3 0】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CF	CH	F	
CH	N	CF	CH	Cl	
CH	N	CF	CH	Br	
CH	N	CF	CH	I	
CH	N	CF	CH	CH ₃	10
CH	N	CF	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CF	CH	CF ₃	
CH	N	CF	CH	CHF ₂	
CH	N	CF	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CF	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CF	CH	OCH ₃	
CH	N	CF	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CF	CH	OCF ₃	
CH	N	CF	CH	OCHF ₂	
CH	N	CF	CH	SCH ₃	
CH	N	CF	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CF	CH	SCF ₃	
CH	N	CF	CH	SOCH ₃	
CH	N	CF	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CF	CH	SOCF ₃	
CH	N	CF	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CF	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CF	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CF	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CF	CH	NO ₂	
CH	N	CF	CH	-CN	40

【 0 0 5 8】

【表 1 - 3 1】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CH	CF	F	
CH	N	CH	CF	Cl	
CH	N	CH	CF	Br	
CH	N	CH	CF	I	10
CH	N	CH	CF	CH ₃	
CH	N	CH	CF	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	CF ₃	
CH	N	CH	CF	CHF ₂	
CH	N	CH	CF	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CF	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CH	CF	OCH ₃	20
CH	N	CH	CF	OCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	OCF ₃	
CH	N	CH	CF	OCHF ₂	
CH	N	CH	CF	SCH ₃	
CH	N	CH	CF	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	SCF ₃	
CH	N	CH	CF	SOCH ₃	30
CH	N	CH	CF	SOCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	SOCF ₃	
CH	N	CH	CF	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CF	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CF	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CH	CF	NO ₂	
CH	N	CH	CF	-CN	40

【 0 0 5 9】

【表 1 - 3 2】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCl	N	CH	CH	F	
CCl	N	CH	CH	Cl	
CCl	N	CH	CH	Br	
CCl	N	CH	CH	I	10
CCl	N	CH	CH	CH ₃	
CCl	N	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	CF ₃	
CCl	N	CH	CH	CHF ₂	
CCl	N	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCl	N	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCl	N	CH	CH	OCH ₃	20
CCl	N	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	OCF ₃	
CCl	N	CH	CH	OCHF ₂	
CCl	N	CH	CH	SCH ₃	
CCl	N	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	SCF ₃	
CCl	N	CH	CH	SOCH ₃	30
CCl	N	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	SOCF ₃	
CCl	N	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCl	N	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCl	N	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCl	N	CH	CH	NO ₂	40
CCl	N	CH	CH	-CN	

【 0 0 6 0】

【表 1 - 3 3】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CCl	CH	F	
CH	N	CCl	CH	Cl	
CH	N	CCl	CH	Br	
CH	N	CCl	CH	I	
CH	N	CCl	CH	CH ₃	10
CH	N	CCl	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCl	CH	CF ₃	
CH	N	CCl	CH	CHF ₂	
CH	N	CCl	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CCl	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CCl	CH	OCH ₃	
CH	N	CCl	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CCl	CH	OCF ₃	
CH	N	CCl	CH	OCHF ₂	
CH	N	CCl	CH	SCH ₃	
CH	N	CCl	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CCl	CH	SCF ₃	
CH	N	CCl	CH	SOCH ₃	
CH	N	CCl	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CCl	CH	SOCF ₃	
CH	N	CCl	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CCl	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCl	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CCl	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CCl	CH	NO ₂	
CH	N	CCl	CH	-CN	40

【 0 0 6 1】

【表 1 - 3 4】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CH	CCl	F	
CH	N	CH	CCl	Cl	
CH	N	CH	CCl	Br	
CH	N	CH	CCl	I	
CH	N	CH	CCl	CH ₃	10
CH	N	CH	CCl	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCl	CF ₃	
CH	N	CH	CCl	CHF ₂	
CH	N	CH	CCl	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCl	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CH	CCl	OCH ₃	
CH	N	CH	CCl	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CH	CCl	OCF ₃	
CH	N	CH	CCl	OCHF ₂	
CH	N	CH	CCl	SCH ₃	
CH	N	CH	CCl	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCl	SCF ₃	
CH	N	CH	CCl	SOCH ₃	
CH	N	CH	CCl	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CH	CCl	SOCF ₃	
CH	N	CH	CCl	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCl	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCl	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCl	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CH	CCl	NO ₂	
CH	N	CH	CCl	-CN	40

【 0 0 6 2】

【表 1 - 3 5】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCH ₃	N	CH	CH	F	
CCH ₃	N	CH	CH	Cl	
CCH ₃	N	CH	CH	Br	
CCH ₃	N	CH	CH	I	
CCH ₃	N	CH	CH	CH ₃	10
CCH ₃	N	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	CF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	CHF ₂	
CCH ₃	N	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCH ₃	N	CH	CH	OCH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCH ₃	N	CH	CH	OCF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	OCHF ₂	
CCH ₃	N	CH	CH	SCH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SCF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SOCH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCH ₃	N	CH	CH	SOCF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCH ₃	N	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCH ₃	N	CH	CH	NO ₂	
CCH ₃	N	CH	CH	-CN	40

【 0 0 6 3 】

【表 1 - 3 6】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CCH ₃	CH	F	
CH	N	CCH ₃	CH	Cl	
CH	N	CCH ₃	CH	Br	
CH	N	CCH ₃	CH	I	10
CH	N	CCH ₃	CH	CH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	CF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	CHF ₂	
CH	N	CCH ₃	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CCH ₃	CH	OCH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CCH ₃	CH	OCF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	OCHF ₂	
CH	N	CCH ₃	CH	SCH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SCF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SOCH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CCH ₃	CH	SOCF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CCH ₃	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CCH ₃	CH	NO ₂	
CH	N	CCH ₃	CH	-CN	40

【 0 0 6 4】

【表 1 - 3 7】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CH	CCH ₃	F	
CH	N	CH	CCH ₃	Cl	
CH	N	CH	CCH ₃	Br	
CH	N	CH	CCH ₃	I	
CH	N	CH	CCH ₃	CH ₃	10
CH	N	CH	CCH ₃	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	CF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	CHF ₂	
CH	N	CH	CCH ₃	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CH	CCH ₃	OCH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CH	CCH ₃	OCF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	OCHF ₂	
CH	N	CH	CCH ₃	SCH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SCF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SOCH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CH	CCH ₃	SOCF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCH ₃	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CH	CCH ₃	NO ₂	
CH	N	CH	CCH ₃	-CN	40

【 0 0 6 5】

【表 1 - 3 8】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CCF ₃	N	CH	CH	F	
CCF ₃	N	CH	CH	Cl	
CCF ₃	N	CH	CH	Br	
CCF ₃	N	CH	CH	I	10
CCF ₃	N	CH	CH	CH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	CHF ₂	
CCF ₃	N	CH	CH	CF ₂ CF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	CF(CF ₃) ₂	
CCF ₃	N	CH	CH	OCH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CCF ₃	N	CH	CH	OCF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	OCHF ₂	
CCF ₃	N	CH	CH	SCH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SCH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SCF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SOCH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CCF ₃	N	CH	CH	SOCF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SO ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SO ₂ CF ₃	
CCF ₃	N	CH	CH	SO ₂ NH ₂	
CCF ₃	N	CH	CH	NO ₂	
CCF ₃	N	CH	CH	-CN	40

【 0 0 6 6】

【表 1 - 3 9】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CCF ₃	CH	F	
CH	N	CCF ₃	CH	Cl	
CH	N	CCF ₃	CH	Br	
CH	N	CCF ₃	CH	I	
CH	N	CCF ₃	CH	CH ₃	10
CH	N	CCF ₃	CH	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	CF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	CHF ₂	
CH	N	CCF ₃	CH	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CCF ₃	CH	OCH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CCF ₃	CH	OCF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	OCHF ₂	
CH	N	CCF ₃	CH	SCH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SCF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SOCH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CCF ₃	CH	SOCF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CCF ₃	CH	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CCF ₃	CH	NO ₂	
CH	N	CCF ₃	CH	-CN	40

【 0 0 6 7 】

【表 1 - 4 0】

表 1 (続き)

A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	X	
CH	N	CH	CCF ₃	F	
CH	N	CH	CCF ₃	Cl	
CH	N	CH	CCF ₃	Br	
CH	N	CH	CCF ₃	I	
CH	N	CH	CCF ₃	CH ₃	10
CH	N	CH	CCF ₃	CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	CF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	CHF ₂	
CH	N	CH	CCF ₃	CF ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	CF(CF ₃) ₂	
CH	N	CH	CCF ₃	OCH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	OCH ₂ CH ₃	20
CH	N	CH	CCF ₃	OCF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	OCHF ₂	
CH	N	CH	CCF ₃	SCH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SCH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SCF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SOCH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SOCH ₂ CH ₃	30
CH	N	CH	CCF ₃	SOCF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SO ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SO ₂ CF ₃	
CH	N	CH	CCF ₃	SO ₂ NH ₂	
CH	N	CH	CCF ₃	NO ₂	
CH	N	CH	CCF ₃	-CN	40

【0 0 6 8】

本開示は、以下の表 2 ～ 表 2 4 0 も含む。表 2 ～ 表 2 4 0 のそれぞれには、表 1 と同様に、式 (1) の範囲内にある複数の化合物が記載されている。より具体的には、表 2 ～ 表 2 4 0 のそれぞれは、表 1 に記載の複数の組み合わせと同じ A₁、A₂、A₃、A₄、及び X の複数の組み合わせを記載しているが、表 2 ～ 表 2 4 0 のそれぞれにおける R₁、R₂、X₂、X₃、X₄、X₅、及び Y の複数の組み合わせは、表 1 におけるそれらの複数の組み合わせとは異なる。したがって、それぞれの表における R₁、R₂、X₂、X₃、X₄、X₅、及び Y の組み合わせのみを以下に示し、各表における A₁、A₂、A₃、A₄、及び X の組み合わせのバリエーションの表示は、バリエーションが表 1 に記載のものと同じで

あるため、省略する。

【0069】

表1では、 R_1 、 R_2 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 、及び Y の組み合わせは、「 R_1 が CH_3 、 R_2 が CF_3 、 X_2 が F 、 X_3 が H 、 X_4 が F 、 X_5 が I 、及び Y が単結合」である。表2における、 R_1 、 R_2 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 、及び Y の組み合わせは、下記に示す通り「 R_1 が H 、 R_2 が CF_3 、 X_2 が F 、 X_3 が H 、 X_4 が F 、 X_5 が I 、及び Y が単結合」である。よって、表2の最初のエントリーは、 A_1 が CH 、 A_2 が CH 、 A_3 が CH 、 A_4 が CH 、 X が F 、 R_1 が H 、 R_2 が CF_3 、 X_2 が F 、 X_3 が H 、 X_4 が F 、 X_5 が I 、及び Y が単結合である2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド化合物を具体的に開示している。ここで、表1の最初のエントリーは、「 A_1 が CH 、 A_2 が CH 、 A_3 が CH 、 A_4 が CH 、 X が F 」であることに注意されたい。表2の2番目以降のエントリーで指定されている化合物も同じ方法で同定でき、各表のための R_1 、 R_2 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 、及び Y の組み合わせを考慮して、表3～表240に記載の化合物も同じ方法で同定できる。

【0070】

10

20

30

40

50

【表 2 - 1】

表	各表における R ₁ , R ₂ , X ₂ , X ₃ , X ₄ , X ₅ , 及び Y の組み合わせ	
2	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
3	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
4	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
5	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
6	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
7	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	10
8	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
9	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
10	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
11	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
12	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
13	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
14	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
15	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	20
16	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
17	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
18	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
19	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
20	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
21	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, , 及び Y が単結合	
22	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, , 及び Y が単結合	
23	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	30
24	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
25	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
26	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
27	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
28	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
29	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
30	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
31	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	40

【 0 0 7 1 】

【表 2 - 2】

表	各表における R ₁ , R ₂ , X ₂ , X ₃ , X ₄ , X ₅ , 及び Y の組み合わせ
32	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S
33	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO
34	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO
35	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO
36	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO
37	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
38	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
39	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
40	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
41	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合
42	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合
43	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
44	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
45	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O
46	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O
47	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O
48	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O
49	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S
50	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S
51	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S
52	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S
53	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO
54	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO
55	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO
56	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO
57	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
58	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
59	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
60	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
61	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合
62	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合
63	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
64	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
65	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O
66	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O
67	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O
68	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O

10

20

30

40

【 0 0 7 2 】

【表 2 - 3】

表	各表における R ₁ , R ₂ , X ₂ , X ₃ , X ₄ , X ₅ , 及び Y の組み合わせ	
69	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
70	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
71	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
72	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
73	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
74	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
75	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
76	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	10
77	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
78	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
79	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
80	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が F, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
81	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
82	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
83	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
84	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
85	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	20
86	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
87	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
88	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
89	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
90	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
91	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
92	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
93	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
94	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
95	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	30
96	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
97	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
98	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
99	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
100	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
101	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
102	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
103	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
104	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
105	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	40

【0073】

【表 2 - 4】

表 各表における R₁, R₂, X₂, X₃, X₄, X₅, 及び Y の組み合わせ

106	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
107	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
108	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
109	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
110	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
111	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
112	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
113	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	10
114	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
115	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
116	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
117	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
118	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
119	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
120	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
121	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
122	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	20
123	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
124	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
125	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
126	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
127	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
128	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
129	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
130	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
131	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
132	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	30
133	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
134	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
135	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
136	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
137	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
138	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
139	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
140	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
141	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
142	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	40

【 0 0 7 4 】

【表 2 - 5】

表	各表における R ₁ , R ₂ , X ₂ , X ₃ , X ₄ , X ₅ , 及び Y の組み合わせ	
143	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
144	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
145	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
146	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
147	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
148	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
149	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
150	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	10
151	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
152	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
153	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
154	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
155	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
156	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
157	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
158	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
159	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	20
160	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
161	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
162	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
163	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
164	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
165	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
166	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O	
167	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
168	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O	
169	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	30
170	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S	
171	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
172	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S	
173	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
174	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO	
175	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
176	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
177	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
178	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
179	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	40

【 0 0 7 5 】

【表 2 - 6】

表	各表における R ₁ , R ₂ , X ₂ , X ₃ , X ₄ , X ₅ , 及び Y の組み合わせ
180	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
181	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合
182	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合
183	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
184	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
185	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O
186	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O
187	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O
188	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O
189	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S
190	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S
191	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S
192	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S
193	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO
194	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO
195	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO
196	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO
197	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
198	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂
199	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
200	R ₁ が H, R ₂ が CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂
201	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合
202	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が単結合
203	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
204	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が単結合
205	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O
206	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が O
207	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O
208	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が O
209	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S
210	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が S
211	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S
212	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が S
213	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO
214	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が F, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO
215	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO
216	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO

【 0 0 7 6 】

10

20

30

40

【表 2 - 7】

表 各表における R₁, R₂, X₂, X₃, X₄, X₅, 及び Y の組み合わせ

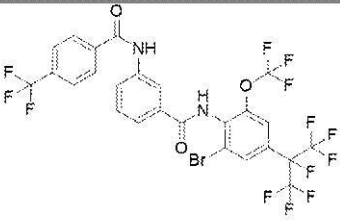
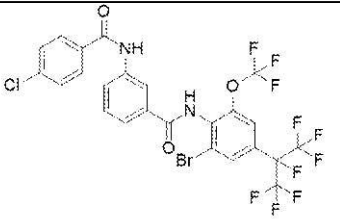
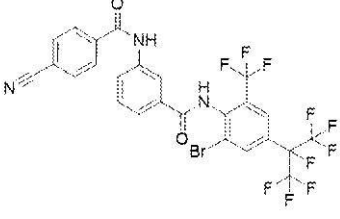
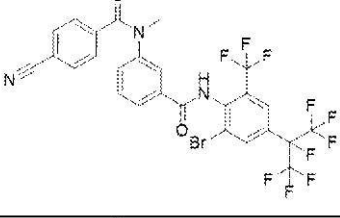
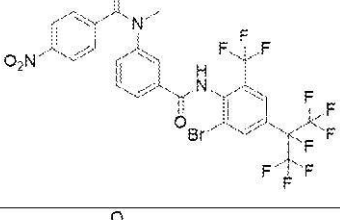
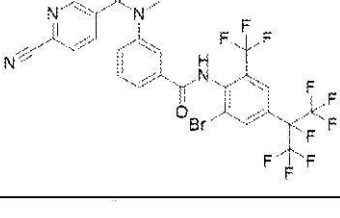
217	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
218	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
219	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
220	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が F, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
221	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	
222	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が単結合	10
223	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
224	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が単結合	
225	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
226	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が O	
227	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
228	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が O	
229	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	
230	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が S	20
231	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
232	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が S	
233	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
234	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO	
235	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
236	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO	
237	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	
238	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が I, 及び Y が SO ₂	30
239	R ₁ が CH ₃ , R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	
240	R ₁ が H, R ₂ が CF ₂ CF ₃ , X ₂ が H, X ₃ が H, X ₄ が H, X ₅ が Br, 及び Y が SO ₂	

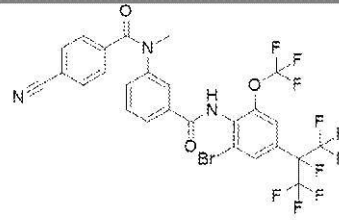
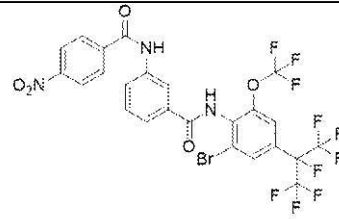
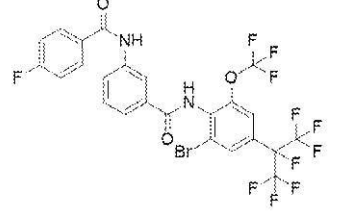
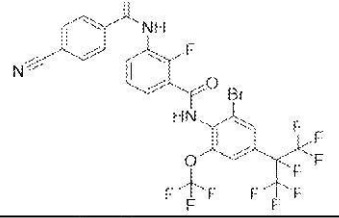
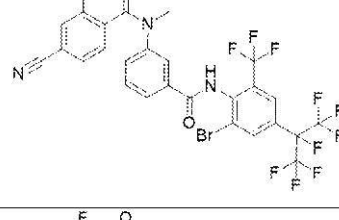
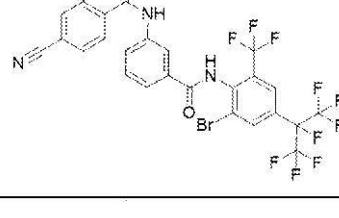
【0077】

本発明で使用可能な式 (1) で表される化合物の好ましい例として、以下の表 2 4 1 に示す化合物が挙げられる。

【0078】

【表 3 - 1】
表 2 4 1

Compound	Structure
1	
2	
3	
4	
5	
6	

Compound	Structure
10	
11	
12	
13	
14	
15	

【 0 0 7 9 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】
表 2 4 1 (続き)

Compound	Structure	Compound	Structure
7		16	
8		17	
9		18	
19		28	
20		29	
21		30	

【 0 0 8 0 】

10

20

30

40

【表 3 - 3】
表 2 4 1 (続 き)

Compound	Structure	Compound	Structure
22		31	
23		32	
24		33	
25		34	
26		35	
27		36	

【 0 0 8 1 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 4】
表 2 4 1 (続き)

Compound	Structure	Compound	Structure
37		46	
38		47	
39		48	
40		49	
41		50	
42		51	

【 0 0 8 2 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 5】

表 2 4 1 (続き)

Compound	Structure	Compound	Structure
43		52	
44		53	
45		54	
55		64	
56		65	
57		66	

【 0 0 8 3 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 6】
表 2 4 1 (続 き)

Compound	Structure	Compound	Structure
58		67	
59		68	
60		69	
61		70	
62		71	
63		72	

【 0 0 8 4 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 7】

表 2 4 1 (続き)

Compound	Structure
73	
74	
75	
76	
77	
78	

Compound	Structure
82	
83	
84	
85	
86	
87	

10

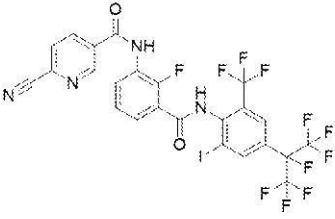
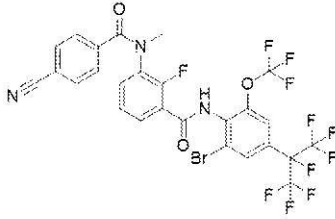
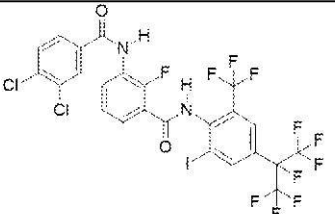
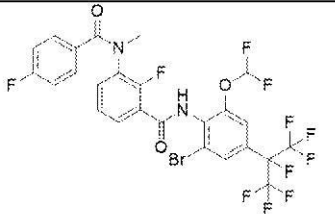
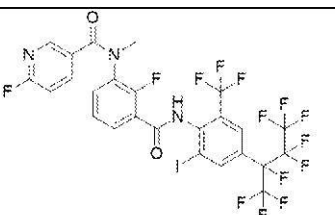
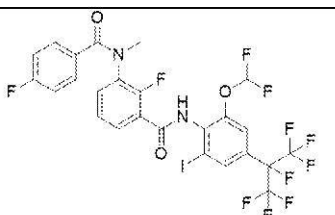
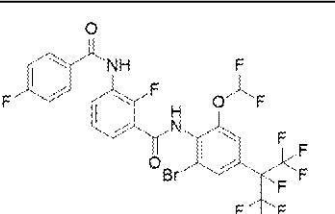
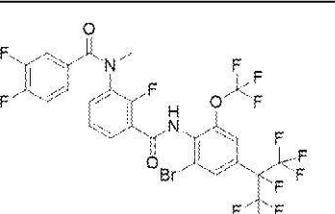
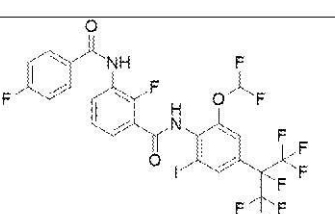
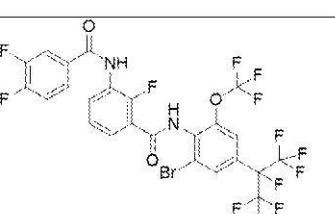
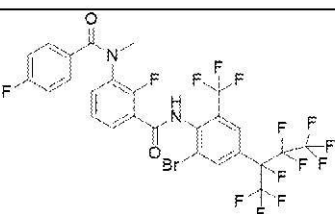
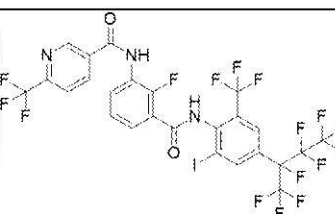
20

30

40

【 0 0 8 5 】

【表 3 - 8】
表 2 4 1 (続 き)

Compound	Structure	Compound	Structure
79		88	
80		89	
81		90	
91		100	
92		101	
93		102	

【 0 0 8 6 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 9】
表 2 4 1 (続き)

Compound	Structure
94	
95	
96	
97	
98	
99	

Compound	Structure
103	
104	
105	
106	
107	
108	

【 0 0 8 7 】

10

20

30

40

50

【表 3 - 1 0】
表 2 4 1 (続 き)

Compound	Structure
109	
110	
111	
112	
113	
114	

Compound	Structure
118	
119	

10

20

30

40

【 0 0 8 8 】

50

表 2 4 1 (続き)

100

20

本発明において使用するための式（１）で表される特に好ましい化合物には、以下の化合物が含まれる：

2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド、

2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド、

N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド、

N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド、

6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)ニコチンアミド、

6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチルニコチンアミド、

2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミド、

50

2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミド。

【0090】

式(1)で表される化合物は、固体の形態であっても、溶媒和物、特に水和物の形態であってもよい。溶媒和物、特に水和物の形態の前記化合物も本発明に含まれる。

【0091】

式(1)で表される化合物は、当技術分野で公知の方法を用いて調製することができる。例えば、国際公開第2005/073165号、国際公開第2010/018714号、国際公開第2011/093415号並びに国際公開第2010/013567号及び国際公開第2010/018857号を参照。例示的な合成方法を、実施例1～実施例9で詳述する。

【0092】

動物衛生分野では、すなわち獣医学の分野では、式(1)で表される化合物は、動物の寄生虫、特に外部寄生虫又は内部寄生虫に対して活性である。用語「内部寄生虫」には、特に蠕虫類及び球虫(コクシジウム、coccidia)などの原生動物が含まれる。外部寄生虫は、典型的かつ好ましくは節足動物、特に昆虫又はダニである。式(1)で表される化合物の動物寄生虫に対する毒性のため、式(1)で表される化合物は動物寄生虫を防除するために使用でき得る。特に、式(1)で表される化合物は、後述する実施例で実証されるように、外部寄生虫の防除に対して長期効果を有する。長期効果により、例えば、少なくとも16日間(より好ましくは少なくとも23日、さらにより好ましくは少なくとも30日)、未処置の対照と比較して、生存している害虫の数が少なくとも50%の減少(より好ましくは少なくとも60%の減少、さらにより好ましくは少なくとも70%の減少、さらにより好ましくは少なくとも80%、特に好ましくは少なくとも90%の減少)が示され得る。長期効果を決定するのに用いる試験は、後述の試験例E及び試験例Fを参照して実施できる。

【0093】

獣医学の分野では、式(1)で表される化合物は、家畜の繁殖や畜産、繁殖、動物園、実験室、実験動物、及び家畜動物において発生する寄生虫を防除するのに適した特性を有し、また式(1)で表される化合物は、温血動物に対する毒性が低い。そうした特性は、寄生虫の発達の全て又は特定の段階に対して機能する。

【0094】

一実施形態では、式(1)で表される動物用外部寄生虫長期防除剤が提供される。言い換えれば、式(1)で表される化合物は、動物用外部寄生虫長期防除剤として適切に使用できる。

前記外部寄生虫長期防除剤は、 A_1 及び A_3 がそれぞれ独立して $C-X_1$ 基を表し、 A_2 が窒素原子又は $C-X_1$ 基を表し、 A_4 が $C-X_1$ 基を表し、 R_1 が水素原子又は C_1-C_4 アルキル基を表し、 R_2 がトリフルオロメチル基を表し、 X がハロゲン原子又は C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、 X_1 が水素原子を表し、 X_2 及び X_4 がそれぞれフッ素原子を表し、 X_3 が水素原子を表し、 X_5 が臭素原子又はヨウ素原子を表し、及び Y が単結合又はスルホニル基を表す化学構造を有してもよい。前記外部寄生虫長期防除剤は全身投与されてもよく、投与は、経口経路、非経口経路、及び皮膚経路のうちの少なくとも1つを介して実行されてもよい。

【0095】

別の実施形態では、式(1)で表される化合物を含む、動物における外部寄生虫の長期防除に使用するための全身投与用調製物を提供する。前記調製物は、経口での使用、非経口での使用、及び皮膚への使用のうちの少なくとも1つの使用のためのものであってもよい。調製物は単回投与調製物であってもよい。本開示において、用語「調製物」及び用語「製剤」は、実質的に交換可能に使用される。

【0096】

別の実施形態では、式（１）で表される化合物を全身投与することを含む、動物における外部寄生虫の長期防除のための方法を提供する。別の実施形態では、動物における外部寄生虫の長期防除のための薬剤を調製するための、式（１）で表される化合物の使用を提供され、ここで、前記薬剤は前記動物に全身投与される。さらに別の実施形態では、動物における外部寄生虫の長期防除のための式（１）で表される化合物の使用を提供され、ここで、前記薬剤は前記動物に全身投与される。

【００９７】

寄生虫を防除するために式（１）で表される化合物を処置され得る農業用家畜には、例えば、ヒツジ、ヤギ、馬、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、及び特に牛や豚などの哺乳類；あるいは、七面鳥、アヒル、ガチョウ、及び特に鶏などの家禽；あるいは、魚類若しくは甲殻類、例えば水産養殖における魚類若しくは甲殻類；あるいは、場合によっては、ミツバチなどの昆虫が含まれ得る。

【００９８】

寄生虫を防除するために式（１）で表される化合物を処置され得る家畜には、例えば、哺乳類、例えば、ハムスター、モルモット、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、若しくは特に犬、猫；かごで飼われる鳥、爬虫類；両生類又は観賞魚が含まれる。

【００９９】

一実施形態では、式（１）で表される化合物は哺乳動物に投与される。別の実施形態によれば、式（１）で表される化合物は、鳥、例えば、かごで飼われる鳥、又は特に家禽に投与される。

【０１００】

式（１）で表される化合物を使用して動物の寄生虫を防除することにより、より経済的で簡便な動物飼育が可能になり、より良い動物のウェルビーイング（健康で安心かつ満足できる生活状態）が達成されるように、病気、死亡例、パフォーマンス低下（肉、牛乳、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）を軽減又は予防することが可能である。

【０１０１】

動物衛生分野に関する、本発明で使用される用語「防除」又は「防除する」という用語は、寄生虫に感染した動物におけるそれぞれの寄生虫の発生率を無害なレベルに低減することを意味する。より具体的には、本発明で使用される用語「防除する」とは、それぞれの寄生虫を死滅させ、その成長を抑制し、又はその増殖を抑制する上での効能を意味する。

【０１０２】

式（１）で表される化合物を使用して防除され得る例示的な節足動物は、以下を含むが、これらに限定されない：

アノプルリダ目（*Anoplurida*）に属するもの、例えば、ハエマトピヌス属の種（*Haematopinus spp.*）、リノグナツス属の種（*Linognathus spp.*）、ペジクルス属の種（*Pediculus spp.*）、プチルス属の種（*Phthirus spp.*）、及びソレノポテス属の種（*Solenopotes spp.*）；

マロファギダ目（*Mallophagida*）並びにアムブリセリナ亜目（*Amblycerina*）及びイスクノセリナ亜目（*Ischnocerina*）に属するもの、例えば、ボビコラ属の種（*Bovicola spp.*）、ダマリナ属の種（*Damalina spp.*）、フェリコラ属の種（*Felicola spp.*）、レピケントロン属の種（*Lepikentron spp.*）、メノポン属の種（*Menopon spp.*）、トリコデクテス属の種（*Trichodectes spp.*）、トリメノポン属の種（*Trimenopon spp.*）、トリノトン属の種（*Trinoton spp.*）、及びウェルネキエラ属の種（*Werneckiella spp.*）；

双翅目（*Diptera*）並びにネマトセリナ亜目（*Nematocerina*）及びブラキセリナ亜目（*Brachycerina*）に属するもの、例えば、アエデス属の種（*Aedes spp.*）、アノフェレス属の種（*Anopheles spp.*）、アチロツス属の種（*Atylotus spp.*）、ブラウラ属の種（*Braula spp.*）

)、カリホラ属の種 (*Calliphora* spp.)、クリソミヤ属の種 (*Chrysomyia* spp.)、クリソプス属の種 (*Chrysops* spp.)、クレクス属の種 (*Culex* spp.)、クリコイデス属の種 (*Culicoides* spp.)、エウシムリウム属の種 (*Eusimulium* spp.)、ファンニア属の種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属の種 (*Gasterophilus* spp.)、グロシナ属の種 (*Glossina* spp.)、ハエマトビア属の種 (*Haematobia* spp.)、ハエマトポタ属の種 (*Haematopota* spp.)、ヒポボスカ属の種 (*Hippobosca* spp.)、ヒボミトラ属の種 (*Hybomitra* spp.)、ヒドロタエ属の種 (*Hydrotaea* spp.)、ヒポデルマ属の種 (*Hypoderma* spp.)、リポプテナ属の種 (*Lipoptena* spp.)、ルシリア属の種 (*Lucilia* spp.)、ルトゾミヤ属の種 (*Lutzomyia* spp.)、メロファグス属の種 (*Melophagus* spp.)、モレリア属の種 (*Morellia* spp.)、ムスカ属の種 (*Musca* spp.)、オダグミア属の種 (*Odagmia* spp.)、オエストルス属の種 (*Oestrus* spp.)、フィリポミヤ属の種 (*Philipomyia* spp.)、フレボトムス属の種 (*Phlebotomus* spp.)、リノエストルス属の種 (*Rhinocestrus* spp.)、サルコファガ属の種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属の種 (*Simulium* spp.)、ストモキス属の種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属の種 (*Tabanus* spp.)、チプラ属の種 (*Tipula* spp.)、ウィルヘルミア属の種 (*Wilhelmia* spp.)、及びウォールファールチア属の種 (*Wohlfahrtia* spp.) ;

10

20

ノミ目 (*Siphonapterida*) に属するもの、例えば、セラトフィルス属の種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属の種 (*Ctenocephalides* spp.)、プレキス属の種 (*Pulex* spp.)、ツング属の種 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属の種 (*Xenopsylla* spp.) ;
ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) に属するもの、例えば、シメキス属の種 (*Cimex* spp.)、パンストロンギルス属の種 (*Panstrongylus* spp.)、ロドニウス属の種 (*Rhodnius* spp.)、及びトリアトマ属の種 (*Triatoma* spp.) ;並びに、

ゴキブリ目 (*Blattarida*) からの有害 (nuisance) 生物及び衛生害虫。

30

【0103】

さらに、式 (1) で表される化合物を使用して防除され得る例示的な節足動物は、以下のダニ類を含むが、特に限定されない：

ダニ亜綱 (*Acarina*) 及びメタスティグマ目 (*Metastigmata*) に属するもの、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) に属するもの、例えば、アルガス属の種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属の種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属の種 (*Otobius* spp.) ;マダニ科 (*Ixodidae*) に属するもの、例えば、アンブリオンマ属の種 (*Amblyomma* spp.)、デルマセントル属の種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属の種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属の種 (*Hyalomma* spp.)、イクソデス属の種 (*Ixodes* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属の種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、リピセファルス属の種 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属) ;メソスティグマ目 (*Mesostigmata*) に属するもの、例えば、デルマニス属の種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニス属の種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニス属の種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属の種 (*Raillietia* spp.)、ステルノストマ属の種 (*Sternostoma* spp.)、トロピラエラプス属の種 (*Tropilaelaps* spp.)、バロア属の種 (*Varroa* spp.) ;アクチネジダ目 (*Ac*

40

50

tinidida (*Prostigmata*)) に属するもの、例えば、アカラピス属の種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属の種 (*Cheyletiella* spp.)、デモデキス属の種 (*Demodex* spp.)、リストロホルス属の種 (*Listrophorus* spp.)、ミオビア属の種 (*Myobia* spp.)、ネオトロムビクラ属の種 (*Neotrombicula* spp.)、オルニトケイレチア属の種 (*Ornithocheyletia* spp.)、プソレルガテス属の種 (*Psorergates* spp.)、トロムビクラ属の種 (*Trombicula* spp.) ; 及び、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) に属するもの、例えば、アカルス属の種 (*Acarus* spp.)、カログリフス属の種 (*Caloglyphus* spp.)、コリオプテス属の種 (*Chorioptes* spp.)、シトジテス属の種 (*Cytodites* spp.)、ヒポデクテス属の種 (*Hypodectes* spp.)、クネミドコプテス属の種 (*Knemidocoptes* spp.)、ラミノシオプテス属の種 (*Laminosioptes* spp.)、ノトエドレス属の種 (*Notoedres* spp.)、オトデクテス属の種 (*Otodectes* spp.)、プソロプテス属の種 (*Psoroptes* spp.)、プテロリクス属の種 (*Pterolichus* spp.)、サルコプテス属の種 (*Sarcoptes* spp.)、トリキサカルス属の種 (*Trixacarus* spp.)、及びチロファグス属の種 (*Tyrophagus* spp.)。

【0104】

式 (1) で表される化合物を使用して防除され得る例示的な寄生性原生動物は、以下を含むが、特に限定されない：

鞭毛虫亜門 (*Mastigophora*) (鞭毛虫類 (*Flagellata*))、例えば、

メタモナス類 (*Metamonada*)：ディプロモナス目 (*Diplomonadida*) に属するもの、例えば、ジアルディア属の種 (*Giardia* spp.)、スピロヌクレウス属の種 (*Spirotrunculus* spp.)、

パラバサリア (*Parabasala*)：トリコモナス目 (*Trichomonadida*) に属するもの、例えば、ヒストモナス属の種 (*Histomonas* spp.)、ペントトリコモナス属の種 (*Pentatrichomonas* spp.)、テトラトリコモナス属の種 (*Tetratrichomonas* spp.)、トリコモナス属の種 (*Trichomonas* spp.)、及びトリトリコモナス属の種 (*Tritrichomonas* spp.)、及び

ユーグレノゾア (*Euglenozoa*)：トリパノソーマ目 (*Trypanosomatida*) に属するもの、例えば、レーシュマニア属の種 (*Leishmania* spp.) 及びトリパノソーマ属の種 (*Trypanosoma* spp.)；

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopoda*))、例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エンタモエバ属の種 (*Entamoeba* spp.)、セントラモエビダエ (*Centramoebidae*)、例えばアカンタモエバ属の種 (*Acanthamoeba* sp.)、ユアモエビダエ (*Euamoebidae*)、例えばハートマネラ属の種 (*Hartmannella* sp.)；

アルベオラータ (*Alveolata*)、例えばアピコンプレクサ類 (*Apicomplexa*) (孢子虫 (*Sporozoa*))：例えば、

クリプトスポリジウム属の種 (*Cryptosporidium* spp.)、

エイメリア目 (*Eimeriida*) に属するもの、例えば、ベスノイチア属の種 (*Besnoitia* spp.)、シストイソスポラ属の種 (*Cystoisospora* spp.)、エイメリア属の種 (*Eimeria* spp.)、ハンモンジア属の種 (*Hammondia* spp.)、イソスポラ属の種 (*Isospora* spp.)、ネオスポラ属の種 (*Neospora* spp.)、サルコシスチス属の種 (*Sarcocystis* spp.)、トキソプラズマ属の種 (*Toxoplasma* spp.)、

10

20

30

40

50

アデレア目 (Adeleida) に属するもの、例えば、ヘパトゾオン属の種 (Hepatoozon spp.)、クロッシエラ属の種 (Klossiella spp.) ; 住血胞子虫目 (Haemosporida) に属するもの、例えば、レウコシトゾオン属の種 (Leucocytoozoon spp.)、プラスモジウム属の種 (Plasmodium spp.)、

ピロプラズマ目 (Piroplasmida) に属するもの、例えば、バベシア属の種 (Babesia spp.)、シリホラ属の種 (Ciliophora spp.)、エチノゾオン属の種 (Echinozoon spp.)、テリレリア属の種 (Theileria spp.) ; ベシブリフェリダ目 (Vesibuliferida) に属するもの、例えば、バランチジウム属の種 (Balantidium spp.)、ブクストネラ属の種 (Buxtonella spp.)、及び

10

微胞子虫類 (Microspora)、例えばエンセファリトゾオン属の種 (Encephalitozoon spp.)、エンテロシトゾオン属の種 (Enterocytoozoon spp.)、グロビジウム属の種 (Globidium spp.)、ノセマ属の種 (Nosema spp.)、及びさらに、例えば、ミキソゾア属の種 (Myxozoa spp.)。

【0105】

式 (1) で表される化合物を使用して防除され得るヒト又は動物における病原性蠕虫類は、例えば、鉤頭動物、線虫、舌形動物、及び扁形動物 (例えば、単生綱、条虫、吸虫) を含む。式 (1) で表される化合物を使用して防除され得る例示的な蠕虫類は、以下を含むが、特に限定されない：

20

単生類：例えば、ダクチロギルス属の種 (Dactylogyrus spp.)、ギロダクチルス属の種 (Gyrodactylus spp.)、ミクロボツリウム属の種 (Microbothrium spp.)、ポリストマ属の種 (Polystoma spp.)、トログレセファルス属の種 (Troglocephalus spp.) ;

条虫類：

擬葉目 (Pseudophyllidea) に属するもの、例えば：ボツリジウム属の種 (Bothridium spp.)、ジフィロボツリウム属の種 (Diphyllbothrium spp.)、ジプロゴノポルス属の種 (Diplogonoporus spp.)、イクチオボツリウム属の種 (Ichthyobothrium spp.)、リグラ属の種 (Ligula spp.)、シストセファルス属の種 (Schistocephalus spp.)、スピロメトラ属の種 (Spirometra spp.)、

30

円葉目 (Cyclophyllida) に属するもの、例えば：アンジラ属の種 (Andyra spp.)、アノプロセファラ属の種 (Anoplocephala spp.)、アビテリナ属の種 (Avitellina spp.)、ベルチエラ属の種 (Bertiella spp.)、シットタエニア属の種 (Cittotaenia spp.)、ダバイネア属の種 (Davainea spp.)、ジオルクス属の種 (Diorchis spp.)、ジプロピリジウム属の種 (Diplopylidium spp.)、ジピリジウム属の種 (Dipylidium spp.)、エキノコッカス属の種 (Echinococcus spp.)、エキノコチレ属の種 (Echinocotyle spp.)、エキノレピス属の種 (Echinolepis spp.)、ヒダチゲラ属の種 (Hydatigera spp.)、ヒメノレピス属の種 (Hymenolepis spp.)、ジョエウキシエラ属の種 (Joyeuxiella spp.)、メソセストイデス属の種 (Mesocestoides spp.)、モニエジア属の種 (Moniezia spp.)、パラノプロセファラ属の種 (Paranoplocephala spp.)、ラリエチナ属の種 (Raillietina spp.)、スチレシア属の種 (Stilesia spp.)、タエニア属の種 (Taenia spp.)、チサニエジア属の種 (Thysaniezia spp.)、及びチサノソマ属の種 (Thysanosoma spp.) ;

40

50

吸虫類：

二生亜綱類 (Digenea) に属するもの、例えば：アウストロビルハルジア属の種 (*Austrobilharzia* spp.)、ブラキライマ属の種 (*Brachylaima* spp.)、カリコフォロン属の種 (*Calicophoron* spp.)、カタトロピス属の種 (*Catatropis* spp.)、クロノルキス属の種 (*Clonorchis* spp.)、コリリクルム属の種 (*Collyriclum* spp.)、コチロフォロン属の種 (*Cotylophoron* spp.)、シクロコエルム属の種 (*Cyclocoelum* spp.)、ジクロコエリウム属の種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジプロストムム属の種 (*Diplostomum* spp.)、エキノチャスムス属の種 (*Echinochasmus* spp.)、エキノパリフィウム属の種 (*Echinoparyphium* spp.)、エキノストマ属の種 (*Echinostoma* spp.)、エウリトレマ属の種 (*Eurytrema* spp.)、ファシオラ属の種 (*Fasciola* spp.)、ファシオリデス属の種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属の種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィショエデリウス属の種 (*Fischöderius* spp.)、ガストロチラクス属の種 (*Gastrothylacus* spp.)、ギガントビルハルジア属の種 (*Gigantobilharzia* spp.)、ギガントコチレ属の種 (*Gigantocotyle* spp.)、ヘテロフィエス属の種 (*Heterophyes* spp.)、ヒポデラエウム属の種 (*Hypoderaeum* spp.)、レウコクロリジウム属の種 (*Leucochloridium* spp.)、メタゴニムス属の種 (*Metagonimus* spp.)、メトルキス属の種 (*Metorchis* spp.)、ナノフィエツス属の種 (*Nanophyetus* spp.)、ノトコチルス属の種 (*Notocotylus* spp.)、オピストルキス属の種 (*Opisthorchis* spp.)、オルニトビルハルジア属の種 (*Ornithobilharzia* spp.)、パラゴニムス属の種 (*Paragonimus* spp.)、パラμφィストムム属の種 (*Paramphistomum* spp.)、ブラギオルキス属の種 (*Plagiorchis* spp.)、ポストジプロストムム属の種 (*Posthodiplostomum* spp.)、プロストゴニムス属の種 (*Prosthogonimus* spp.)、シストソマ属の種 (*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属の種 (*Trichobilharzia* spp.)、トログロトレマ属の種 (*Troglootrema* spp.)、及びチフロコエルム属の種 (*Typhlocoelum* spp.)；

線虫類：

旋毛虫目 (Trichinellida) に属するもの、例えば：カピラリア属の種 (*Capillaria* spp.)、ユウコレウス属の種 (*Eucoleus* spp.)、パラカピラリア属の種 (*Paracapillaria* spp.)、トリチネラ属の種 (*Trichinella* spp.)、トリコモソイデス属の種 (*Trichomosoides* spp.)、トリクリス属の種 (*Trichuris* spp.)、

ハリセンチュウ目 (Tylenchida) に属するもの、例えば：ミクロネマ属の種 (*Micronema* spp.)、パラストラングロイデス属の種 (*Parastrongyloides* spp.)、ストロンギロイデス属の種 (*Strongyloides* spp.)、

かん線虫目 (Rhabditina) に属するもの、例えば：アエルロストロンギルス属の種 (*Aelurostrongylus* spp.)、アミドストムム属の種 (*Amidostomum* spp.)、アンシロストマ属の種 (*Ancylostoma* spp.)、アンギオストロンギルス属の種 (*Angiostrongylus* spp.)、ブロンコネマ属の種 (*Bronchonema* spp.)、ブノストムム属の種 (*Bunostomum* spp.)、チャベルチア属の種 (*Chabertia* spp.)、コーペリア属の種 (*Cooperia* spp.)、コーペリオイデス属の種 (*Cooperioides* spp.)、クレノソマ属の種 (*Crenosoma* spp.)

10

20

30

40

50

、シアトストムム属の種 (*Cyathostomum* spp.)、シクロコレルクス属の種 (*Cyclococercus* spp.)、シクロドントストムム属の種 (*Cyclodontostomum* spp.)、シリコシクルス属の種 (*Cylicocycylus* spp.)、シリコステファヌス属の種 (*Cylicostephanus* spp.)、シリンドロファリンクス属の種 (*Cylindropharynx* spp.)、シストカウルス属の種 (*Cystocaulus* spp.)、ジクチオカウルス属の種 (*Dictyocaulus* spp.)、エラフォストロンギルス属の種 (*Elaphostrongylus* spp.)、フィラロイデス属の種 (*Filaroides* spp.)、グロボセファルス属の種 (*Globocephalus* spp.)、グラフィジウム属の種 (*Graphidium* spp.)、ギャロセファルス属の種 (*Gyalocephalus* spp.)、ハエモンクス属の種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属の種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヒオストロンギルス属の種 (*Hyoststrongylus* spp.)、マルシャラギア属の種 (*Marshallagia* spp.)、メタストロンギルス属の種 (*Metastrongylus* spp.)、ムエレリウス属の種 (*Muellerius* spp.)、ネカトル属の種 (*Necator* spp.)、ネマトジルス属の種 (*Nematodirus* spp.)、ネオストロンギルス属の種 (*Neoststrongylus* spp.)、ニッポストロンギルス属の種 (*Nippostrongylus* spp.)、オベリスコイデス属の種 (*Obeliscoides* spp.)、オエソファゴドンツス属の種 (*Oesophagodontus* spp.)、オエソファゴストムム属の種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属の種 (*Ollulanus* spp.)、オルニトストロンギルス属の種 (*Ornithoststrongylus* spp.)、オスレルス属の種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属の種 (*Ostertagia* spp.)、パラクーペリア属の種 (*Paracooperia* spp.)、パラクレノソマ属の種 (*Paracrenosoma* spp.)、パラフィラロイデス属の種 (*Parafilaroides* spp.)、パレラフォストロンギルス属の種 (*Parelaphostrongylus* spp.)、ニューモカウルス属の種 (*Pneumocaulus* spp.)、ニューモストロンギルス属の種 (*Pneumoststrongylus* spp.)、ポテリオストムム属の種 (*Poteriosomum* spp.)、プロトストロンギルス属の種 (*Protostrongylus* spp.)、スピコカウルス属の種 (*Spicocaulus* spp.)、ステファヌルス属の種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギルス属の種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属の種 (*Syngamus* spp.)、テラドルサギア属の種 (*Teladorsagia* spp.)、トリコネマ属の種 (*Trichonema* spp.)、トリコストロンギルス属の種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリオドントフォルス属の種 (*Triodontophorus* spp.)、トログロストロンギルス属の種 (*Trogloststrongylus* spp.)、ウンシナリア属の種 (*Uncinaria* spp.)、

旋尾線虫目 (*Spirurida*) に属するもの、例えば：アカントケイロネマ属の種 (*Acanthocheilonema* spp.)、アニサキス属の種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属の種 (*Ascaridia* spp.)、アスカリス属の種 (*Ascaris* spp.)、アスカロプス属の種 (*Ascarops* spp.)、アスピクルリス属の種 (*Aspiculuris* spp.)、バイリサスカルリス属の種 (*Baylisascaris* spp.)、ブルギア属の種 (*Brugia* spp.)、セルコピチラリア属の種 (*Cercopithifilaria* spp.)、クラシカウダ属の種 (*Crassicauda* spp.)、ジペタロネマ属の種 (*Dipetalonema* spp.)、ジロフィラリア属の種 (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属の種 (*Dracunculus* spp.)、ドラシア属の種 (*Draschia* spp.)、エンテロビウス属の種 (*Enterobius* spp.)、フィラリア属の種 (*Filaria* spp.)、グナトストマ属の種 (*Gna*

10

20

30

40

50

thostoma spp.)、ゴンギロネマ属の種 (Gongylonema spp.)、ハブロネマ属の種 (Habronema spp.)、ヘテラキス属の種 (Heterakis spp.)、リトモソイデス属の種 (Litomosoides spp.)、ロア属の種 (Loa spp.)、オンコセルカ属の種 (Onchocerca spp.)、オクスユリウス属の種 (Oxyuris spp.)、パラブロネマ属の種 (Parabronema spp.)、パラフィラリア属の種 (Parafilaria spp.)、パラスカリス属の種 (Parascaris spp.)、パッサルルス属の種 (Passalurus spp.)、フィサロプテラ属の種 (Physaloptera spp.)、プロブストマイリア属の種 (Probstmayria spp.)、シュードフィラリア属の種 (Pseudofilaria spp.)、セタリア属の種 (Setaria spp.)、シェラビネマ属の種 (Skjrabinema spp.)、スピロセルカ属の種 (Spirocerca spp.)、ステファノフィラリア属の種 (Stephanofilaria spp.)、ストロンギルリス属の種 (Strongyluris spp.)、シファシア属の種 (Syphacia spp.)、テラジア属の種 (Thelazia spp.)、トキサスカリス属の種 (Toxascaris spp.)、トキシカラ属の種 (Toxocara spp.)、ウシェレリア属の種 (Wuchereria spp.) ;

10

鉤頭虫類：

ダイコウトウチュウ目 (Oligacanthorhynchida) に属するもの、例えば：マクラカントリンクス属の種 (Macracanthorhynchus spp.) 及びプロステノルキス属の種 (Prosthenorchis spp.)、

20

サジョウコウトウチュウ目 (Moniliformida) に属するもの、例えば：モニリフォルミス属の種 (Moniliformis spp.)、

ポリモルフス目 (Polymorphida) に属するもの、例えば：フィリコリス属の種 (Filicollis spp.)、

コウトウチュウ目 (Echinorhynchida) に属するもの、例えばアカントセファルス属の種 (Acanthocephalus spp.)、エキノリンクス属の種 (Echinorhynchus spp.)、レプトリンコイデス属の種 (Leptorhynchoides spp.) ; 及び

舌形動物：

30

ポロセファルス目 (Porocephalida) に属するもの、例えば、リングアツラ属の種 (Linguatula spp.)。

獣医学分野及び動物飼育では、式 (1) で表される化合物の投与は、適切な調製物の形態で、経腸的、非経口的、経皮的、又は経鼻的などの当技術分野で公知の方法によって行われる。投与は、予防的、集団予防的、又は治療的に実施することができる。投与は全身的行ってもよい。

【0106】

したがって、本発明の一実施形態では、薬剤として使用するための式 (1) で表される化合物を提供する。別の実施形態では、抗内部寄生虫剤として使用するための式 (1) で表される化合物を提供する。別の実施形態では、駆虫剤として使用するための式 (1) で表される化合物であり、より具体的には殺線虫剤、殺扁形動物剤、殺鉤頭動物剤、又は殺舌形動物剤として使用するための式 (1) で表される化合物を提供する。別の実施形態では、抗原虫剤として使用するための式 (1) で表される化合物を提供する。別の実施形態では、抗外部寄生虫剤、特に殺節足動物剤、より具体的には殺虫剤又は殺ダニ剤として使用するための式 (1) で表される化合物を提供する。

40

【0107】

さらなる実施形態では、有効量の式 (1) で表される少なくとも1種の化合物と、薬学的に許容される賦形剤 (例えば、固体又は液体希釈剤)、薬学的に許容される補助剤 (例えば、界面活性剤) のうちの少なくとも1つを含む獣医学製剤を提供する。特に、式 (1) で表される少なくとも1種の化合物の有効量と、獣医学製剤に通常使用される薬学的

50

に許容される賦形剤及び／又は薬学的に許容される補助剤とを含む獣医学製剤を提供する。

【0108】

別の実施形態では、式（１）で表される少なくとも１種の化合物を、薬学的に許容される賦形剤及び薬学的に許容される補助剤のうちの少なくとも１つと混合する工程を含む、本明細書に記載の獣医学製剤の調製方法を提供する。薬学的に許容される賦形剤及び薬学的に許容される補助剤のうちの少なくとも１つは、獣医学製剤で通常使用されるものから選択してもよい。

【0109】

別の実施形態では、殺外部寄生虫製剤及び殺内部寄生虫製剤のうちの少なくとも１つとして作用する式（１）で表される化合物を含む獣医学製剤を提供する。前記獣医学製剤は、駆虫製剤、抗原虫製剤、及び殺節足動物製剤からなる群から選択される少なくとも１つとして作用してもよく、及びより具体的には、実施形態及び調製法に応じて、殺線虫製剤、殺扁形動物製剤、殺鉤頭動物製剤、殺舌形動物製剤、及び殺ダニ製剤からなる群から選択される少なくとも１つとして作用してもよい。

【0110】

別の実施形態では、寄生虫感染、特に外部寄生虫及び内部寄生虫からなる群から選択される寄生虫による感染の処置方法であって、式（１）で表される化合物の有効量を、それを必要とする動物、特に人間以外の動物に投与することを含む前記方法を提供する。

【0111】

別の実施形態では、寄生虫感染、特に外部寄生虫及び内部寄生虫からなる群から選択される寄生虫による感染の処置方法であって、本明細書で定義される獣医学製剤を、それを必要とする動物、特に人間以外の動物に投与することを含む前記方法を提供する。

【0112】

別の実施形態では、動物、特に人間以外の動物における寄生虫感染、特に外部寄生虫及び内部寄生虫からなる群から選択される寄生虫による感染の処置における式（１）で表される化合物の使用を提供する。

【0113】

動物衛生又は獣医学の分野の現在の文脈では、用語「処置」の範囲は、予防処置、予防的治療（metaphylactic）処置、及び治療処置を含む。

【0114】

別の実施形態において、本発明は、医薬の組み合わせ（「組み合わせ」は「混合物」と称される場合もある）、特に獣医学的組み合わせを提供し、前記組み合わせは：

- ・ １又は複数の上記定義の式（１）で表される化合物、及び
- ・ １又は複数のさらなる有効成分、特に１又は複数の殺内部寄生虫剤及び／又は殺外部寄生虫剤、を含む。

【0115】

本発明における用語「組み合わせ」は、当業者に知られているように使用され、この組み合わせは、固定の組み合わせ、非固定の組み合わせ、又はパーツからなるキットであることが可能である。

【0116】

本発明における「固定の組み合わせ」は、当業者に知られている意味で使用される。前記固定の組成物は、例えば、本発明の式（１）で表される１又は複数の化合物と１又は複数のさらなる有効成分とが一緒になって単位用量で又は単一のものとして存在する組み合わせである。「固定の組み合わせ」の一例は、式（１）で表される化合物及びさらなる有効成分が、製剤などの同時投与のための混合物中に存在する医薬組成物である。「固定された組み合わせ」の別の例は、式（１）で表される化合物とさらなる有効成分が混合されずに１つのユニットとして存在する医薬の組み合わせである。

【0117】

本発明における非固定の組み合わせ又は「パーツからなるキット」は、当業者に知られているように使用される。前記非固定の組み合わせは、例えば、式（１）で表される１又

10

20

30

40

50

は複数の化合物と1又は複数のさらなる有効成分とが2以上のユニットとして存在する組み合わせである。前記非固定の組み合わせ又はパーツからなるキットの1つの例は、式(1)で表される化合物とさらなる有効成分とが別々に存在する組み合わせである。前記非固定の組み合わせ又はパーツからなるキットは、別々に、順番に、同時に、並行して、又は時間的にずらして投与してもよい。

【0118】

式(1)で表される化合物は、単独の医薬品として、または許容できない副作用を引き起こさない1又は複数の他の医薬有効成分と組み合わせで投与してもよい。本発明は、そのような医薬の組み合わせも包含する。例えば、式(1)で表される化合物は、公知の殺外部寄生虫剤及び／又は殺内部寄生虫剤と組み合わせてもよい。

10

【0119】

本明細書中において「一般名」によって特定されている他の又はさらなる有効成分は、公知であり、そして、例えば、「殺虫剤マニュアル」(“The Pesticide Manual” 16th Ed., British Crop Protection Council 2012)に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、<http://www.alanwood.net/pesticides>)、また「Mehlhorn et al Encyclopaedic Reference of Parasitology 4th edition」(ISBN 978-3-662-43978-4)についても言及される場合がある。分類は、本特許出願の出願時点で最新のIRAC作用機序分類表(IRAC Mode of Action Classification Scheme)に基づく。

20

【0120】

本発明で使用してもよい殺虫剤、殺ダニ剤、及び殺線虫剤の例(殺外部寄生虫剤及び／又は殺内部寄生虫剤を含む)として、以下の薬品が挙げられるが、これらに限定されない：

(1) アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害薬、例えば、カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及びキシリルカルブ；又は有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファンフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル=O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンメチル、パラチオンメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロロホン、及びバミドチオン

30

40

(2) GABA作動性塩素チャネル遮断薬、例えば、シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン及びエンドスルファン、又はフェニルピラゾール系(フィプロール系)、例えば、エチプロール及びフィプロニル

(3) ナトリウムチャネル調節剤、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d-シーストランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリンS-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、β-シフルトリン、シハロトリン、λ-シハロトリン

50

、 γ -シハロトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、 β -シペルメトリン、 θ -シペルメトリン、 ζ -シペルメトリン、シフェノトリン〔(1R)-トランス-性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔(E Z)-(1R)-異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウフルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)-トランス-異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊（pyrethrum））、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)-異性体〕、トラロメトリン、及びトランスフルトリン、又はDDT、又はメトキシクロール

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）競合的調節剤、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及びチアメトキサム、又はニコチン、又はスルホキサフロル若しくはフルピラジフロル

10

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック調節剤、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム及びスピノサド

(6) グルタミン酸作動性塩素チャネル（GluCl）アロステリック調節剤、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及びミルベメクチン

(7) 幼若ホルモン類似剤、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン、キノブレン、及びメトブレン、又はフェノキシカルブ、又はピリプロキシフェン

20

(9) 弦音器官調節剤、例えば、ピメトロジン又はフロニカミド

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及びジフロビダジン、又はエトキサゾール

(12) ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤、例えばATPディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン、又は有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び酸化フェンブタスズ、又はプロパルギット、又はテトラジホン

(13) プロトン勾配の乱れを介した酸化的リン酸化脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、DNOC、及びスルフルアミド

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャネル遮断薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及びチオスルタップーナトリウム

30

(15) キチン生合成阻害薬（タイプ0）、例えば、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及びトリフルムロン

(16) キチン生合成阻害薬（タイプ1）、例えば、ブプロフェジン

(17) 脱皮攪乱物質（特に、双翅目用、すなわち双翅類用）、例えば、シロマジン

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及びテブフェノジド

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、アミトラズ

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン、又はアセキノシル、又はフルアクリピリム

40

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、例えば、METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及びトルフェンピラド、又はロテノン（Deris）

(22) 電位依存性ナトリウムチャネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ又はメタフルミゾン

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害薬、例えば、テトロノ酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及びスピロテトラマト

(25) ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬、例えば、 β -ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン及びシフルメトフェン、及びカルボキシアニリド類、例えば、ピフルブミド

50

(28) リアノジン受容体調節剤、例えば、ジアミド類、例えば、クロラントラニプロール、シアントラニプロール、及びフルベンジアミド。

【0121】

さらなる例としては、アフィドピロペン (Afidopyropen)、アフォキサネル (Afoxolaner)、アザジラクチン (Azadirachtin)、ベンクロチアズ (Benclothiaz)、ベンゾキシメート (Benzoximate)、ビフェナゼート (Bifenazate)、ブロフラニリド (Broflanilide)、ブロモプロピレート (Bromopropylate)、キノメチオナート (Chinomethionat)、クロロプラレスリン (Chloroprallethrin)、氷晶石 (Cryolite)、シクラニリプロール (Cyclaniliprole)、シクロキサプリド (Cycloxaprid)、シハロジアミド (Cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ (Dicloromezotiaz)、ジコホル (Dicofol)、ε-メトフルトリン (epsilon-Metofluthrin)、ε-モムフルトリン (epsilon-Momfluthrin)、フロメトキン (Flometoquin)、フルアザインドリジン (Fluazaindolizine)、フルエンスルホン (Fluensulfone)、フルフェネリム (Flufenerim)、フルフェノキシストロビン (Flufenoxystrobin)、フルフィプロール (Flufiprole)、フルヘキサホン (Fluhexafon)、フルオピラム (Fluopyram)、フルララネル (Fluralaner)、フルキサメタミド (Fluxametamide)、フフェノジド (Fufenozide)、グアジピル (Guadipyr)、ヘプタフルトリン (Heptafluthrin)、イミダクロチズ (Imidaclothiz)、イプロジオン (Iprodione)、κ-ビフェントリン (kappa-Bifenthrin)、κ-テフルトリン (kappa-Te fluthrin)、ロチラネル (Lotilaner)、メペルフルトリン (Meperfluthrin)、パイコングディング (Paichongding)、ピリダリル (Pyridalyl)、ピリフルキナゾン (Pyrifluquinazon)、ピリミノストロビン (Pyriminostrobin)、スピロジロジフェン (Spirobudiclofen)、テトラメチルフルトリン (Tetramethylfluthrin)、テトラニリプロール (Tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (Tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフェン (Tioxazafen)、チオフルオキシメート (Thiofluoximate)、トリフルメゾピリム (Triflumezopyrim)、及びヨードメタンなどのさらなる有効成分; バチルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づくさらなる調製物 (I-1582、BioNeem、Votivo); そして以下の化合物も挙げられる: 1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (国際公開第2006/043635号から公知) (CAS 885026-50-6)、{1'- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エン-1-イル] -5-フルオロスピロ [インドール-3, 4'-ピペリジン] -1 (2H) -イル} (2-クロロピリジン-4-イル) メタノン (国際公開第2003/106457号から公知) (CAS 637360-23-7)、2-クロロ-N- [2- {1- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エン-1-イル] ピペリジン-4-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (国際公開第2006/003494号から公知) (CAS 872999-66-1)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4.5] デカ-3-エン-2-オン (国際公開第2010052161号から公知) (CAS 1225292-17-0)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4.5] デカ-3-エン-4-イル炭酸エチル (欧州特許出願公開第2647626号から公知) (CAS 1440516-42-6)、4- (ブト-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3, 5-ジメチル

10

20

30

40

50

ピペリジン-1-イル) - 5-フルオロピリミジン (国際公開第2004/099160号から公知) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (日本国特許出願公開第2010/018586号から公知) (CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]ピリジン-2(1H)-イリデン]-2, 2, 2-トリフルオロアセトアミド (国際公開第2012/029672号から公知) (CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オン (国際公開第2013/144213号から公知) (CAS 1461743-15-6)、N-[3-(ベンジルカルバモイル)-4-クロロフェニル]-1-メチル-3-(ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (国際公開第2010/051926号から公知) (CAS 1226889-14-0)、5-ブromo-4-クロロ-N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)ピラゾール-3-カルボキサミド (中国特許出願公開第103232431号から公知) (CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)-ベンズアミド、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(トランス-1-オキシド-3-チエタニル)-ベンズアミド及び4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド (国際公開第2013/050317号(A1)から公知) (CAS 1332628-83-7)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]-プロパンアミド、(+)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]-プロパンアミド及び(-)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]-プロパンアミド (国際公開第2013/162715号(A2)、国際公開第2013/162716号(A2)、米国特許出願公開第2014/0213448号(A1)から公知) (CAS 1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-クロロ-2-プロペン-1-イル]アミノ]-1-[2, 6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル (中国特許出願公開第101337937号(A)から公知) (CAS 1105672-77-2)、3-bromo-N-[4-クロロ-2-メチル-6-[(メチルアミノ)チオキソメチル]フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(Liudaiben jiaxuanan、中国特許出願公開第103109816号(A)から公知) (CAS 1232543-85-9); N-[4-クロロ-2-[[1, 1-ジメチルエチル]アミノ]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (国際公開第2012/034403号(A1)から公知) (CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-bromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (国際公開第2011/085575号(A1)から公知) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2, 6-ジクロロ-4-[(3, 3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル)オキシ]フェノキシ]プロボキシ]-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)-ピリミジン (中国特許出願公開第101337940号(A)から公知) (CAS 1108184-52-6); (2E)-及び2(Z)-2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデ

10

20

30

40

50

ン] - N - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - ヒドラジンカルボキサミド (中国特許出願公開第 101715774 号 (A) から公知) (CAS 1232543-85-9) ; 3 - (2, 2 - ジクロロエテニル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - (1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) フェニル - シクロプロパンカルボン酸エステル (CN 103524422 (A) から公知) (CAS 1542271-46-4) ; (4aS) - 7 - クロロ - 2, 5 - ジヒドロ - 2 - [[(メトキシカルボニル) [4 - [(トリフルオロメチル) チオ] フェニル] アミノ] カルボニル] - インデノ [1, 2 - e] [1, 3, 4] オキサジアジン - 4a (3H) - カルボン酸メチルエステル (中国特許出願公開第 102391261 号 (A) から公知) (CAS 1370358-69-2) ; 6 - デオキシ - 3 - O - エチル - 2, 4 - ジ - O - メチル - , 1 - [N - [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ) フェニル] - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] カルバメート] - α - L - マンノピラノース (米国特許出願公開第 2014/0275503 号 (A1) から公知) (CAS 1181213-14-8) ; 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (CAS 1253850-56-4) , (8 - anti) - 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (CAS 933798-27-7) , (8 - syn) - 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ [3. 2. 1] オクタン (国際公開第 2007040280 号 (A1) , 国際公開第 2007040282 号 (A1) から公知) (CAS 934001-66-8) 及び N - [3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - [(3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) チオ] - プロパンアミド (国際公開第 2015/058021 号 (A1) , 国際公開第 2015/058028 号 (A1) から公知) (CAS 1477919-27-9) , が挙げられる。 [0122]

さらなる例として以下のものが挙げられる：

未知又は非特異的な作用機序を有する有効成分、例えばフェントリファニル、フェノキサクリム、シクロプレネ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシブルレ、フルテンジン、ブロモプロピレート、氷晶石；

その他のクラスに属する有効成分、例えばブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス (-エチル)、パラチオン (-エチル)、メタクリホス、 α -サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、デメトン-S-メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウタチオホス、アロムフェンビンホス (-メチル)、アジンホス (-エチル)、クロルピリホス (-エチル)、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリムホス；

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル；又はフェニルピラゾール類、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、シサプロニル；又はイソオキサゾリン類、例えば、サロラネル、アフォキサラネル、ロチラネル、フルララネル；

ピレスロイド類、例えば、(シス-、トランス-) メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、RU15525、テラレトリン、シス-レスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、フェンピリトリン、シス-シペルメトリン、シス-ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン (λ -)

、クロバポルトリン、又はハロゲン化炭化水素化合物（HCH類）；ネオニコチノイド類、例えば、ニチアジン；

ジクロロメゾチアズ、トリフルメゾピリム；及び

大環状ラクトン類、例えば、ネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エブリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチンベンゾエート；ミルベマイシンオキシム；トリブレン、エポフェノナン、ジオフェノラン。

さらなる例として以下が含まれる：

生物薬、ホルモン類又はフェロモン類、例えば、天然物、例えばチューリングエンシン（*thuringiensin*）、コドレモン又はニーム成分、

ジニトロフェノール類、例えば、ジノカップ、ジノブトン、ピナパクリル；

ベンゾイル尿素類、例えば、フルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム（*chlormebufom*）、シミアゾール、デミジトラズ、及び

ミツバチヘギイタダニ（*beehive varroa*）殺ダニ剤、例えば有機酸類、例えば、ギ酸、シュウ酸。

【0123】

動物衛生における使用に好ましい殺虫剤及び殺ダニ剤には、以下が含まれるが、これらに限定されない：

クロルデン、ヘプタクロル、エンドカルファン、ディルドリン、ブromoサイクレン、トキサフェン、リンデン、フィプロニル、ピリプロール、シサプロニル、アフォキサネル、フルララネル、サロラナー、ロチラナー、フラキサメタミド、プロフラニリド、アベルメクチン、ドラメクチン、エブリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、及びセラメクチンなどの、節足動物のリガンド依存性塩素チャネルのエフェクター；

アミトラズ、BTS27271、シミアゾール、及びデミジトラズなどの、節足動物のオクトパミン作動性受容体調節剤；

DDT、メトキシクロール、メタフルミゾン、インドキサカルブ、シネリンI、シネリンII、ジャスモリンI、ジャスモリンII、ピレトリンI、ピレトリンII、アレトリン、 α -シベルメトリン、バイオアレトリン、ベタシフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、エトフェンプロックス、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、ハルフェンプロックス、ベルメトリン、フェノトリン、レスメトリン、 ϵ -ールバリネート、及びテトラメトリンなどの、節足動物の電位依存性ナトリウムチャネルのエフェクター；

ブromoプリピレート、ベンジオカルブ、カルバリル、メトミル、プロマシル、プロボクスル、アザメチホス、クロルフェンビンホス、クロルピリホス、クマホス、シチオエート、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、エチオン、ファンファー、フェニトロチオン、フェンチオン、ヘプテノホス、マラチオン、ナレド、ホスメット、ホキシム、フタロホス、プロペタンホス、テメホス、テトラクロルビンホス、トリクロルホン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ジノテフラン、スピノサド、及びスピネトラムなどの、節足動物のニコチン性コリン作動性シナプスのエフェクター（アセチルコリンエステラーゼ、アセチルコリン受容体）；及び

シロマジン、ジシクラニル、ジフルベンズロン、フルアズロン、ルフェヌロン、トリフルムロン、フェノキシカルブ節、ヒドロブレン、メトブレン、ピリプロキシフェン、フェノキシカルブ、ヒドロブレン、S-メトブレン、及びピリプロキシフェンなどの、節足動物発達段階におけるエフェクター。

【0124】

混合パートナーとしての殺内部寄生虫剤の群に属する例示的な有効成分としては、限定されるものではないが、駆虫活性化化合物及び抗原虫活性化化合物が挙げられる。

【0125】

駆虫活性化化合物には、以下の殺線虫、殺吸虫及び／又は殺条虫活性化化合物が含まれるが

、これらに限定されない：

大環状ラク톤のクラスに属するものとしては、例えば、エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、及びミルベマイシン；

ベンズイミダゾール系及びプロベンズイミダゾールのクラスに属するものとしては、例えば、オキシベンダゾール、メベンダゾール、トリクラベンダゾール、チオファネート、パルベンダゾール、オクスフェンダゾール、ネトビミン、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール、シクロベンダゾール、カンベンダゾール、アルベンダゾール、スルホキシド、アルベンダゾール、及びフルベンダゾール；

デブシペプチドのクラスに属するものとしては、例えば、環状デブシペプチド、特に 24 員の環状デブシペプチド、例えば、エモデブシド及び P F 1 0 2 2 A ；

テトラヒドロピリミジンのクラスに属するものとしては、例えば、モランテル、ピランテル、及びオキサランテル；

イミダゾチアゾールのクラスに属するものとしては、例えば、ブタミゾール、レバミゾール、及びテトラミゾール；

アミノフェニルアミジンのクラスに属するものとしては、例えば、アミダンテル、脱アシル化アミダンテル（d A M D）、及びトリベンジミジン；

アミノアセトニトリルのクラスに属するものとしては、例えば、モネパンテル；

パラヘルクアミドのクラスに属するものとしては、例えば、パラヘルクアミド及びデルカンテル；

サリチルアニリドのクラスに属するものとしては、例えば、トリブロムサラン、プロモキサニド、プロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、及びラフォキサニド；

置換フェノールのクラスに属するものとしては、例えば、ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロフォラン、及びメニクロホラン；

有機リン酸エステルのクラスに属するものとしては、例えば、トリクロロホン、ナフタロホス、ジクロロボス／D D V P、クルホメート、クマホス、及びハロキソン；

ピペラジノン系／キノリンのクラスに属するものとしては、例えば、プラジカンテル及びエブシプランテル；

ピペラジンのクラスに属するものとしては、例えば、ピペラジン及びヒドロキシジン；

テトラサイクリンのクラスに属するものとしては、例えば、テトラサイクリン、クロルテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、及びロリトラサイクリン；及び

その他の種々のクラスに属するものとしては、例えば、ブナミジン、ニリダゾール、レゾランテル、オンファロチン、オルチプラズ、ニトロスカネート、ニトロキシニル、オキサムニキン、ミラサン、ミラシル、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン、エメチン、及びジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、ジアンフェネチド、クロナゼパム、ベフェニウム、アモスカネート、クロルスロン。

抗原虫活性化化合物としては、以下の活性化化合物が挙げられるが、これらに限定されない：

トリアジンのクラスに属するものとしては、例えば、ジクラズリル、ポナズリル、レトラズリル、及びトルトラズリル；

ポリエーテルイオノフォアのクラスに属するものとしては、例えば、モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、及びナラシン；

大環状ラク톤のクラスに属するものとしては、例えば、ミルベマイシン及びエリスロマイシン；

キノロンのクラスに属するものとしては、例えば、エンロフロキサシン及びブラドフロキサシン；

キノーネのクラスに属するものとしては、例えば、クロロキン；

ピリミジンのクラスに属するものとしては、例えば、ピリメタミン；

スルホンアミドのクラスに属するものとしては、例えば、スルファキノキサリン、トリ

10

20

30

40

50

メトプリム、及びスルファクロジン；

チアミンのクラスに属するものとしては、例えば、アンプロリウム；

リンコサミドのクラスに属するものとしては、例えば、クリンダマイシン；

カルバニリドのクラスに属するものとしては、例えば、イミドカルブ；

ニトロフランのクラスに属するものとしては、例えば、ニフルチモックス；

キナゾリノンアルカロイドのクラスに属するものとしては、例えば、ハロフジノン；

種々のクラスに属するものとしては、例えば、オキサムニキン及びパロモマイシン；

微生物由来のワクチン系又は抗原のクラスに属するものとしては、微生物の例として、バベシア・カニス・ロッシ (*Babesia canis rossii*)、アイメリア・テナラ (*Eimeria tenella*)、アイメリア・プレコックス (*Eimeria praecox*)、アイメリア・ネカトリックス (*Eimeria necatrix*)、アイメリア・ミチス (*Eimeria mitis*)、アイメリア・マキシマ (*Eimeria maxima*)、アイメリア・ブルネッティ (*Eimeria brunetti*)、アイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、バベシア・カニス・ボゲリ (*Babesia canis vogeli*)、リーシュマニア・インファントム (*Leishmania infantum*)、バベシア・カニス・カニス (*Babesia canis canis*)、及びディクチオカウルス・ビビパラス (*Dictyocaulus viviparus*)。名称が言及された混合パートナーは、それぞれ、自身の官能基が塩の形成を可能にするならば、適切な塩基又は酸と塩を形成してもよい。

【0126】

式(1)で表される化合物は、媒介生物 (vector) の防除にも使用でき得る。本発明においては、媒介生物 (vector) とは、保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) からウイルス、蠕虫、単細胞生物、及び細菌などの病原体を宿主へ伝播することができる節足動物、特に昆虫またはクモ形類である。病原体は、機械的に (例えば、刺さないハエによるトラコーマの伝播) 宿主に、又は宿主への刺入 (例えば、蚊によるマラリア原虫の伝播) により運ばれうる。

【0127】

媒介生物 (vector) 及び媒介生物 (vector) によって伝播される疾患又は病原体の例は、以下のとおりである：

1) 蚊類

－ハマダラカ (*Anopheles*)：マラリア、フィラリア症；

－アカイエカ (*Culex*)：日本脳炎、別のウイルス性疾患、フィラリア症、他の蠕虫類の伝播；

－ヤブカ (*Aedes*)：黄熱病、デング熱、別のウイルス性疾患、フィラリア症；

－ブユ (*Simuliidae*)：蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)) の伝播；

－チョウバエ類 (*Psychodidae*)：レーシュマニア症の伝播；

2) シラミ類：皮膚感染、流行性発疹チフス；

3) ノミ類：伝染病、発疹熱、条虫；

4) ハエ類：睡眠病 (トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

5) ダニ類：ダニ症 (*acariosis*)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (*borreliosis*)；

6) マダニ類：ボレリア症 (*borellioses*)、例えば、ボレリア・ブングドルフェリ・センス・ラト (*Borrelia burgdorferi sensu lato*)、ダットン回帰熱ボレリア (*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (*Coxiella burnetii*)、バベシア症 (*Babesia canis canis*)、エーリキア症。

【0128】

10

20

30

40

50

本発明において、媒介生物 (vector) のさらなる例は、病原体を動物及び／又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類 [特に、ヤブカ属 (*Aedes*) の蚊、ハマダラカ属 (*Anopheles*) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (*A. gambiae*)、アノフェレス・アラビエンシス (*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネスツス (*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス (*A. dirus*) (マラリア)、及び、アカイエカ属 (*Culex*) の蚊]、チョウバエ類、例えばサシチョウバエ、ルツオミヤ属、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類、及びマダニ類である。

【0129】

式 (I) に表される化合物が抵抗性を打破する (resistance-breaking) 場合でも、媒介生物 (vector) の防除は可能である。式 (I) に表される化合物は、疾患の予防及び／又は媒介生物 (vector) によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。よって、本発明のさらなる態様は、動物衛生分野における媒介生物 (vector) の防除のための式 (1) で表される化合物の使用である。本発明のさらなる態様は、人間健康分野における媒介生物 (vector) の防除のための式 (1) で表される化合物の使用である。

【0130】

有効成分としての式 (1) で表される化合物は、農業、園芸、及び貯蔵穀物製品におけるイネ、果樹、野菜、その他の作物並びに花及び観賞植物に被害を与える様々な害虫又は衛生害虫防除に使用することができる。式 (1) で表される化合物によって防除できる生物の例には、線虫などの害虫も含まれる。さらに、式 (1) で表される化合物は、以下のものに対して強い殺虫効果を有する：ワタヘリクロノメイガ (*Diaphania indica*)、オリエンタルティートータスガ (*Homona magnanima*)、ハイマダラノメイガ (*Hellulla undalis*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワヒメハマキ (*Olethreutes mori*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*)、カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*)、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*, *Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerrina astaurota*)、アゲハチョウ (*Papilio xuthus*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、コドリリング (*Cydia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ (*Ephestia elutella*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyloalis*)、イッテンオオメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ (*Parnara guttata*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*) などのチョウ目； アスタ

10

20

30

40

50

ーヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onuki*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ (*Aleurolobus taonabae*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bermisia argentifolii*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ミカンミドリアブラムシ (*Aphis Citricola*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus Comstocki*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria auranti*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis pernicios*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia Stali*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*)、アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*)、イネホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*) などのカメムシ目；ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、インゲンテントウ (*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム (*Diabrotica sp.*)、ハリガネムシ (*Agriotes sp.*)、キボシカミキリ (*Psacothoe hiliaris*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*) などの甲虫類；ミカンコミバエ (*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Delia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia sp.*)、イエバエ (*Musca domestica*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、ナスハモグリバエ (*Liriomyza bryoniae*)、蚊 (例えば、ガンビエハマダラカ (*Anopheles gambiae*)、ハマダラカアラビエンシス (*Anopheles arabiensis*)、アノフェレス・フネスツス (*Anopheles funestus*)、アノフェレス・メラス (*Anopheles melas*)、コガタハマダラカ (*Anopheles minimus*)、アノフェレス・ダイラス (*Anopheles dirus*)、アノフェレス・ステフェンシ (*Anopheles stephensi*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、アノフェレス・アルビマナス (*Anopheles albimanus*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus*)、トビイロイエカ (*Culex p*

10

20

30

40

50

ipiens pipiens)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、クレックス・レスツアンス (*Culex restuans*)、クレックス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、コガネモドキ (*Culex modestus*)、*Culex tritaeniorhynchus*、アエデス・アエジプティ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクタス (*Aedes albopictus*)、アエデス・ジャポニカス (*Aedes japonicas*)、アエデス・ベクスアン (*Aedes vexans*) などの双翅目；ニホンカブラバチ (*Athalia japonica*)、カブラハバチ (*Athalia rosae ruficornis*)、リンゴハバチ (*Arge mali*)、チュウレンジバチ (*Arge pagana*)、クリタマバチ (*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ (*Formica japonica*) などのハチ目；チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、シクラメンダニ (*Steneotarsonemus pallidus*)、アシボソホコリダニ (*Tarsonemus waiti*)、シラミダニ (*Pyemotes ventricosus*)、ムギダニ (*Penthaleus major*)、ブドウヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi*)、チャノヒメハダニ (*Brevipalpus obovatus*)、パイナップルヒメハダニ (*Dolichotetranychus floridanus*)、カキヒメハダニ (*Tenuipalpus zhizhilashviliae*)、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*)、クローバービラハダニ (*Bryobia praetiosa*)、アンズハダニ (*Eotetranychus boreus*)、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、チャノナガサビダニ (*Acaaphylla theae*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ブドウサビダニ (*Calepitrimerus vitis*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、アシブトコナダニ (*Acarus siro*)、ムギコナダニ (*Aleuroglyphus ovatus*)、ロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*)、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、タテツツガムシ (*Leptotrombidium scutellaris*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*) などのダニ目；ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus* sp.)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ジャガイモシロシストセンチュウ (*Globodera pallida*)、シストセンチュウ (*Heterodera* sp.)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、ライスホワイトチップセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*) などの線形動物；ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、キイロハナアザミウマ (*Thrips flavus*)、ネギアザミウマ (*Thrips t*

10

20

30

40

50

abaci) などのアザミウマ目；ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*) などのシロアリ類；チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*) などのバッタ目。

【0131】

有効成分としての式 (1) で表される化合物は、様々な水田作物、畑作物、果樹、野菜、他の作物、及び園芸製品に損傷を与える上記害虫に対して顕著な殺虫効果を有する。よって、上述のような害虫の出現が予想される季節の間、又は害虫の出現前若しくは出現時点で、水田の水、植物の茎及び葉、又は水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物、及び花や観賞植物の作物の土壌を処置することにより本発明の殺虫効果が得られる。

10

【0132】

一実施形態によれば、式 (1) で表される化合物を有効成分として含む園芸用又は農業用殺虫剤を提供する。別の実施形態によれば、有害生物から作物を保護する方法であって、前記方法は作物を、又は作物のための土壌を有効量の式 (1) で表される化合物で処置することを含む前記方法を提供する。

一実施形態によれば、式 (1) で表される化合物を不活性キャリアと混合し、さらに所望により補助剤と混合した組成物を提供する。別の実施形態では、少なくとも 1 種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて式 (1) で表される化合物を含む混合物を提供する。

20

【0133】

式 (1) で表される化合物は、一般に、用途に応じた適切な製剤形態で使用され、農業及び園芸化学物質の調製のための従来の方法によって調製される。すなわち、式 (1) で表される化合物は、懸濁液、エマルジョン、液体製剤、水分散性粉末、顆粒、粉剤、錠剤などの適切な製剤の形態で使用する事ができ、必要であれば前記化合物を適切な不活性キャリア及び補助剤のうちの少なくとも一方と適切な割合でブレンドし、続いて成分の溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着、又は付着を行うことにより調製される。

【0134】

本発明で使用可能な不活性キャリアは、固体でも液体でもよく、特に、大豆粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、粗粉、タバコ粉、クルミ殻粉、ふすま、セルロース粉、植物抽出物からの残渣、粉碎合成樹脂などの合成ポリマー、粘土（例えば、カオリン、ベントナイト、酸性白粘土）、タルク（例えば、タルク、パイロフィライトなど）、シリカ（例えば、珪藻土、砂、雲母、ホワイトカーボン（含水シリカ粉末、合成高分散性ケイ酸と呼ばれる含水シリカ粉末；主成分としてケイ酸カルシウムを含む製品もある））、活性炭、硫黄粉末、軽石、焼成珪藻土粉末、粉碎レンガ、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウムやリン酸カルシウムなどの無機鉱物粉末、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素、塩化アンモニウムなどの化学肥料、及び堆肥が挙げられ、これらは単独で又は 2 種以上の混合物の形態で使用される。

30

【0135】

液体の形で不活性キャリアとして使用できる材料の例には、溶媒としての機能を有するもの、並びに溶媒としての機能を持たないが、補助剤の作用により有効成分化合物を分散させることができるものが含まれる。不活性キャリアの例として、水、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、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、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノンなど）、エーテル類（例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフランなど）、脂肪族炭化水素類（例えば、灯油、鉱油など）、芳香族炭化水素類（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレンなど）、ハロゲン化炭化水素類（例え

40

50

ば、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロカーボン、クロロベンゼンなど）、エステル類（例えば、酢酸エチル、酢酸ブチル、プロピオン酸エチル、フタル酸ジイソブチル、フタル酸ジブチル、フタル酸ジオクチルなど）、アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなど）、及びニトリル類（例えば、アセトニトリルなど）が挙げられ、これらは単独で又は２種以上の混合物の形態で使用される。

【０１３６】

補助剤の例としては、以下の補助剤が挙げられ、目的に応じて単独で又は２種以上を組み合わせて使用されるが、補助剤を使用しないことも可能である。

【０１３７】

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的で、界面活性剤を使用してもよい。界面活性剤の例として、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリアルスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、リグニンスルホン酸、及び高級アルコールスルホン酸エステルが挙げられる。

【０１３８】

有効成分化合物の分散安定化、接着及び／又は結合の目的で使用する補助剤の例として、カゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、コーン油、ベントナイト、キサンタンガム、及びリグニンスルホン酸塩が挙げられる。

【０１３９】

固体製品の流動性を改善する目的で使用する補助剤の例として、ワックス、ステアリン酸塩、及びリン酸アルキルエステルが挙げられる。ナフタレンスルホネート縮合生成物又は縮合リン酸塩などの補助剤は、懸濁液中の懸濁剤として使用してもよい。シリコンオイルなどの消泡剤も補助剤として使用できる。

【０１４０】

さらに、式（１）で表される化合物は、光、熱、酸化などに対して安定であるが、必要に応じて、安定剤を添加することにより、より安定した組成物を得ることができる。安定剤の例として、抗酸化剤、紫外線吸収剤、BHT（２，６－ジ－tert－ブチル－４－メチルフェノール）などのフェノール誘導体、BHA（ブチルヒドロキシアニソール）、ビスフェノール誘導体、フェニル－α－ナフチルアミンやフェニル－β－ナフチルアミンなどのアリアルアミン、フェネチジンとアセトンとの縮合生成物、及びベンゾフェノン化合物が挙げられる。

【０１４１】

式（１）で表される化合物の有効量は、通常、粉剤中の０．５～２０重量％、エマルジョン中の５～５０重量％、水分散性粉末中の１０～９０重量％、顆粒中の０．１～２０重量％、及び流動性剤中の１０～９０重量％である。一方、各製剤中のキャリアの量は、通常、粉剤中の６０～９９重量％、エマルジョン中の４０～９５重量％、水分散性粉末中の１０～９０重量％、顆粒中の８０～９９重量％、及び流動性剤中の１０～９０重量％である。上記のような補助剤の量は、通常、粉剤中の０．１～２０重量％、エマルジョン中の１～２０重量％、水分散性粉末中の０．１～２０重量％、顆粒中の０．１～２０重量％、及び流動性剤中の０．１～２０重量％である。

【０１４２】

様々な害虫を防除するために、ある量の植物病害防除に有効な有効成分としての式（１）で表される化合物をそのまま、あるいは水で適切に希釈して、あるいは懸濁液として、対応する害虫の発生が予想される作物又はそのような発生が好ましくない場所に投与してもよい。使用量は、目的、防除対象の害虫、植物の成長状態、害虫の発生傾向、気候、環境条件、製剤、使用方法、使用場所、使用時期などによる。有効成分としての式（１）で表される化合物を０．０００１～５０００ ppm、好ましくは０．０１～１０００ ppm

10

20

30

40

50

の濃度で使用することが好ましい。約 10 a (エーカー) で使用できる式 (1) で表される化合物の用量は、一般に、当該有効成分が 1 ~ 300 g である範囲である。

【0143】

有効成分としての式 (1) で表される化合物は、農業、園芸、及び貯蔵穀物製品におけるイネ、果樹、野菜、その他の作物や花に被害を与える様々な害虫又は衛生害虫若しくは線虫類の防除に単独で使用する事ができる。さらに、同時に発生する様々な害虫に対して優れた防除効果を得るために、式 (1) で表される化合物を少なくとも 1 種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて使用してもよい。

【0144】

害虫を防除するための本発明の混合製剤 (混合物) に関して、式 (1) で表される化合物と組み合わせることができる化合物としての殺虫剤、殺ダニ剤又は殺線虫剤の例として、ピレスロイド系化合物、有機リン系化合物、オキシムカルバメート系化合物、カルバメート系化合物、ネオニコチノイド系化合物、ジアシルヒドラジン系化合物、ベンゾイル尿素系化合物、幼若ホルモン系化合物、シクロジエン有機塩素系化合物、2-ジメチルアミノプロパン-1, 3-ジチオール系化合物、アミジン系化合物、フェニルピラゾール系化合物、有機スズ系化合物、METI系化合物、ベンジレート系化合物、アリルピロール系化合物、ジニトロフェノール系化合物、アントラニルジアミド系化合物、オキサジアジン系化合物、セミカルバゾン系化合物、テトロン酸系化合物、カルバモイルトリアゾール系化合物、又はテトラジン系化合物からなる群から選択される化合物が挙げられる。式 (1) で表される化合物と組み合わせることができる殺菌剤の例として、ストロビルリン系化合物、アニリノピリミジン系化合物、アゾール系化合物、アゾール系化合物、ジチオカルバメート系化合物、フェニルカルバメート系化合物、有機塩素系化合物、ベンズイミダゾール系化合物、フェニルアミド系化合物、スルフェン酸系化合物、銅系化合物、イソオキサゾール系化合物、有機リン系化合物、N-ハロゲンチオアルキル系化合物、カルボキシアニリド系化合物、モルホリン系化合物、有機スズ系化合物、及びシアノピロール系化合物が挙げられる。クロロピクリンなどの燻蒸剤又は例えばニコチンといった天然物化合物も、式 (1) で表される化合物と組み合わせて使用してもよい。

【0145】

式 (1) で表される化合物と組み合わせて使用され得る化合物の例には、上記の群以外の化合物がさらに含まれる。具体例には、以下の化合物が含まれる：

アクリナトリン、アレトリン [(1R) - 異性体]、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン S-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シフェノトリン [(1R) - ートランス異性体]、デルタメトリン、エンペントリン [(E Z) - (1R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウフルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、メトトリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1R) - ートランス異性体]、プラレトリン、レスメトリン、RU15525 (カデトリン)、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1R) 異性体]、トラロメトリン、トランスフルトリン、ZXI8901、ピオペルメトリン、フラメトリン、プロフルトリン、フルプロシトリネート、及びジメフルトリンなどのピレスロイド系化合物及びそれらの様々な異性体；

アセフェート、アザメチホス、アジンホスメチル、アジンホスエチル、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、CYAP (シアノホス)、デメトン-S-メチル、ダイアジノン、ECP (ジクロフェンチオン)、DDVP (ジクロロホス)、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン (エチルチオメトン)、EPN (O-エチル=O-4-ニトロフェニル=フェニルホスホノチオエート)、エチオン、エトプロホス、ファン

フル、フェナミホス、MEP（フェニトロチオン）、MPP（フェンチオン）、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソフェンホスメチル、イソカルボホス（イソプロピル＝O-メトキシアミノチオホスホリル）サリチラート）、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、DMTP（メチダチオン）、メビンホス、モノクロトホス、BRP（ナレド）、オメトエート オキシデメトンメチル、パラチオン、パラチオンメチル、PAP（フェントエート）、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロベタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、チオメトン、トリアゾホス、DEP（トリクロロホン）、バミドチオン、バイエル（Bayer）22/190（クロロチオン）、ブロムフェンビンホス、ブromoホス、ブromoホスエチルブタチオホス、カルボフェノチオン、クロルホキシム、スルプロホス、ジアミダホス、CVMP（テトラクロロビンホス）、プロパホス、メスルフェンホス、ジオキサベンゾホス（サリシオン）、エトリムホス、オキシデプロホス、フォルモシオン、フェンシルホチオン、イサゾホス、イミシアホス（AKD3088）、イサミドホス、チオナジン、及びホスチエタンなどの有機リン系化合物；

10

ホスホカルブ、アラニカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、チオジカルブ、及びチオファノックスなどのオキシムカルバメート系化合物；

アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、NAC（カルバリル）、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、BPMC（フェノブカルブ）、ホルメタネート、フラチオカルブ、MIPC（イソプロカルブ）、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカーブ、PHC（プロボクスル）、トリメタカルブ、XMC（3，5-キシリルメチルカルバメート）、アリルオキシカルブ、アルドキシカルブ、ブフェンカルブ、ブタカルブ、カルバノレート、MTMC（メトルカルブ）、MPMC（キシリルカルブ）、フェノチオカルブ、キシリルカルブ、及びベンダイオカルブなどのカルバメート系化合物；

20

アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及びチアメトキサムなどのネオニコチノイド系化合物；

クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及びテブフェノジドなどのジアシルヒドラジン系化合物、

ビストリフルロン、クロルツアズロン、ジトルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及びトリフルムロンなどのベンゾイル尿素系化合物；

30

フェノキシカルブ、ハイドロブレン、キノブレン、メトブレン、ピリプロキシフェン、メトブレン、及びハイドロブレンなどの幼若ホルモン系化合物；

クロルデン、エンドスルファン、リンデン（ γ -HCH）、及びジエノクロルなどのシクロジエン有機塩素系化合物；

カルタップ塩酸塩及びチオシクラムなどの2-ジメチルアミノプロパン-1，3-ジチオール系化合物；

アミトラズなどのアミジン系化合物；

エチプロール、フィプロニル、及びアセトプロールなどのフェニルピラゾール系化合物；

40

アゾシクロスズ、シヘキサチン、及び酸化フェンブタチンなどの有機スズ系化合物；

フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリダベン、ピリミフェン、テブフェンピラド、又はトルフェンピラドなどのミトコンドリア電子伝達阻害剤（METI（mitochondrial electron transport inhibitor））系化合物；

ブromoプロピレートなどのベンジレート系化合物；

クロルフェナピルなどのアリルピロール系化合物；

ジニトロオルトクレゾール（DNOC（dinitro-ortho-cresol）

）又はビナパクリルなどのジニトロフェノール系化合物；

クロラントラニリプロール及びシアントラニリプロールなどのアントラニルジアミド系

50

化合物；

インドキサカルブなどのオキサジアジン系化合物；

メタフルミゾンなどのセミカルバゾン系化合物；

スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及びスピロテトラマトなどのテトロン酸系化合物；

トリアザメートなどのカルバモイルトリアゾール系化合物；

ジフロビダジンなどのテトラジン系化合物；

アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レピメクチン、アセキノシル、アザジラクチン、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロロフェジン、C C A-50439、キノメチオナート、クロフェンテジン、氷晶石、シロマジン、ダゾメット、ジクロロジイソプロピルエーテル（D C I P）、ジクロロジフェニルトリクロロエタン（D D T）、ジアフェンチウロン、D-D（1，3-ジクロロプロペン）、ジコホル、ジシクラニル、ジノブトン、ジノカップ、E N T 8184、エトキサゾール、フロニカミド、フルアクリピリム、フルベンジアミド、G Y-81（過炭酸ナトリウム）、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン、シアン化水素、ヨードメタン、カラジン、M B-599（ベルブチン）、塩化水銀、メタム、メトキシクロール、イソチオシアン酸メチル、ペンタクロロフェノール、ホスフィン、ピペロニルブトキシド、ポリナクチン複合体、B P P S（プロパルギット）、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダリル、ロテノン、S 421（ビス（2，3，3，3-テトラクロロプロピル）エーテル）、サバディラ（s a b a d i l l a）、スピノサド、スピネトラム、スルコフロンナトリウム、スフルラミド、テトラジホン、チオスルタップ、トリブホス、アルドリン、アミジチオン、アミドチオエート、アミノカルブ、アミトン、アラマイト、アチダチオン、アゾトエート、ポリ硫化バリウム、バイエル（B a y e r）22408、バイエル（B a y e r）32394、ベンクロチアズ、5-（1，3-ベンゾジオキソール-5-イル）-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン、1，1-ビス（4-クロロフェニル）-2-エトキシエタノール、ブトネート、ブトピロノキシル、2-（2-ブトキシエトキシ）エチルチオシアンナート、カンフェクロル、クロルベンシド、クロルデコン、クロルジメホルム、クロルフェネトール、クロルフェンソン、イソプロチオラン、フルアズロン、メタアルデヒド、フェニソプロモレート、フルアジナム、ビアラホス、ベノミル、レバミゾール、ピリフルキナゾン、シフルメトフェン、アミドフルメト、I K A-2005、シエノピラフェン、スルホキサフロル、ピラフルプロール、ピリプロール、トラロピリル、フルピラゾホス、ジオフェノラン、クロロベンジレート、フルフェンジン、ベンゾメート、フルフェネリム、トリプロピルイソシアヌレート（T P I C）、アルベンダゾール、オキシベンダゾール、フェンベンダゾール、メタムナトリウム、1，3-ジクロロプロペン、フルピラジフロル、アフイドピロペン、フロメトキン、ピフルブミド、フルエンズルホン、テトラニリプロール、シクラニリプロール、フラキサメタミド、プロフラニリド、ジクロロメゾチアズ、トリフルメゾピリム、フルアザインドリジン、チオキサザフェン、及びフルヘキサホンなどの殺虫剤、殺ダニ剤、及び殺線虫剤；

アゾキシストロビン、クレソキシムメチル、トリフロキシストロビン、メトミノストロビン、及びオリサストロビンなどのストロビルリン系化合物；

メパニピリム、ピリメタニル、及びシプロジニルなどのアニリノピリミジン系化合物；

トリアジメフォン、ピテルタノール、トリフルミゾール、メトコナゾール、プロピコナゾール、ペンコナゾール、フルシラゾール、ミクロブタニル、シプロコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、及びシメコナゾールなどのアゾール系化合物；

キノメチオネートなどのキノキサリン系化合物；

マネブ、ジネブ、マンコゼブ、ポリカルバメート、及びプロピネブなどのジチオカルバメート系化合物；

ジエトフェンカルブなどのフェニルカルバメート系化合物；

クロロタロニル及びキントゼンなどの有機塩素系化合物；

10

20

30

40

50

ベノミル、チオファネートメチル、及びカルベンダゾールなどのベンズイミダゾール系化合物；

メタラキシル、オキサジキシル、オフラーゼ、ベナラキシル、フララキシル、及びシプロプラムなどのフェニルアミド系化合物；

ジクロフルアニドなどのスルフェン酸系化合物；

水酸化銅及びオキシ銅などの銅系化合物；

ヒドロキシイソオキサゾールなどのイソオキサゾール系化合物；

ホセチルアルミニウム及びトルクロホスメチルなどの有機リン系化合物；

キャプタン、キャプタフォール、及びフォルペットなどのN-ハロゲノチオアルキル系化合物；

プロシミドン、イプロジオン、及びピンクロゾリンなどのジカルボキシイミド系化合物；

フルトラニル、メプロニル、フラメトピル、チフルザミド、ボスカリド、及びペンチオピラドなどのカルボキシアニリド系化合物；

フェンプロピモルフ及びジメトモルフなどのモルホリン系化合物；

水酸化フェンチン及び酢酸フェンチンなどの有機スズ系化合物；

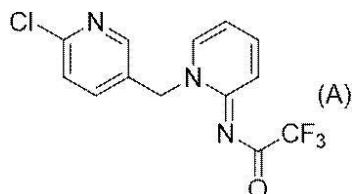
フルジオキソニル及びフェンピクロニルなどのシアノピロール系化合物；

トリシクラゾール、ピロキロン、カルプロバミド、ジクロシメット、フェノキサニル、フタリド、フルアジナム、シモキサニル、トリフォリン、ピリフェノックス、フェナリモール、フェンプロピジン、ペンシクロン、フェリムゾン、シアゾファミド、イプロバリカルブ、ベンチアバリカルブーイソプロピル、イミノオクタジンールベシル酸塩、シフルフェナミド、カスガマイシン、バリダマイシン、ストレプトマイシン、オキソリン酸、テブフロキン、プロベナゾール、チアジニル、イソチアニル、トルプロカルブ、イソフェタミド、フェンピコキサミド、キノフメリン、ピジフルメトフェン、ジピメチトロン、及びピラジフルミドなどの殺菌剤；

クロルピクリン、二臭化エチレン（EDB）、フッ化スルフリル、アクリロニトリル、ビス（2-クロロエチル）エーテル、1-ブromo-2-クロロエタン、3-ブromo-1-クロロプロプ-1-エン、ブromoシクロン、二硫化炭素、テトラクロロメタン、メタムナトリウム、ネマデクチン、及びリン化アルミニウムなどの燻蒸剤；

バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）デルタ内毒素、ハウ砂、多硫化カルシウム、氷晶石、サイトカイニン、ニコチン、2-（オクチルチオ）エタノール、オレイン酸カリウム、オレイン酸ナトリウム、機械油、硫黄、タール油、アナバシン、酒石酸モランテル、除虫菊、ニコチン硫酸塩、菜種油、大豆レシチン、デンプン、ヒドロキシプロピルデンプン、デカノイルオクタノイルグリセロール、プロピレングリコール脂肪酸エステル、珪藻土、及びバチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）などの天然化合物、そしてさらに、下記式（A）で表される化合物及びその塩。

【化5】



【0146】

式（1）で表される化合物が少なくとも1種の他の殺虫剤及び／又は殺菌剤と組み合わせて使用される場合、式（1）で表される化合物と他の殺虫剤及び／又は殺菌剤との混合組成物を使用してもよい。あるいは、式（1）で表される化合物と他の殺虫剤／殺菌剤とを投与時に混合して、使用してもよい。

【0147】

式（1）で表される化合物と他の殺虫剤及び／又は殺菌剤との混合物に関して、式（1

）で表される化合物と他の殺虫剤及び／又は殺菌剤との混合比は、特に限定されるものではないが、「本発明の化合物：他の殺虫剤及び／又は殺菌剤」として表した場合、0.01：100～100：0.01、又は0.1：100～100：0.1、又は1：100～100：1、又は1：10～10：1、又は1：1（全て重量比）である。また、上記範囲の上限又は下限を他の範囲の上限又は下限に置き換えた任意の範囲も、本発明における混合比範囲として想定される。

【0148】

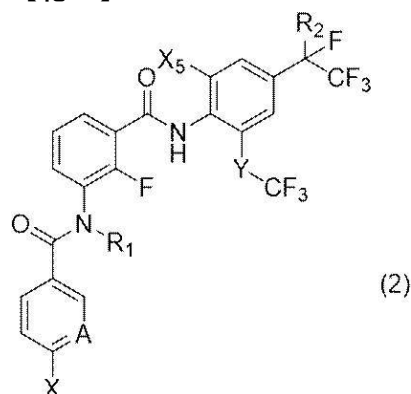
上記の殺虫剤又は殺菌剤に加えて、又はその代わりに、式（1）で表される化合物は、高い効能を有する多目的組成物を形成するために、除草剤、肥料、土壌改質剤、植物成長制御剤、又は相加効果又は相乗効果を生じることが期待されるその他の材料などの植物保護剤と混合してもよい。

10

【0149】

別の実施形態では、下記式（2）で表される化合物を提供する。

【化6】



20

【0150】

式（2）において、

R_1 は水素原子又は $C_1 - C_4$ アルキル基を表し、

R_2 はトリフルオロメチル基又はペンタフルオロエチル基を表し、

X はフッ素原子、ジフルオロメチル基、又はトリフルオロメチル基を表し、

30

X_5 は臭素原子又はヨウ素原子を表し、

A は窒素原子又は $C-H$ 基を表し、及び

A が窒素原子を表す場合、 Y は単結合、 O 、 S 、スルホキシド基、又はスルホニル基を表し、 A が $C-H$ 基を表す場合、 Y は S 、スルホキシド基、又はスルホニル基を表す。

【0151】

式（2）で表される化合物は、外部寄生虫長期防除剤として、園芸用若しくは農業用殺虫剤として、又は有害生物から作物を保護する目的にも有用である。したがって、式（2）で表される化合物は、式（1）で表される化合物が使用される組成物、混合物、製剤、調製物、方法、用途などで同様に使用することができる。

【0152】

40

式（2）で表される化合物は、当技術分野で公知の方法を参照して調製することができる。例えば、国際公開第2005/073165号、国際公開第2010/018714号、国際公開第2011/093415号並びに国際公開第2010/013567号及び国際公開第2010/018857号を参照。例示的な合成方法を、実施例1～実施例9で詳述する。

【0153】

式（2）で表される化合物は、好ましくは、

$N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド$ 、

50

N－（２－フルオロ－３－（（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（トリフルオロメチル）フェニル）カルバモイル）フェニル）－N－メチル－６－（トリフルオロメチル）ニコチンアミド、

６－フルオロ－N－（２－フルオロ－３－（（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（トリフルオロメチル）フェニル）カルバモイル）フェニル）ニコチンアミド、

６－フルオロ－N－（２－フルオロ－３－（（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（トリフルオロメチル）フェニル）カルバモイル）フェニル）－N－メチルニコチンアミド、

２－フルオロ－３－（４－フルオロ－N－メチルベンズアミド）－N－（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（（トリフルオロメチル）スルホニル）フェニル）ベンズアミド、及び

２－フルオロ－３－（４－フルオロベンズアミド）－N－（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（（トリフルオロメチル）スルホニル）フェニル）ベンズアミドからなる群から選択される。

【０１５４】

本発明を以下の実施例でさらに説明する。しかしながら、これらの実施例は、本出願の範囲を制限することを意図したものではない。

【実施例】

【０１５５】

実施例１：N－（２－フルオロ－３－（（２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（トリフルオロメチル）フェニル）カルバモイル）フェニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチンアミド（化合物６７）の調製

【０１５６】

工程１－A：４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）アニリンの調製

内部温度計、メカニカルスターラー、滴下漏斗、pHコントローラー（pH電極）、及びコンデンサーを装備した１０Ｌの五つ口丸底フラスコに、２－アミノベンゾトリフルオリド（９８．８％、４５０．０g、２７６０．６mmol）、テトラブチルアンモニウムブロミド（４９．８g、１５４．６mmol）、酢酸エチル（２２５０．０g、２５．５mol）、パーフルオロ－２－ヨードプロパン（１．２４kg、４．１４mol）、及び水（９００．０g）を仕込んだ。ハイドロサルファイトナトリウム（亜ジチオン酸ナトリウム）（８９％、３３４．２g、１．５４mol）を含む２．５重量％炭酸ナトリウム（ Na_2CO_3 ）水溶液（１．２０kg、２８３．５mmol）を、前記フラスコ中の激しく攪拌されている溶液に、３０℃で３時間かけて滴下した。亜ジチオン酸ナトリウム（ $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$ ）水溶液を添加している間、水層のpH値を１８重量％炭酸ナトリウム（ Na_2CO_3 ）水溶液を用いて４．４±０．１に調整した。得られた二相混合物を３０℃で３時間激しく攪拌した。反応終了後、得られた２つの透明な相を分離し、有機層を２０mmHg（４０℃）で濃縮して溶媒を除去した。得られた残渣を５重量％炭酸ナトリウム（ Na_2CO_3 ）水溶液（１．７６kg、８２８．２mmol）を用いて９０℃で、及び水（１．６２kg）を用いて７０℃で、それぞれ洗浄し、黄色の液体として粗生成物を得た。粗生成物を１００℃で真空（３mmHg）で蒸留して、７６３．９gの４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）アニリンを黄色液体として得た（９６．５重量％）（収率８１．１％）。

【０１５７】

工程１－B：２－ヨード－４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－６－（トリフルオロメチル）アニリンの調製

メカニカルスターラー、温度計、還流コンデンサー、及び滴下漏斗（５００ml）を装備した３Ｌの四つ口丸底フラスコに、４－（パーフルオロプロパン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）アニリン（１００％として；３４０．０g、９９６．５mmol）

10

20

30

40

50

、硫酸（98重量%、19.9g、199.3mmol）、及びメタノール（1020.0g）を仕込んだ。この混合物にヨウ素（99.5%、151.8g、597.9mmol）を20℃で添加し、得られた混合物を60℃に加熱した。この溶液に、50%ペルオキシ二硫酸アンモニウム水溶液（301.6g、647.7mmol）を60℃で0.5時間かけて滴下した。得られた混合物を60℃で5時間攪拌した。反応完了後、過剰なヨウ素を10重量%炭酸ナトリウム（ Na_2SO_3 ）水溶液（208.4g、165.3mmol）で還元した。その後、水（1020.0g）を二相混合物へ添加した。2つの透明な相を分離し、有機層を、10重量%炭酸ナトリウム（ Na_2CO_3 ）水溶液（105.6g、99.6mmol）を用いて40℃で、及び2.4重量%塩化ナトリウム（ NaCl ）水溶液（697.0g）を用いて40℃で、それぞれ洗浄して暗赤色の液体として粗生成物（95.4重量%、464.4g、973.8mmol）を得た。減圧留去（2.5mmHg）により、沸点が75℃～76℃（2.5mmHg）で、97重量%～98重量%の2-ヨード-4-（パーフルオロプロパン-2-イル）-6-（トリフルオロメチル）アニリンを含む429.7gの留分を得た（収率93.2%）。

【0158】

工程1-C：2-フルオロ-3-ニトロベンゾイルクロリドの調製

内部温度計、メカニカルスターラー、滴下漏斗、及び還流コンデンサーを装備した10Lの四つ口丸底フラスコに、2-フルオロ-3-ニトロ安息香酸（1269g、6.86mol）、N,N-ジメチルホルムアミド（20.5g）、及びトルエン（4450g）を仕込んだ。懸濁液混合物を75℃に加熱し、塩化チオニル（1227g、10.31mol）を、80℃で1時間55分かけて滴下した。反応混合物を80℃で2時間攪拌した。反応完了後、溶液を減圧下で40℃で濃縮した。2-フルオロ-3-ニトロベンゾイルクロリドが黄色の油（1529g）として得られ、さらに精製することなく次の工程に使用した。

【0159】

工程1-D：2-フルオロ-N-（2-ヨード-4-（パーフルオロプロパン-2-イル）-6-（トリフルオロメチル）フェニル）-3-ニトロベンズアミドの調製

メカニカルスターラー、温度計、還流コンデンサー、及び滴下漏斗を装備した10Lの丸底フラスコに、2-ヨード-4-（パーフルオロプロパン-2-イル）-6-（トリフルオロメチル）アニリン（2600g、5.71mol）、1,3-ジメチルイミダゾリジン-2-オン（4200g）、及びジイソプロピルエチルアミン（1774g、13.73mol）を仕込んだ。2-フルオロ-3-ニトロベンゾイルクロリド（1529g）を懸濁液に20℃で添加し、得られた混合物を105℃に加熱し、この温度で5時間攪拌した。反応混合物を20℃へ冷却後、水（7800g）及び酢酸エチル（13.0L）を添加した。得られた2層を分離し、有機層を、10%塩酸（ HCl ）水溶液（3900g）及び飽和塩化ナトリウム（ NaCl ）水溶液（4000g）で、飽和炭酸水素ナトリウム（ NaHCO_3 ）水溶液（4000g）及び飽和塩化ナトリウム水溶液（4000g）で、そして飽和塩化ナトリウム（ NaCl ）水溶液（8000g）で逐次的に洗浄した後、濃縮して粗生成物を得た（4050g）。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製した（シリカゲル：12000g、溶離液：酢酸エチル／n-ヘキサン=1／3、70.0L）。ジイソプロピルエーテル（7.0L）及びn-ヘキサン（7.0L）を精製した生成物に加え、得られた混合物を一晩攪拌した。濾過した後、得られた固体をジイソプロピルエーテル（3.5L）／n-ヘキサン（3.5L）で洗浄し、減圧乾燥して2-フルオロ-N-（2-ヨード-4-（パーフルオロプロパン-2-イル）-6-（トリフルオロメチル）フェニル）-3-ニトロベンズアミドを得た（2518g、収率70.8%）。

【0160】

工程1-E：3-アミノ-2-フルオロ-N-（2-ヨード-4-（パーフルオロプロパン-2-イル）-6-（トリフルオロメチル）フェニル）ベンズアミドの調製

内部温度計、メカニカルスターラー、滴下漏斗、及び還流コンデンサーを装備した20

10

20

30

40

50

Lの四つ口丸底フラスコに、2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(2518 g、4.05 mol)、エタノール(9950 g)、及び水(2180 g)を仕込んだ。50℃に加熱後、濃塩酸(HCl)(16.9 g、0.16 mol)を懸濁液へ滴下した。鉄(Fe)(565 g、10.12 mol)を60℃で3時間かけて11回に分けて(それぞれ約50 g)加え、反応混合物を65℃で攪拌した。3時間後、濃塩酸(HCl)(17.0 g、0.16 mol)を追加し、混合物を再び65℃で3時間攪拌した。20℃へ冷却後、得られた混合物をCELTITE(登録商標)パッドにより濾過し、濾過ケーキをエタノール(3.0 L)で洗浄し、濾液を50℃で濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル(5.0 L)に溶解し、水(5.0 L)で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)(500 g)で乾燥させ、40℃で濃縮して粗生成物を得た(2650 g)。このようにして得られた粗生成物を、ジイソプロピルエーテル(2.7 L)及びn-ヘキサン(2.7 L)とともに室温で4時間攪拌した。ろ過後、得られた固体をジイソプロピルエーテル／n-ヘキサン=1／1(2.7 L)で洗浄し、減圧乾燥して3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミドを得た(2268 g、収率94.6%)。

10

【0161】

工程1-F: 6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸クロリドの調製

内部温度計、メカニカルスターラー、滴下漏斗、及び還流コンデンサーを装備した5 Lの四つ口丸底フラスコに、6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸(782 g、4.09 mol)、N,N-ジメチルホルムアミド(10.6 g)、及びトルエン(2340 g)を仕込んだ。混合物を80℃に加熱後、塩化チオニル(878 g、7.38 mol)を1.5時間かけて滴下した。80℃で2時間攪拌後、混合物を40℃に冷却し、50℃で減圧下で濃縮して、黄色の液体として6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸クロリド(786 g)を得た。得られた6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸クロリドを、さらに精製することなく次の工程に使用した。

20

【0162】

工程1-G: N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物67)の調製

30

メカニカルスターラー、温度計、還流コンデンサー、及び滴下漏斗を装備した20 Lの四つ口丸底フラスコに、6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸クロリド(786 g)、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド(2019 g、3.41 mol)、及びテトラヒドロフラン(5390 g)を仕込んだ。ピリジン(907 g)を0.5時間かけて滴下し、得られた混合物を20℃で2時間攪拌した。反応完了後、水(7800 g)、酢酸エチル(13 L)、及び飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(2510 g)を反応混合物へ添加し、得られた2つの層を分離した。有機層を、1 N塩酸(HCl)水溶液(およそ2000 g)及び飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(約2500 g)で(3回)、飽和炭酸水素ナトリウム(NaHCO₃)(4000 g)及び飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(1000 g)で、そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(4000 g)で逐次的に洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム(1000 g)で乾燥し、40℃で濃縮した。得られた残渣に酢酸エチル(5.0 L)を加え、得られた溶液を再び硫酸ナトリウム(500 g)で乾燥させ、40℃で濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をn-ヘキサン(6.0 L)及びジイソプロピルエーテル(6.0 L)と共に室温で一晩攪拌した。濾過した後、得られた固体をジイソプロピルエーテル／n-ヘキサン=1／1(4.0 L)で洗浄し、40℃で6時間減圧乾燥してN-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル))-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチン

40

50

アミドを得た (2461 g、収率94.3%)。

【0163】

実施例2：N-(2-フルオロ-3-((2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物99)の調製

【0164】

工程2-A：4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンの調製

実施例1の工程1-Aの方法に従って、2-トリフルオロメトキシアニリンから4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンを調製した。

【0165】

工程2-B：2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンの調製

N-ブロモスクシンイミド(4.33 g、24.3 mmol)を、4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリン(7.0 g、20.3 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(42 mL)溶液へ少しずつ加え、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。水と酢酸エチルを混合物に加え、得られた2層を分離した。得られた有機層を飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)で乾燥し、濃縮して粗生成物を得た。このようにして得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して(シリカゲル、溶離液：酢酸エチル/n-ヘキサン勾配=0/100~10/90)、オレンジ色の油状物として2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンを得た(5.6 g、収率65%)。

【0166】

工程2-C：2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミドの調製

2-フルオロ-3-ニトロ安息香酸(2.91 g、15.7 mmol)をトルエン(13 mL)と共に攪拌し、塩化チオニル(5.7 mL、78.3 mmol)及びN,N-ジメチルホルムアミド(2滴)を添加した。得られた混合物を90℃で0.5時間攪拌し、濃縮して酸塩化物を得た。このようにして得られた酸塩化物を、2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリン(5.5 g、13.1 mmol)、1,3-ジメチルイミダゾリジン-2-オン(8.5 mL)、及びジイソプロピルエチルアミン(5.43 mL、31.1 mmol)の混合物へ添加し、得られた混合物を110℃に加熱し、この温度で3時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却した後、水と酢酸エチルを加え、得られた2層を分離した。得られた有機層を、1N塩酸(HCl)水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム(NaHCO₃)水溶液、そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で逐次的に洗浄した後、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製した(シリカゲル、溶離液：酢酸エチル/n-ヘプタン勾配=5/95~15/85)。次に、ジイソプロピルエーテル/n-ヘプタン=1/1(160 mL)を精製した生成物に加え、得られた混合物を攪拌した。濾過した後、2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(4.9 g、収率59%)を得た。

【0167】

工程2-D：3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミドの調製

2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(4.9 g、8.3 mmol)を、エタノール(39 mL)に溶解し、塩化スズ(II)(SnCl₂)(4.92 g、25.9 mmol)を冷却下で少量ずつ添加した。懸濁液に濃塩酸(HCl)(5.

10

20

30

40

50

3.5 g、9.04 mmol)を滴下した後、得られた混合物を50℃に加熱した。1.5時間後、混合物を室温まで冷却し、10%水酸化ナトリウム(NaOH)水溶液(80 mL)を添加した。CELITE(登録商標)パッドで濾過した後、得られた濾液を濃縮し、酢酸エチルに溶解し、水及び飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で逐次的に洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)で乾燥させて、濃縮して粗生成物をえた。このようにして得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して(シリカゲル、溶離液：酢酸エチル／n-ヘプタン勾配=20/80~25/75)、淡赤色固体として3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミドを得た(4.8 g)。

【0168】

工程2-E：N-(2-フルオロ-3-((2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物99)の調製

6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸(100 mg)をトルエンと共に攪拌し、塩化チオニル(60 µL)及びN,N-ジメチルホルムアミド(1滴)を混合物へ添加した。得られた混合物を90℃で2時間攪拌し、濃縮して酸塩化物を得た。このようにして得られた酸塩化物を、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミド(300 mg)のテトラヒドロフラン溶液へ添加した。ピリジン(100 µL)を加え、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。水と酢酸エチルを反応混合物に加え、得られた2層を分離した。有機層を濃縮して、このようにして得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して(シリカゲル、溶離液：酢酸エチル／n-ヘキサン)、N-(2-フルオロ-3-((2-ブロモ-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミドを得た。

【0169】

実施例3：N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物118)の調製

【0170】

工程3-A：2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンの調製

硫酸(0.87 g、0.1当量)及びヨウ素(6.29 g、24.8 mmol)を、4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリン(15.0 g、43.5 mmol)のメタノール(45 g)溶液へ添加し、得られた混合物を60℃に加熱した。50.5%ペルオキシ二硫酸アンモニウム水溶液(6.43 g、28.1 mmol)を前記溶液へ60℃で滴下した。60℃で4時間攪拌後、得られた混合物を室温に冷却し、10重量%炭酸ナトリウム(Na₂CO₃)水溶液(60 mL)を添加した。0.5時間攪拌した後、n-ヘキサンを加え、得られた2つの透明な相を分離した。次に、有機層を飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で洗浄し、濃縮した。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して(シリカゲル：溶離液：n-ヘキサン)、黄色油状物として2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリンを得た(13.5 g、収率65.8%)。

【0171】

工程3-C：2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミドの調製

2-フルオロ-3-ニトロ安息香酸(5.4 g、29.6 mmol)をトルエン(25 mL)と共に攪拌し、塩化チオニル(10.7 mL、147 mmol)及びN,N-ジメチルホルムアミド(2滴)を添加した。得られた混合物を90℃で0.5時間攪拌し、濃縮して酸塩化物を得た。このようにして得られた酸塩化物を、2-ヨード-4-(パーフ

10

20

30

40

50

ルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)アニリン(11.6 g、24.6 mmol)、1,3-ジメチルイミダゾリジン-2-オン(17 mL)、及びジイソプロピルエチルアミン(10.2 mL、58.6 mmol)の懸濁液へ添加し、得られた混合物を110℃に加熱し、この温度で3時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却した後、水と酢酸エチルを加え、得られた2層を分離した。得られた有機層を、1 N塩酸(HCl)水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム(NaHCO₃)水溶液、そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で逐次的に洗浄した後、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製した(シリカゲル、溶離液:酢酸エチル/n-ヘプタン勾配=5/95~15/85)。次に、ジイソプロピルエーテル/n-ヘプタン=1/1(160 mL)を精製した生成物に加え、得られた混合物を攪拌した。濾過した後、2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(9.9 g、収率63%)を得た。

10

【0172】

工程3-D:3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミドの調製

2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(11.2 g、8.31 mmol)を、エタノール(89 mL)に溶解し、塩化スズ(II)(SnCl₂)(10.3 g、54.4 mmol)を冷却下で少量ずつ添加した。懸濁液に濃塩酸(HCl)(12.1 g、18.9 mmol)を滴下した後、得られた混合物を50℃に加熱した。1時間後、混合物を室温に冷却し、10%水酸化ナトリウム(NaOH)水溶液(80 mL)を添加した。CE LITE(登録商標)パッドで濾過した後、濾液を濃縮し、酢酸エチルに溶解し、水及び飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液で逐次的に洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)で乾燥させて、濃縮して粗生成物をえた。このようにして得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して(シリカゲル、溶離液:酢酸エチル/n-ヘプタン勾配=15/85~30/70)、淡赤色固体として3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミドを得た(12 g)。

20

【0173】

工程3-E:N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物118)の調製

実施例2の工程2-Eの方法に従って、6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸及び3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミドからN-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミドを調製した。

30

【0174】

実施例4:N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物117)の調製

【0175】

工程4-A:2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドの調製

3-Amino-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンズアミド(4.0 g、6.5 mmol)を硫酸(51 mL、963 mmol)に溶解し、ホルマリン(10 mL)を溶液

40

50

に滴下した。添加中、氷水浴で冷却することにより、溶液の温度を25℃未満に制御した。室温で65時間攪拌した後、反応混合物を5N水酸化ナトリウム(NaOH)水溶液(300mL)に滴下した。水と酢酸エチルを混合物に加え、得られた2層を分離した。得られた有機層を硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)で乾燥させ、濃縮して2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミド(4.65g)を得た。

【0176】

工程4-B: N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物117)の調製

10

実施例2の工程2-Eの方法に従って、6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸及び2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドからN-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミドを調製した。

【0177】

実施例5: N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物66)の調製

20

【0178】

工程5-A: 2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドの調製

実施例4の工程4-Aの方法に従って、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミドから2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドを調製した。

【0179】

工程5-B: N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミド(化合物66)の調製

30

実施例2の工程2-Eの方法に従って、6-(トリフルオロメチル)ニコチン酸及び2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドからN-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチル-6-(トリフルオロメチル)ニコチンアミドを調製した。

【0180】

実施例6: 6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-((2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)ニコチンアミド(化合物116)の調製

40

6-フルオロニコチン酸(21.45g)をトルエン(115mL)と共に攪拌し、塩化チオニル(27.7mL、380mmol)及びN,N-ジメチルホルムアミド(0.49mL)を混合物へ添加した。得られた混合物を還流下で2時間攪拌し、濃縮して酸塩化物を得た。このようにして得られた酸塩化物を、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)ベンズアミド(75g、127mmol)のテトラヒドロフラン溶液へ添加した。ジイソプロピルエチルアミン(26.5mL、152mmol)を滴下し、得られた混合物を室温で攪拌した。水と酢酸エチルを反応混合物に加え、得られた2層を分離した。有

50

機層を硫酸ナトリウム (Na_2SO_4) で乾燥させ、濃縮し、このようにして得られた組成物をジイソプロピルエーテル (500 mL、6回、各回 40℃で2時間)、アセトニトリル (400 mL、2回、各回 40℃で1時間)、及び n-ヘプタン (500 mL、6回、各回 40℃) で洗浄して、白色固体として 6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)ニコチンアミド (78 g、109 mmol、収率 86%) を得た。

【0181】

実施例 7：6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチルニコチンアミド (化合物 115) の調製

10

実施例 2 の工程 2-E の方法に従って、2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(メチルアミノ)ベンズアミドから 6-フルオロ-N-(2-フルオロ-3-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)フェニル)カルバモイル)フェニル)-N-メチルニコチンアミドを調製した。

【0182】

実施例 8：2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミド (化合物 70) の調製

20

【0183】

工程 8-A：4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-2-((トリフルオロメチル)チオ)アニリンの調製

実施例 1 の工程 1-A の方法に従って、2-((トリフルオロメチル)チオ)アニリンから 4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-2-((トリフルオロメチル)チオ)アニリンを調製した。

【0184】

工程 8-B：2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)チオ)アニリンの調製

硫酸 (8.99 mL、169 mmol) 及びヨウ素 (65.21 g、514 mmol) を 4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-2-((トリフルオロメチル)チオ)アニリン (290 g、803 mmol) のメタノール (1104 mL) 溶液へ添加し、得られた混合物を 60℃に加熱した。50%ペルオキシ二硫酸アンモニウム水溶液 (119.09 g、522 mmol) を前記溶液へ 60℃で添加した。60℃で2時間攪拌後、ヨウ素 (21.4 g、169 mmol) 及びペルオキシ二硫酸アンモニウム (17.29 g、361 mmol) を添加して 60℃で1時間攪拌した。得られた混合物を室温に冷却し、亜硫酸ナトリウム (Na_2SO_3) (17.29 g) 水溶液 (450 mL) 及び水 (593 mL) を添加した。得られた混合物を n-ヘプタン (4470 mL) で抽出し、得られた有機層を飽和塩化ナトリウム (NaCl) 水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム (Na_2SO_4) で乾燥させ、濃縮した。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製して (シリカゲル：溶離液：酢酸エチル／n-ヘプタン=1／9)、黄色油状物として 2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)チオ)アニリンを得た (297 g、収率 76%)。

30

40

【0185】

工程 8-C：2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)チオ)フェニル)-3-ニトロベンズアミドの調製

還流コンデンサーを装備した 2 L の丸底フラスコに、2-フルオロ-3-ニトロ安息香酸 (118.76 g、642 mmol) 及びトルエン (656 mL) を仕込んだ。N,N-ジメチルホルムアミド (20.5 g) 及び塩化チオニル (71.1 mL、975 mmol) を添加して、得られた混合物を 90℃で1.5時間攪拌した。反応完了後、混合物を

50

減圧下で濃縮して酸塩化物を得た。

【0186】

メカニカルスターラー、温度計、及び還流コンデンサーを装備した3 Lの丸底フラスコに、2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)アニリン(250 g、513 mmol)、1,3-ジメチルイミダゾリジン-2-オン(365 mL)、及びジイソプロピルエチルアミン(215 mL、1232 mmol)を仕込んだ。前記酸塩化物の1,3-ジメチルイミダゾリジン-2-オン溶液を27℃で添加し、得られた混合物を105℃に加熱し、この温度で3.5時間攪拌した。反応混合物を室温へ冷却後、水(1 L)及び酢酸エチル(1.3 L)を添加した。得られた2層を分離し、有機層を10%塩酸(HCl)水溶液(1 L)、飽和炭酸水素ナトリウム(NaHCO₃)水溶液(1 L)、そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(1 L)で逐次的に洗浄した後、濃縮して粗生成物を得た(380 g)。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィーで精製した(シリカゲル:5 kg、溶離液:酢酸エチル/n-ヘプタン=1/3)。n-ヘプタン(1 L)を精製した生成物に加え、得られた混合物を一晩攪拌した。濾過した後、得られた固体をn-ヘプタン(1.3 L)で洗浄し、減圧下で乾燥して、オレンジ色の固体として2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(292 g、収率87%)を得た。

10

【0187】

工程8-D:3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)ベンズアミドの調製

20

内部温度計、メカニカルスターラー、及び還流コンデンサーを装備した3 Lの四つ口丸底フラスコに、2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)-3-ニトロベンズアミド(265 g、405 mmol)、エタノール(1419 mL)、水(226 mL)、及び濃塩酸(HCl)(1.661 mL、57.4 mmol)を仕込んだ。60℃に加熱後、鉄(Fe)(565 g、10.12 mmol)を少量ずつ加えて1時間攪拌した。室温に冷却後、得られた混合物をCELITE(登録商標)パッドで濾過し、濾過ケーキを酢酸エチル(1 L、4回)で洗浄した。濾液を40℃で濃縮後、得られた残渣を酢酸エチル(1.6 L)に溶解し、水(1 L)そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(1 L)で逐次的に洗浄した。有機層を硫酸ナトリウム(Na₂SO₄)で乾燥させて、濃縮して粗生成物をえた。組成物をn-ヘプタンと共に40℃で攪拌した。濾過した後、得られた固体をn-ヘプタンで洗浄し、減圧下で乾燥させて3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)ベンズアミド(228 g、収率95%)を得た。

30

【0188】

工程8-E:2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)ベンズアミドの調製

40

4-フルオロベンゾイルクロリド(63.41 g、0.4 mol)を、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チオ)フェニル)ベンズアミド(207.0 g、0.333 mol)のテトラヒドロフラン(2.41 L)溶液に添加した。ピリジン(31.63 g)を加え、得られた混合物を室温で2時間攪拌した。反応完了後、水(3.5 L)及び酢酸エチル(3.5 L)を反応混合物に添加し、得られた2つの層を分離した。有機層を10%塩酸(HCl)水溶液(3.5 L)、飽和炭酸水素ナトリウム(NaHCO₃)(3.5 L)、そして飽和塩化ナトリウム(NaCl)水溶液(3.5 L)で逐次的に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物を、n-ヘプタン/アセトンそしてn-ヘプタンで逐次的に洗浄し、減圧下で乾燥させて2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イ

50

ル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミド (252 g、収率 92.5%) を得た。

【0189】

工程 8 - F : 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) フェニル) ベンズアミド (化合物 70) の調製

内部温度計及びメカニカルスターラーを装備した 20 L の五つ口丸底フラスコに、2-フルオロ-3-(4-フルオロベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミド (163 g、218 mmol)、水 (4371 mL)、アセトニトリル (2202 mL)、及びジクロロメタン (2192 mL) を仕込んだ後、過ヨウ素酸ナトリウム (214.89 g、1005 mmol) 及び塩化ルテニウム (III) (RuCl_3) (4.36 g、65.3 mmol) を添加した。室温で 1 時間攪拌した後、チオ硫酸ナトリウム (345.3 g、2184 mmol) の水溶液 (3 L) を添加し、混合物をさらに 0.5 時間攪拌した。得られた混合物を酢酸エチル (3 L、4 回) で抽出し、合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して粗生成物を得た。このようにして得られた粗生成物を酢酸エチル (500 mL) と共に 2 時間攪拌した。濾過した後、得られた固体を酢酸エチル (100 mL) で洗浄し、減圧下で 2 日間乾燥させて 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) フェニル) ベンズアミド (103 g、132 mmol、収率 60.6%) を得た。

【0190】

実施例 9 : 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) フェニル) ベンズアミド (化合物 70) の調製

【0191】

工程 9 - A : 2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) - 3-(メチルアミノ) ベンズアミドの調製

実施例 4 の工程 4 - A の方法に従って、3-アミノ-2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミドから 2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) - 3-(メチルアミノ) ベンズアミドを調製した。

【0192】

工程 9 - B : 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミドの調製

実施例 2 の工程 2 - E の方法に従って、2-フルオロ-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) - 3-(メチルアミノ) ベンズアミドから 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミドを調製した。

【0193】

工程 9 - C : 2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) フェニル) ベンズアミド (化合物 70) の調製

実施例 8 の工程 8 - F の方法に従って、2-フルオロ-3-(4-フルオロ-N-メチルベンズアミド) - N - (2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル) - 6 - ((トリフルオロメチル) チオ) フェニル) ベンズアミドから 2-フルオロ-3-(4-

フルオロ-N-メチルベンズアミド)-N-(2-ヨード-4-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6-((トリフルオロメチル)スルホニル)フェニル)ベンズアミドを調製した。

【0194】

以下の表242に示す本発明に係る化合物は、実施例1と同様にして、又は国際公開第2005/073165号、国際公開第2010/018714号、国際公開第2011/093415号、国際公開第2010/013567号、及び国際公開第2010/018857号に開示された方法のいずれかを使用して製造した。表242に記載の化合物番号は、表241に例示されている化合物の構造に対応する。

【0195】

10

20

30

40

50

【表 4 - 1】

表 2 4 2

Compound No.	MS	¹ H-NMR
44	801 (M+23)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.47 (1H, s), 8.45 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.68-7.64 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.50 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.35 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.25 (1H, d, J = 7.8 Hz), 3.36 (3H, s).
45		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.12-8.03 (2H, m), 7.92 (1H, s), 7.76-7.72 (2H, m), 7.50-7.42 (3H, m), 7.33-7.32 (1H, m), 5.00 (2H, br s), 3.51 (3H, s)
46	804 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.36-8.34 (2H, br m), 8.00-7.94 (3H, m), 7.43-7.41 (2H, br m), 7.08-7.06 (1H, br m), 6.91-6.89 (1H, br m), 3.53 (3H, s), 2.36 (3H, s).
47		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.11 (1H, br s), 8.01 (1H, t, J = 6.6Hz), 7.92 (1H, s), 7.48 (1H, t, J = 6.6Hz), 7.30-7.27 (4H, m), 7.07 (2H, d, J = 5.2Hz), 3.50 (3H, s), 2.85-2.79 (1H, m), 1.16 (6H, d, J = 6.7Hz).
48		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.10 (1H, br-s), 8.01 (1H, t, J = 6.6Hz), 7.92 (1H, s), 7.62 (2H, s), 7.47-7.27 (4H, m), 6.12 (1H, s), 5.73 (1H, s), 3.51 (3H, s).
49		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.06 (2H, m), 7.92 (1H, m), 7.81 (2H, m), 7.52 (3H, m), 7.35-7.32 (1H, m), 3.55 (3H, s), 3.00 (3H, s)
50		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.12-8.00 (2H, m), 7.93 (1H, s), 7.46-7.43 (1H, m), 7.30-7.26 (1H, m), 6.93-6.89 (2H, m), 6.66-6.64 (2H, m), 3.82 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.51 (3H, s)
51		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.34 (1H, s), 8.11-8.05 (2H, m), 7.93 (1H, s), 7.49-7.46 (1H, m), 7.34-7.31 (1H, m), 7.26 (1H, m), 7.02-7.00 (2H, m)
52	787 (M+23) 765 (M+H) 763 (M-H)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.03-8.00 (1H, m), 7.93 (1H, s), 7.47 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.29-7.27 (1H, m), 7.14-7.12 (1H, m), 6.95 (1H, br s), 6.85 (1H, br s), 3.49 (3H, s), 2.81 (1H, br s), 2.66-2.62 (4H, br m), 1.83-1.80 (1H, m), 1.71 (2H, br s).

【 0 1 9 6 】

10

20

30

40

50

【表 4 - 2】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
53		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.32 (1H, br s), 8.05-7.97 (2H, m), 7.92 (1H, bs), 7.52 (1H, br s), 7.32 (1H, m), 7.26 (2H, m), 7.03 (2H, m), 3.52 (3H, s), 2.42 (3H, s)
54	778 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.34 (1H, s), 8.08-8.06 (4H, br m), 7.93 (1H, s), 7.49-7.47 (3H, br m), 7.34-7.32 (1H, br m), 3.55 (3H, s).
55	755 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.47 (1H, s), 8.46 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.63-7.56 (2H, m), 7.32 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.85 (2H, dt, J = 15.2, 5.5 Hz), 6.76 (1H, d, J = 8.0 Hz), 5.98 (2H, s), 3.32 (3H, s).
56		¹ H-NMR (DMSO-d ₆ , 70°C) δ: 10.45 (1H, br s), 8.46 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.63-7.59 (2H, m), 7.44 (1H, br s), 7.31 (1H, br s), 7.08-7.01 (2H, m), 3.36 (3H, s).
57		¹ H-NMR (DMSO-d ₆ , 70°C) δ: 10.47 (1H, br s), 8.64 (1H, br s), 8.46 (1H, s), 7.96-7.94 (3H, m), 7.74 (1H, t, J = 7.0 Hz), 7.65 (1H, t, J = 6.4 Hz), 7.37 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.41 (3H, s).
58		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.45 (1H, br s), 8.44 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.60 (1H, m), 7.53 (1H, m), 7.28 (1H, m), 7.22 (2H, m), 7.07 (2H, m), 3.34 (3H, s), 2.24 (3H, s)
59		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.79 (1H, br s), 7.81 (1H, bs), 7.28 (1H, br s), 7.01-7.00 (4H, m), 6.92-6.91 (2H, m), 6.70 (1H, m), 2.77 (3H, s)
60		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.5 (1H, br s), 8.5 (1H, br s), 7.9 (1H, br s), 7.7-7.6 (2H, m), 7.4-7.3 (5H, m), 3.4 (3H, s)
61		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.42 (1H, br s), 8.45 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.64-7.62 (2H, m), 7.47-7.45 (2H, m), 7.32 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.24-7.23 (2H, m), 3.37 (3H, s).
62		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.45 (1H, br s), 8.45 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.60-7.54 (2H, m), 7.30-7.29 (3H, m), 6.82-6.79 (2H, m), 3.72 (3H, s), 3.34 (3H, s).
63		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.52 (1H, s), 10.12 (1H, s), 8.26 (1H, s), 8.10-8.06 (2H, m), 7.92 (1H, s), 7.85 (1H, t, J = 7.1 Hz), 7.56 (1H, t, J = 6.8 Hz), 7.40-7.32 (3H, m)

10

20

30

40

【 0 1 9 7 】

50

【表 4 - 3】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
64		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.61 (1H, s), 10.14 (1H, s), 8.78 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.10-8.06 (2H, m), 7.85 (1H, m), 7.70 (1H, m), 7.42-7.32 (3H, m)
65		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.61 (1H, s), 10.15 (1H, s), 8.53 (1H, s), 8.11-8.06 (3H, m), 7.88-7.84 (1H, m), 7.64-7.61 (1H, m), 7.42-7.33 (3H, m)
66		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.64 (1H, br s), 8.33 (1H, s), 8.09 (1H, t, J = 7.3 Hz), 8.01-7.87 (3H, m), 7.58-7.55 (2H, m), 7.38 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.56 (3H, s).
67		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 9.24 (1H, d, J = 2.1 Hz), 8.62-8.60 (1H, m), 8.44 (1H, dd, J = 8.1, 2.0 Hz), 8.37 (1H, d, J = 1.5 Hz), 8.22-8.18 (2H, m), 7.97-7.93 (2H, m), 7.89 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.43 (1H, t, J = 8.0 Hz).
68		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.40 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.63-7.55 (2H, m), 7.40-7.37 (2H, m), 7.31 (1H, m), 7.09 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.36 (3H, s)
69		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.67 (1H, s), 8.52 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.68-7.62 (2H, m), 7.40-7.33 (3H, m), 7.08 (2H, m), 3.36 (3H, s)
70		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.51 (1H, s), 8.76 (1H, s), 8.21 (1H, s), 7.69-7.64 (2H, m), 7.39-7.32 (3H, m), 7.08-7.05 (2H, m), 3.36 (3H, s)
71		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.50 (1H, s), 10.11 (1H, s), 8.09-8.05 (3H, m), 7.86-7.82 (1H, m), 7.71 (1H, s), 7.56-7.52 (1H, m), 7.39-7.32 (3H, m)
72		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.39 (1H, s), 8.04 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.62-7.53 (2H, m), 7.39-7.29 (3H, m), 7.07 (2H, m), 3.35 (3H, s)
73		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.45 (1H, s), 10.12 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.10-8.06 (2H, m), 7.85-7.82 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.58-7.55 (1H, m), 7.39-7.32 (3H, m)
74		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.34 (1H, s), 8.16 (1H, s), 7.66 (1H, s), 7.62-7.55 (2H, m), 7.39-7.37 (2H, m), 7.31 (1H, m), 7.07 (2H, m), 3.35 (3H, s)

10

20

30

40

【 0 1 9 8 】

【表 4 - 4】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
75	854 (M+23) 830 (M-1).	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.67 (1H, br s), 8.50 (1H, br s), 7.93 (1H, br s), 7.74 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.61-7.56 (3H, m), 7.39 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.23-7.22 (1H, br m), 3.36 (3H, s).
76	816 (M-H).	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.77 (1H, br s), 10.51 (1H, br s), 8.52 (1H, br s), 8.26 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.99-7.95 (2H, m), 7.86-7.83 (2H, m), 7.63 (1H, t, J = 6.3 Hz), 7.42 (1H, t, J = 8.1 Hz).
77	819 (M+23) 797 (M+1) 795 (M-1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.44 (1H, s), 8.46 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.68-7.62 (2H, m), 7.27-7.40 (3H, m), 7.16 (1H, s), 3.36 (3H, s).
78	805 (M+23) 783 (M+1) 781 (M-1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.55 (1H, s), 10.22 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.04 (1H, ddd, J = 11.5, 7.8, 2.1 Hz), 7.92-7.89 (2H, m), 7.85-7.82 (1H, m), 7.56-7.67 (2H, m), 7.39 (1H, t, J = 8.0 Hz).
79	745 (M+23) 721 (M-1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.59 (2H, s), 9.22-9.22 (1H, m), 8.51 (1H, dd, J = 8.1, 2.3 Hz), 8.46 (1H, s), 8.17 (1H, dd, J = 8.1, 0.8 Hz), 7.92-7.89 (2H, m), 7.66-7.63 (1H, m), 7.41 (1H, t, J = 7.8 Hz).
80		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 9.8 (1H, br s), 9.6 (1H, bs), 7.80 (1H, br s), 7.58 (1H, d, J = 2 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 2 Hz, 6 Hz), 7.27 (1H, br s), 7.18 (1H, m), 7.15 (1H, d, J = 6 Hz), 6.97 (1H, m), 6.71 (1H, m)
81	780 (M+1) 778 (M-1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.07-8.05 (2H, m), 7.92 (1H, s), 7.84-7.82 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.1 Hz), 7.35 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.84 (1H, d, J = 6.8 Hz), 3.53 (3H, s).
82	766 (M+1) 764 (M-1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.81 (1H, d, J = 2.1 Hz), 8.61 (1H, t, J = 7.3 Hz), 8.40-8.38 (1H, m), 8.36 (1H, s), 8.22 (1H, d, J = 12.2 Hz), 8.06 (1H, s), 7.94-7.92 (2H, m), 7.42 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.13 (1H, dd, J = 8.6, 2.8 Hz).
83		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.33 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.76 (1H, m), 7.65 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.36 (1H, m), 7.22 (2H, m), 6.92 (2H, m), 3.48 (3H, m)

【 0 1 9 9 】

10

20

30

40

50

【表 4 - 5】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
84		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 10.72 (1H, s), 10.40 (1H, s), 8.51 (1H, s), 8.25-8.19 (1H, m), 8.10-8.06 (2H, m), 8.00-7.93 (2H, m), 7.57-7.46 (1H, m), 7.42-7.38 (2H, m)
85		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.58 (1H, s), 10.48 (1H, s), 9.21 (1H, m), 8.51 (1H, m), 8.47 (1H, s), 7.92 (2H, m), 7.86 (1H, m), 7.64 (1H, m), 7.41 (1H, m), 7.02 (1H, t, J = 54.9Hz).
86		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.55 (1H, s), 10.21 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.04 (1H, m), 7.93-7.88 (2H, m), 7.85-7.81 (1H, m), 7.63-7.58 (2H, m), 7.39 (1H, m).
87		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.49 (1H, s), 8.59 (1H, s), 8.45 (1H, s), 7.96-7.91 (2H, m), 7.71-7.61 (3H, m), 7.35 (1H, m), 6.85 (1H, m, J = 54.7Hz), 3.40 (3H, s)
88		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.39 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.71 (3H, m), 7.66 (1H, m), 7.56 (1H, m), 7.49 (2H, m), 7.31 (1H, m), 3.37 (3H, s)
89	679 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 8.00 (1H, m), 7.90 (1H, br), 7.79 (1H, m), 7.50 (1H, s), 7.44-7.37 (3H, m), 7.27 (1H, m), 6.92 (2H, m), 6.55 (1H, m), 3.49 (3H, s)
90	727 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.02-7.99 (2H, m), 7.84 (1H, br), 7.51 (1H, s), 7.44-7.36 (3H, m), 7.28 (1H, m), 6.92 (2H, m), 6.55 (1H, t), 3.49 (3H, s)
91	665 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.64 (1H, m), 8.04-8.01 (2H, m), 7.94 (2H, m), 7.86 (1H, m), 7.81 (1H, d), 7.52 (1H, s), 7.38 (1H, m), 7.22 (2H, m), 6.61 (1H, t)
92	713 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.64 (1H, m), 8.05-7.92 (5H, m), 7.86 (1H, m), 7.53 (1H, s), 7.38 (1H, m), 7.22 (2H, m), 6.58 (1H, t)
93	731 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.12 (1H, s), 8.05-8.00 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.44 (1H, m), 7.35 (2H, m), 7.30 (1H, m), 6.91 (2H, m), 3.50 (3H, s)
94	747 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.03 (1H, m), 7.91-7.85 (2H, m), 7.44 (1H, d), 7.36 (2H, m), 7.30 (1H, m), 6.91 (2H, d), 3.49 (3H, s)

10

20

30

40

【 0 2 0 0 】

【表 4 - 6】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
95	733 (M+1)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ:8.65 (1H, m), 8.03-8.00 (2H, m), 7.94 (2H, m), 7.87 (2H, m), 7.58 (1H, m), 7.39 (1H, m), 7.22 (2H, m)
96	763 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.4 (1H, s), 8.2 (1H, s), 7.7-7.6 (3H, m), 7.4-7.1 (4H, m), 3.4 (3H, s)
97	749 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.7 (2H, s), 8.8 (1H, s), 8.1-8.0 (1H, s), 7.9-7.9 (1H, m), 7.8-7.8 (1H, m), 7.8 (1H, s), 7.7-7.6 (1H, m), 7.6-7.6 (1H, m), 7.4 (1H, t, J = 7.8 Hz)
98	748 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.4 (1H, m), 8.7 (1H, s), 8.0-8.0 (2H, m), 7.8-7.8 (1H, m), 7.7 (1H, m), 7.7 (1H, s), 7.6-7.6 (1H, m), 7.4 (1H, m), 3.4 (3H, s)
99	734 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.8 (1H, s), 10.8 (1H, s), 9.3-9.3 (1H, m), 8.6-8.6 (1H, m), 8.1-8.1 (2H, m), 7.9-7.9 (1H, m), 7.8 (1H, s), 7.6-7.5 (1H, m), 7.4 (1H, t, J = 8.0 Hz)
100	715 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.4 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.7-7.6 (2H, m), 7.6-7.5 (1H, m), 7.4-7.3 (3H, m), 7.2 (1H, s), 3.4 (3H, s)
101	701 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.8 (1H, s), 10.4 (1H, s), 8.1-8.1 (1H, m), 8.1-8.0 (1H, m), 7.9-7.9 (1H, m), 7.8-7.8 (2H, m), 7.7-7.6 (1H, m), 7.6-7.5 (1H, m), 7.4 (1H, t, J = 7.8 Hz)
102	816 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.78 (1H, s), 10.76 (1H, s), 9.29 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.61 (1H, dd, J = 7.8, 1.8 Hz), 8.52 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.96-7.91 (2H, m), 7.66-7.62 (1H, m), 7.45 (1H, t, J = 8.0 Hz)
103	777 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.08 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.60-7.55 (2H, m), 7.50 (1H, s), 7.40-7.37 (2H, m), 7.31-7.25 (1H, m), 7.18 (1H, t, J = 73.1 Hz), 7.11-7.04 (2H, m), 3.35 (3H, s)
104	763 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.39 (1H, s), 10.30 (1H, s), 8.08 (2H, dd, J = 8.5, 5.7 Hz), 8.01 (1H, s), 7.82-7.78 (1H, m), 7.60-7.56 (1H, m), 7.52 (1H, s), 7.40-7.35 (3H, m), 7.30 (1H, t, J = 72.9 Hz)

【 0 2 0 1 】

10

20

30

40

50

【表 4 - 7】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
105	729 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.15 (1H, s), 7.85 (1H, s), 7.62-7.54 (2H, m), 7.54-7.50 (1H, m), 7.41-7.35 (2H, m), 7.32-7.25 (1H, m), 7.23 (1H, t, J = 72.8 Hz), 7.11-7.02 (2H, m), 3.34(3H, s)
106	715 (M+1)	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.47 (1H, s), 10.31 (1H, s), 8.09 (2H, m) 7.92 (1H, s), 7.83-7.79 (1H, m), 7.59-7.17 (6H, m)
107		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.17 (1H, s), 8.68 (1H, s), 8.03-7.99 (2H, m), 7.82 (1H, m), 7.71 (1H, m), 7.62 (1H, m), 7.50 (1H, s), 7.35 (1H, m), 7.18 (1H, m), 3.41 (3H, s).
108		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.56 (1H, s), 10.23 (1H, s), 9.27 (1H, m), 8.59 (1H, m), 8.08 (1H, m), 8.01(1H, m), 7.93-7.90(2H, m), 7.62(1H, m), 7.52 (1H, s), 7.41 (1H, m), 7.24 (1H, t, J = 73.2Hz)
109		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.13 (1H, s), 8.00 (1H, m), 7.66-7.60 (2H, m), 7.51 (1H, s), 7.38-7.30 (3H, m), 7.19 (1H, t, J = 73 Hz), 7.17 (1H, m), 3.35 (3H, s)
110		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ:10.21 (2H, s), 8.05-8.01 (2H, m), 7.91-7.88 (1H, m), 7.84-7.80 (1H, m), 7.62-7.56 (2H, m), 7.52 (1H, s), 7.40-7.38 (1H, m), 7.23 (1H, t, J = 68.3Hz)
111	870 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.38-8.36 (2H, m), 8.17-8.16 (1H, m), 8.06-8.05 (2H, m), 7.96 (1H, s), 7.92 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.73 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.66-7.64 (0.5H, m), 7.49-7.45 (2H, m), 7.29 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.57 (3H, s), 3.24 (1H, s).
112	855 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.61 (1H, td, J = 7.9, 1.6 Hz), 8.37 (1H, s), 8.30 (1H, d, J = 8.0 Hz), 8.15 (1H, d, J = 12.2 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.97 (1H, td, J = 8.1, 1.7 Hz), 7.95 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.44 (1H, t, J = 8.1 Hz).
113	803 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.83 (2H, s), 8.33 (1H, s), 8.14-8.11 (1H, m), 8.01 (1H, d, J = 11.9 Hz), 7.93 (1H, s), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.58 (3H, s).

【 0 2 0 2 】

10

20

30

40

50

【表 4 - 8】

表 2 4 2 (続き)

Compound No.	MS	¹ H-NMR
114	789 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 9.41 (2H, s), 8.60 (1H, t, J = 7.0 Hz), 8.37 (1H, s), 8.16 (1H, d, J = 12.5 Hz), 8.08 (1H, s), 8.01-7.98 (1H, m), 7.96 (1H, s), 7.47-7.45 (1H, m).
115	752 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.34 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.09-8.00 (2H, m), 7.93 (1H, s), 7.83 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.36 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.84 (1H, s), 3.53 (3H, s).
116	738 (M+23)	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.81 (1H, d, J = 2.4 Hz), 8.62 (1H, t, J = 7.0 Hz), 8.41-8.37 (2H, m), 8.21-8.19 (1H, m), 8.05 (1H, s), 7.96-7.93 (2H, m), 7.42 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.13 (1H, dd, J = 8.6, 2.8 Hz).
117		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.39 (1H, s), 8.67 (1H, s), 8.16 (1H, m), 8.02 (1H, m), 7.81 (1H, m), 7.74 (1H, m), 7.66 (1H, s), 7.61 (1H, m), 7.36 (1H, m), 3.41 (3H, s).
118		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.53 (2H, m), 9.26 (1H, m), 8.59 (1H, m), 8.18 (1H, m), 8.07 (1H, m), 7.93 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.59 (1H, m), 7.42 (1H, m).
119		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 10.45 (1H, s), 8.67 (1H, s), 8.45 (1H, s), 8.02 (1H, m), 7.90 (1H, s), 7.81 (1H, m), 7.75 (1H, m), 7.66 (1H, m), 7.37 (1H, m), 3.11 (3H, s).

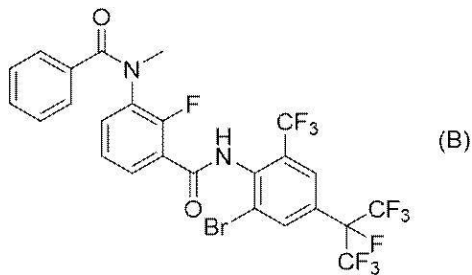
10

20

【0203】

国際公開第 2010 / 018857 号に開示の化合物 (B)、フルララネル (fluralaner) 及びアフォキサネル (afoxolaner) を以下の試験例で比較化合物として使用した。

【化 7】



30

40

【0204】

試験例 A :

ノミとのインビトロ接触試験

ノミとのインビトロ接触試験は、ネコノミ (Ctenocephalides felis) の雄成虫及び雌成虫で実施した。

【0205】

試験管を被覆するために、試験物質をアセトン (高純度 (PA)) に溶解し希釈して所定の濃度とした。次に、前記溶液を、溶媒が完全に蒸発するまでオービタルシェーカー上で回転及び揺動することにより、ガラス管の内壁及び基部に均一に塗布した。例えば、試

50

験物質の900 ppm溶液を用いて、面積ベースで $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量を達成した。

【0206】

溶媒が完全に蒸発した時に、5～10匹のネコノミ (*Ctenocephalides felis*) の成虫を被覆した試験管それぞれに加え、各試験管を穴あきプラスチック蓋で閉じ、室温及び周囲湿度で水平位置でインキュベートした。48時間後、ノミに対する殺虫活性を測定した。測定のために、試験管を叩いてノミを試験管の基部に集め、試験管を直立して置いた。基部で動かない状態のノミ、又はぎこちなく動いたノミを、それぞれ死滅又は瀕死状態とみなした。

【0207】

$5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の物質投与量でノミの少なくとも80%が死滅又は瀕死状態であることが判明した場合、物質がネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な殺虫活性を有すると判断した。100%の殺虫活性は、全てのノミが死滅したか瀕死状態であったことを意味する。0%の殺虫活性は、死滅又は瀕死状態にあるノミがいなかったことを意味する。

【0208】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で95%の殺虫活性を示した：化合物24、化合物26、化合物3、化合物4、化合物5、化合物6、化合物7、化合物8、化合物9、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物39、化合物23、化合物37、化合物44、化合物46、化合物47、化合物48、化合物49、化合物51、化合物52、化合物53、化合物54、化合物55、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0209】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で95%の殺虫活性を示した：化合物24、化合物26、化合物3、化合物4、化合物5、化合物6、化合物8、化合物9、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物23、化合物37、化合物44、化合物47、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物55、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物83、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0210】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.04 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で95%の殺虫活性を示した：化合物24、化合物26、化合物16、化合物21、化合物2

3、化合物37、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物58、化合物17、化合物67、化合物81、化合物82、化合物74、化合物73、化合物83、化合物85、化合物86、化合物87、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物36、化合物97、化合物96、化合物101、化合物100、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物109、化合物111、化合物115、化合物116、及び化合物119。

【0211】

試験例B：

マダニ成虫とのインビトロ接触試験

マダニとのインビトロ接触試験を、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、マダニ (イクソデス・リシヌス: *Ixodes ricinus*)、若しくはアメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*) の雄成虫及び雌成虫、又はマダニ (アムブリオンマ・アメリカヌム: *Amblyomma americanum*) の幼虫を用いて実施した。

【0212】

試験バイアルを被覆するために、試験物質をアセトン (高純度 (PA)) に溶解し希釈して所定の濃度とした。次に、前記溶液を、溶媒が完全に蒸発するまでオービタルシェーカー上で回転及び揺動することにより、ガラスバイアルの内壁及び基部に均一に塗布した。例えば、試験物質の900 ppm溶液を用いて、面積ベースで $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量を達成した。

【0213】

溶媒が完全に蒸発した後、5～10匹のダニ成虫を被覆した試験バイアルそれぞれに加え、各試験バイアルを穴あきプラスチック蓋で閉じ、暗所で室温及び周囲湿度 (*Rhipicephalus sanguineus*) で、又は気候制御キャビネット (*Ixodes ricinus*、*Dermacentor variabilis*、*Amblyomma americanum* [21℃、相対湿度85%]) で、水平位置でインキュベートした。それぞれのダニ種に対する殺ダニ活性は、48時間後に測定した。測定のために、試験バイアルを穏やかに叩いてダニを試験バイアルの基部に集めた後、試験バイアルを45℃～50℃のホットプレート上で5分以下でインキュベートした。試験バイアルの基部で動かない状態のダニ、又は熱を避けるために意図的に登ることなくぎこちなく動いたダニを、それぞれ死滅又は瀕死状態とみなした。

【0214】

$5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の物質投与量でダニの少なくとも80%が死滅又は瀕死状態であることが判明した場合、物質が各ダニ種に対して良好な殺ダニ活性を有すると判断した。100%の殺ダニ活性は、全てのダニが死滅したか瀕死状態であったことを意味する。0%の殺ダニ活性は、死滅又は瀕死状態にあるダニがいなかったことを意味する。

【0215】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アムブリオンマ・アメリカヌム (*Amblyomma americanum*) に対して $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物1、化合物2、化合物3、化合物4、化合物9、化合物11、化合物12、化合物15、化合物16、化合物19、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物39、化合物23、化合物37、化合物46、化合物51、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物62、化合物35、化合物34、化合物79、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物71、化合物64、化合物69、化合物65、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物89、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物100、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物1

10

20

30

40

50

08、化合物109、化合物110、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0216】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アムブリオンマ・アメリカヌム (*Amblyomma americanum*) に対して $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物24及び化合物26、並びに化合物11、化合物12、化合物15、化合物16、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物39、化合物37、化合物46、化合物56、化合物58、化合物60、化合物35、化合物34、化合物79、化合物67、化合物81、化合物82、化合物78、化合物74、化合物73、化合物71、化合物64、化合物69、化合物65、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物91、化合物92、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物100、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物108、化合物110、化合物115、化合物116、及び化合物118。

10

【0217】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アムブリオンマ・アメリカヌム (*Amblyomma americanum*) に対して $0.04 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物12、化合物56、化合物35、化合物86、化合物91、化合物95、化合物104、化合物106、化合物105、及び化合物110。

20

【0218】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*) に対して $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物26、化合物5、化合物9、化合物16、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物23、化合物37、化合物44、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物60、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物64、化合物68、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物115、及び化合物119。

30

【0219】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*) に対して $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物26、化合物9、化合物16、化合物21、化合物29、化合物33、化合物23、化合物37、化合物44、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物67、化合物81、化合物82、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物64、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物36、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物115、及び化合物119。

40

【0220】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*) に対して $0.04 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物23、化合物34、化合物81、化合物82、化合物7

50

8、化合物73、化合物85、化合物86、化合物91、化合物92、化合物97、化合物104、化合物103、及び化合物106。

【0221】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*) に対して $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示す：化合物24、化合物26、化合物9、化合物12、化合物16、化合物29、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物67、化合物81、化合物82、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物64、化合物65、化合物68、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物13、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物36、化合物95、化合物97、化合物101、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物108、化合物109、化合物110、化合物115、及び化合物118。

10

【0222】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*) に対して $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物9、化合物12、化合物16、化合物35、化合物34、化合物79、化合物67、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物64、化合物65、化合物68、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物13、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物104、化合物106、化合物105、化合物108、化合物109、化合物110、化合物116、及び化合物118。

20

【0223】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*) に対して $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物9、化合物12、化合物16、化合物35、化合物67、化合物78、化合物73、化合物72、化合物71、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物13、化合物89、化合物91、化合物92、化合物36、化合物95、化合物97、化合物101、化合物104、化合物103、化合物106、化合物108、化合物109、化合物110、化合物116、及び化合物118。

30

【0224】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物3、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物21、化合物29、化合物39、化合物23、化合物37、化合物44、化合物51、化合物54、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物108、化合物110、化合物115、化合物116、化合物117、及び化合物118。

40

【0225】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して $0.2 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示した：化合物3、化合物9、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物21、化合物29、化合物37、化合物4

50

4、化合物51、化合物54、化合物57、化合物59、化合物60、化合物17、化合物35、化合物34、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物84、化合物85、化合物86、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物101、化合物99、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物107、化合物108、化合物110、化合物115、化合物117、及び化合物118。

【0226】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して $0.04 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の用量で90%の殺ダニ活性を示す：化合物11、化合物12、化合物16、化合物21、化合物29、化合物17、化合物35、化合物67、化合物82、化合物76、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物68、化合物84、化合物86、化合物13、化合物91、化合物92、化合物36、化合物95、化合物104、化合物106、化合物108、化合物109、及び化合物115。

【0227】

試験例C：

コイタマダニ属 (*Rhipicephalus*) (オウシマダニ：*Boophilus microplus*) を用いたインビトロ注射投与試験 (BOOPMI注入)

注射投与用の適切な混合物を作製するために、試験物質をジメチルスルホキシドに溶解して希釈して所定の濃度とした。1 μL の試験混合物を、充血した5匹のオウシマダニ (コイタマダニ属：*Rhipicephalus* (*Boophilus microplus*)) 雌成虫の腹部にそれぞれ注射投与した。前記ダニをペトリ皿へ移して気候制御室 [28℃、相対湿度85%] で維持した。

【0228】

オウシマダニに対する殺ダニ活性は、産卵した受精卵の評価により7日後に評価した。正常に見えなかった卵を、42日後の幼虫孵化まで気候制御キャビネット [28℃、相対湿度85%] で保存した。100%の殺ダニ活性は、いずれのダニも卵を産まなかった又は産んだ卵がいずれも無精卵であったことを意味し、0%の殺ダニ活性は、ダニが卵を産み、全ての卵が受精卵であったことを意味する。

【0229】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.8 \mu\text{g}/\text{個体}$ の用量で100%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物1、化合物2、化合物3、化合物4、化合物5、化合物6、化合物7、化合物9、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物32、化合物33、化合物38、化合物39、化合物40、化合物42、化合物23、化合物37、化合物44、化合物45、化合物46、化合物47、化合物48、化合物49、化合物51、化合物52、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物112、化合物113、化合物114、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0230】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.16 \mu\text{g}$ ／個体の用量で100%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物5、化合物9、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物33、化合物38、化合物39、化合物42、化合物23、化合物37、化合物44、化合物45、化合物48、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物113、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

10

【0231】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.032 \mu\text{g}$ ／個体の用量で100%の殺ダニ活性を示した：化合物24、化合物26、化合物20、化合物21、化合物23、化合物37、化合物51、化合物54、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物17、化合物35、化合物34、化合物79、化合物81、化合物82、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物96、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物113、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

20

【0232】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、 $0.0064 \mu\text{g}$ ／個体の用量で100%の殺ダニ活性を示した：化合物23、化合物37、化合物35、化合物34、化合物81、化合物82、化合物89、化合物90、化合物92、化合物94、化合物104、化合物103、化合物106、及び化合物109。

30

【0233】

試験例D：

ノミを用いたネコノミ (*Ctenocephalides felis*) インビトロ給餌試験 (CTECFE経口)

ノミに給餌するための試験血液混合物を調製するために、試験物質をジメチルスルホキシドに溶解し、クエン酸処理したウシ血液で所定の濃度に希釈した。

40

【0234】

試験装置を組み立てるために、約20匹の未給餌の雄雌のネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を、ガーゼで上下を閉じたチャンバーに入れた。金属シリンドラーの一端をパラフィルム膜で密閉し、密閉した基部をチャンバーに置き、ノミがパラフィルム膜を介して吸収できる試験血液混合物で満たした。組み立てた試験装置を、約37℃で維持した。48時間後、ノミに対する食毒での殺虫活性を測定した。100%は、全てのノミが死滅したことを意味し、0%は、死滅したノミがいなかったことを意味する。

【0235】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、4ppmの用量で95%の食毒での殺虫活性を示した：化合物24、化合物26、化合物3、化合物5、化合物6、化合物

50

7、化合物8、化合物9、化合物10、化合物11、化合物12、化合物14、化合物15、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物29、化合物32、化合物33、化合物38、化合物39、化合物40、化合物42、化合物18、化合物23、化合物37、化合物44、化合物45、化合物46、化合物47、化合物48、化合物49、化合物50、化合物51、化合物52、化合物53、化合物54、化合物55、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物112、化合物113、化合物114、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0236】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.8ppmの用量で95%の食毒での殺虫活性を示した：化合物24、化合物26、化合物6、化合物8、化合物9、化合物11、化合物12、化合物14、化合物16、化合物19、化合物20、化合物21、化合物29、化合物33、化合物38、化合物39、化合物40、化合物42、化合物18、化合物23、化合物37、化合物44、化合物45、化合物46、化合物48、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物58、化合物59、化合物60、化合物61、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物75、化合物76、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物72、化合物71、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物98、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物112、化合物113、化合物114、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0237】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.16ppmの用量で95%の食毒での殺虫活性を示した：化合物11、化合物14、化合物16、化合物33、化合物38、化合物23、化合物37、化合物44、化合物45、化合物46、化合物48、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物56、化合物57、化合物59、化合物60、化合物62、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物79、化合物66、化合物67、化合物81、化合物82、化合物77、化合物78、化合物74、化合物73、化合物70、化合物64、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物84、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物36、化合物95、化合物97、化合物96、化合物101、化合物99、化合物100、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物112、化合物113、化合物114、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0238】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.032 ppmの用量で95%の食毒での殺虫活性を示した：化合物16、化合物23、化合物37、化合物49、化合物51、化合物53、化合物54、化合物17、化合物35、化合物34、化合物80、化合物74、化合物70、化合物69、化合物65、化合物68、化合物63、化合物83、化合物85、化合物86、化合物87、化合物13、化合物88、化合物89、化合物90、化合物91、化合物92、化合物93、化合物94、化合物102、化合物104、化合物103、化合物106、化合物105、化合物107、化合物108、化合物109、化合物110、化合物111、化合物113、化合物115、化合物116、化合物117、化合物118、及び化合物119。

【0239】

本試験では、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.0064 ppmの用量で95%の食毒での殺虫活性を示した：化合物16、化合物23、化合物49、化合物51、化合物53、化合物17、化合物34、化合物85、化合物36、化合物103、化合物106、化合物108、化合物111、化合物115、及び化合物116。

【0240】

試験例 E：

ラットのアメリカイヌカクマダニ幼虫及びネコノミによる局所処置インビボ試験

研究の種類及び全体的な研究デザイン：本方法は、欧州の動物福祉要件（European animal welfare requirements）に準拠した、無作為化非盲検有効性試験である。ラット（*Rattus norvegicus*）は、処置前のノミの数に基づいて無作為化した。処置の有効性は、種々の処置群とプラセボ処置対照群とにおけるノミ及びダニの数を比較することにより決定した。実験単位は個々の研究動物であった。

【0241】

投与方法及び投与経路：個体の体重を考慮して、化合物を含む適切な溶媒及びキャリア（より具体的には以下の混合物に添加：33.3重量%の炭酸プロピレン、67, 7重量%のN-メチルピロリドン、0.1重量%のBHA、0.05重量%のBHT）を局所スポットオンとして肩甲骨間の皮膚に直接投与した。

【0242】

実験的寄生：処置当日及びその後毎週、30匹のダニ（*D. variabilis* 幼虫）を各ラットの背中に放ち、24時間後に30匹のノミ（*C. felis*）を各ラットの背中に放った。

【0243】

ダニ及びノミの計数：ラットを徹底的に検査し、ダニ及びノミを、ダニの侵入後48時間（±4時間）及びノミの侵入後24時間で手作業で除去した。生存しているノミ及び生存している付着して充血したダニを集計した。明らかでない場合には、充血状態は、ろ紙上のダニを絞り充血の兆候としての血液の痕跡を見つけることによって評価した。

【0244】

10

20

30

40

50

【表 5】

表 2 4 7

未処置の対照ラットと比較した生存ダニ (*Derma cent or variabi lis*) 数の幾何平均減少率

	有効用量	SD 2	SD 9	SD 16	SD 23	SD 30
化合物 (B)	25 mg/kg	58	85	65	4	
化合物 51	25 mg/kg	82	95	80	73	55
化合物 67	25 mg/kg	57	98	100	100	77

SD＝試験日 (s t u d y d a y)

【 0 2 4 5 】

【表 6】

表 2 4 8

未処置の対照ラットと比較した生存ノミ (*C t e n o c e p h a l i d e s f e l i s*) 数の幾何平均減少率

	有効用量	SD 2	SD 9	SD 16	SD 23	SD 30
アフォキシラネル	10 mg/kg	100	99	51	16	
化合物 (B)	25 mg/kg	84	72	45		
化合物 24	10 mg/kg	100	99	97	96	77
化合物 51	25 mg/kg	100	98	91	95	93
化合物 67	25 mg/kg	98	93	97	81	79

SD＝試験日 (s t u d y d a y)

【 0 2 4 6 】

試験例 F :

アメリカヌカマダニ幼虫及びネコノミを用いたラットにおける全身処置インビボ試験
研究の種類及び全体的な研究デザイン：本方法は、欧州の動物福祉要件 (*E u r o p e a n a n i m a l w e l f a r e r e q u i r e m e n t s*) に準拠した、無作為化非盲検有効性試験である。ラット (*R a t t u s n o r v e g i c u s*) は、処置前のノミの数に基づいて無作為化した。処置の有効性は、種々の処置群とプラセボ処置対照群とにおけるノミ及びダニの数を比較することにより決定した。実験単位は個々の研究動物であった。

投与方法及び投与経路：個体の体重を考慮して、化合物を含む適切な溶媒及びキャリア（より具体的には、グリセロールホルマールに添加：難溶性化合物の場合、25体積%までのN-メチルピロリドンとの溶媒混合物を使用してもよい）を腹腔内注射として投与した。

【 0 2 4 7 】

実験的寄生：処置当日及びその後毎週、30匹のダニ (*D . v a r i a b i l i s* 幼虫) を各ラットの背中に放ち、24時間後に30匹のノミ (*C . f e l i s*) を各ラットの背中に放った。

【 0 2 4 8 】

10

20

30

40

50

ダニ及びノミの計数：ラットを徹底的に検査し、ダニ及びノミを、ダニの侵入後４８時間（±４時間）及びノミの侵入後２４時間で手作業で除去した。生存しているノミ及び生存している付着して充血したダニを集計した。明らかでない場合には、充血状態は、ろ紙上のダニを絞り充血の兆候としての血液の痕跡を見つけることによって評価した。

【０２４９】

【表７】

表２４９

未処置の対照ラットと比較した生存ダニ（*Dermacentor variabilis*）数の幾何平均減少率

	有効用量	SD 2	SD 9	SD 16	SD 23	SD 30
アfoxisラネル	2 mg/kg	86	53	5		
アfoxisラネル	10 mg/kg	100	10	78	0	
化合物 (B)	2 mg/kg	75	63	0		
化合物(B)	10 mg/kg	100	11	2		
化合物 37	10 mg/kg	100	100	99	99	80
化合物 66	10 mg/kg	100	100	100	100	95
化合物 67	2 mg/kg	100	95	32	20	
化合物 67	10 mg/kg	100	100	99	75	57
化合物 74	10 mg/kg	100	100	90	89	78
化合物 90	2 mg/kg	100	83	29		
化合物 103	10 mg/kg	100	100	74	43	
化合物 115	10 mg/kg	100	99	86	46	17
化合物 119	2 mg/kg	100	96	63	1	61
化合物 119	10 mg/kg	100	100	100	89	61

SD＝試験日（study day）

【０２５０】

【表 8】

表 250

未処置の対照ラットと比較した生存ノミ（*Ctenocephalides felis*）数の幾何平均減少率

	有効用量	SD 2	SD 9	SD 16	SD 23	SD 30
フルララネル	5 mg/kg	100	100	51	7	
アフォキシラネル	2 mg/kg	69	20	48		
アフォキシラネル	10 mg/kg	100	97	60	0	
化合物 (B)	2 mg/kg	97	32			
化合物(B)	10 mg/kg	100	53	6		
化合物 24	5 mg/kg	100	99	99	36	
化合物 43	5 mg/kg	100	99	90	91	13
化合物 37	10 mg/kg	100	97	97	100	80
化合物 51	2 mg/kg	100	96	67	37	
化合物 51	10 mg/kg	100	100	98	90	90
化合物 66	10 mg/kg	100	100	100	100	79
化合物 67	2 mg/kg	100	96	78	11	
化合物 67	10 mg/kg	100	100	93	61	58
化合物 74	10 mg/kg	91	96	86	89	78
化合物 70	10 mg/kg	99	100	99	49	7
化合物 93	10 mg/kg	100	97	68	14	
化合物 96	10 mg/kg	99	97	96	46	25
化合物 103	10 mg/kg	100	92	70	20	
化合物 115	2 mg/kg	100	98	73		
化合物 115	10 mg/kg	100	100	99	47	8
化合物 119	10 mg/kg	100	97	94	62	44

SD＝試験日（study day）

【0251】

試験例 G：

ハスモンヨトウ（*Spodoptera litura*）に対する殺虫試験

キャベツの葉を、試験化合物を所定の濃度で含む液体に 30 秒間浸漬し、風乾した。その葉を 7 cm 径ポリエチレンカップに入れ、ハスモンヨトウの第 2 期の幼虫を置いた。前記カップを 25℃の恒温室に入れ、6 日後に生存率を調査した。試験は、5 頭の幼虫、2 反復で実施した。結果として、化合物番号 44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77

、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、及び119が、100ppmの濃度で70%以上の殺虫率を示した。

【0252】

試験例H：

コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

キャベツの葉を、試験化合物を所定の濃度で含む液体に30秒間浸漬し、風乾した。その葉を7cm径ポリエチレンカップに入れ、コナガの第3期の幼虫を置いた。前記カップを25℃の恒温室内に入れ、6日後に生存率を調査した。試験は、5頭の幼虫、2反復で実施した。結果として、化合物番号44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、及び119が、100ppmの濃度で70%以上の殺虫率を示した。

【0253】

試験例I：

ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*) に対する殺虫試験

10匹のヒメトビウンカを用いて、所定の濃度に希釈された試験化合物のアセトン溶液を調製し、その溶液をイネの苗に噴霧し、イネの苗を風乾することにより、追加の試験を実施した。前記イネの苗を25℃の恒温室内に入れ、6日後に生存率を調査した。試験は、10頭、反復なしで実施した。結果として、化合物番号44、47、49、51、53、54、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、113、115、116、117、118、及び119が、100ppmの濃度で70%以上の殺虫率を示した。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 K 31/455

A 6 1 P 33/14 (2006.01)

A 6 1 P 33/14

C 0 7 D 213/82 (2006.01)

C 0 7 D 213/82

(72)発明者 ラルス・ベルファッカー

ドイツ連邦共和国 4 0 2 2 3 デュッセルドルフ ウレンベルクシュトラッセ 3 デー番

審査官 谷尾 忍

(56)参考文献

特表 2 0 1 7 - 5 0 2 0 3 7 (J P, A)

再公表特許第 2 0 1 1 / 0 9 3 4 1 5 (J P, A 1)

再公表特許第 2 0 0 6 / 1 3 7 3 9 5 (J P, A 1)

再公表特許第 2 0 1 0 / 0 1 8 7 1 4 (J P, A 1)

特表 2 0 1 1 - 5 0 6 5 0 4 (J P, A)

特表 2 0 1 0 - 5 0 2 6 6 3 (J P, A)

(58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)

A 0 1 N 4 7 / 0 2

A 0 1 P 7 / 0 2

A 0 1 P 7 / 0 4

A 0 1 N 3 7 / 4 6

A 0 1 N 4 3 / 4 0

A 0 1 N 4 1 / 1 0

A 0 1 N 4 1 / 0 6

A 0 1 N 4 3 / 2 6

A 0 1 N 4 1 / 1 2

A 0 1 M 1 / 2 0

A 6 1 K 3 1 / 4 5 5

C 0 7 D 2 1 3 / 8 2

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)