

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号
特許第4643024号
(P4643024)

(45) 発行日 平成23年3月2日 (2011.3.2)

(24) 登録日 平成22年12月10日 (2010.12.10)

(51) Int.Cl. F I

CO7D 239/26 (2006.01)

CO7D 239/28 (2006.01)

CO7D 239/30 (2006.01)

CO7D 239/34 (2006.01)

CO7D 239/36 (2006.01)

CO7D 239/26

CO7D 239/28

CO7D 239/30

CO7D 239/34

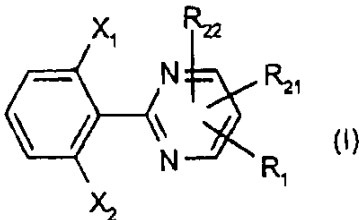
CO7D 239/36

請求項の数 5 (全 73 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2000-615596 (P2000-615596)	(73) 特許権者	504389991
(86) (22) 出願日	平成12年5月2日 (2000.5.2)		ノバルティス アーゲー
(65) 公表番号	特表2002-543188 (P2002-543188A)		スイス国 バーゼル リヒトシュトラーセ
(43) 公表日	平成14年12月17日 (2002.12.17)		35
(86) 国際出願番号	PCT/EP2000/003920	(74) 代理人	100077517
(87) 国際公開番号	W02000/066565		弁理士 石田 敬
(87) 国際公開日	平成12年11月9日 (2000.11.9)	(74) 代理人	100092624
審査請求日	平成19年4月4日 (2007.4.4)		弁理士 鶴田 準一
(31) 優先権主張番号	833/99	(74) 代理人	100108903
(32) 優先日	平成11年5月4日 (1999.5.4)		弁理士 中村 和広
(33) 優先権主張国	スイス (CH)	(74) 代理人	100082898
			弁理士 西山 雅也
		(74) 代理人	100081330
			弁理士 樋口 外治
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 農薬ピリミジン誘導体

(57) 【特許請求の範囲】
【請求項 1】
以下の式 (I) :
【化 1】



{式中、
R₁ は、非置換又はモノー若しくはジー置換フェニルであり、ここでその置換基は、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、及びフェニルであって、非置換、又はハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₆ -

ハロアルキルスルフィニル若しくは $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニルでさらに置換されたフェニルから成る群から選ばれ；

X_1 と X_2 は、互いに独立して、ハロゲンであり；

R_{21} は、H、OH、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $N - C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、N、 $N - ジ - C_1 - C_6$ - アルキルアミノ又は $N - C_3 - C_8$ - シクロアルキルアミノであり；そして

R_{22} は、H、OH 又はハロゲンである。} で表される化合物。

【請求項 2】

式中、 R_1 は、非置換又はモノー若しくはジ置換フェニルであり、ここでその置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、及びフェニルであって、非置換、又はハロゲン、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル若しくは $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシでさらに置換されたフェニルから成る群から選べる、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

式中、 R_1 は、非置換又はモノー若しくはジ置換フェニルであり、ここでその置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、及びフェニルであって、非置換、又はハロゲン、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル若しくは $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシでさらに置換されたフェニルから成る群から選ばれ；

X_1 と X_2 は、互いに独立して、フッ素又は塩素であり；

R_{21} は、H、OH、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_2$ - アルキル、シクロプロピル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_2$ - アルキルチオ、 $N - C_1 - C_4$ - アルキルアミノ、N、 $N - ジ - C_1 - C_2$ - アルキルアミノ又は $N - シクロプロピルアルキルアミノ$ であり；そして

R_{22} は、H である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

活性成分として少なくとも 1 の請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物、及び少なくとも 1 のアジュバントを含む、害虫 (pest) 防除用組成物。

【請求項 5】

植物、及びヒト以外の温血動物上の寄生生物を防除する方法における、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の使用。

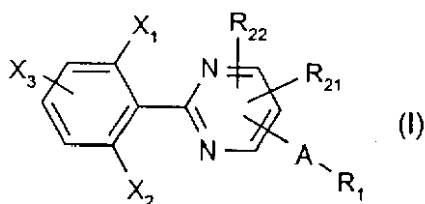
【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、以下の式：

【0002】

【化 3】



10

20

30

40

50

【0003】

{式中、

R₁ は、非置換又はモノー～ペンター置換アリーール又は複素アリーールであり、ここで、その置換基は、OH、ハロゲン、CN, NO₂, C₁ - C₆ アルキル、場合により置換されたC₃ - C₈ シクロアルキル、場合により置換されたC₃ - C₈ シクロアルケニル、C₁ - C₆ アルキル-C₃ - C₈ シクロアルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル-C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキル、C - C₆ アルコキシ、C₃ - C₈ シクロアルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₃ - C₈ ハロシクロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₃ - C₈ シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ ハロアルキルチオ、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₃ - C₈ シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₃ - C₈ シクロアルキルスルホニル、C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルスルホニル、場合により置換されたC₂ - C₈ アルケニル、場合により置換されたC₂ - C₈ アルキニル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、-C (=NOR₆) - C₁ - C₆ アルキルから成る群から選ばれ；R₇；非置換又はモノー～ペンター置換フェニル；非置換又はモノー～ペンター置換複素アリーール；ここで、その置換基は、OH、ハロゲン、CN, NO₂, C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₁ - C₆ -アルキル-C₃ - C₈ -シクロアルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル-C₁ - C₆ -アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₈ シクロアルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₃ - C₈ ハロシクロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₃ - C₈ シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ ハロアルキルチオ、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₃ - C₈ シクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₃ - C₈ シクロアルキルスルホニル、C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキルスルホニル、C₂ - C₈ アルケニル、C₂ - C₈ アルキニル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、-C (=NOR₆) - C₁ - C₆ アルキル、及びR₇ から成る群から選ばれ；非置換又はモノー～ペンター置換フェノキシ；非置換又はモノー～ペンター置換フェニルチオ；非置換又はモノー～ペンター置換フェニルアミノ；及び非置換又はモノー～ペンター置換N (フェニル) - (C₁ - C₆ アルキル)、ここで、上記置換基は、ハロゲン、CN, NO₂, C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₈ ハロシクロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₈ シクロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₃ - C₈ シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ ハロアルキルチオ、及びC₃ - C₈ ハロシクロアルキルチオから成る群から選ばれ；

Aは、単結合、C₁ - C₁₂アルキレン、O, O (C₁ - C₁₂アルキレン)、S (O)_n, S (O)_n (C₁ - C₁₂アルキレン)、C₂ - C₈ アルケニレン、C₂ - C₈ アルキニレン；NR₃ 又はNR₃ (C₁ - C₁₂アルキレン) であり；

R₃ は、H, C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₂ - C₈ アルケニル、C₂ - C₈ アルキニル、アリーール-C₁ - C₆ アルキル、(C H₂)_p C (O) R₄ 又はC₁ - C₆ アルコキシ-C₂ - C₆ アルキルであり；

R₄ はH, C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、N (R₅)₂ 又はC₁ - C₆ アルコキシ-C₂ - C₆ アルキルであり；

R₅ は、H, C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル又はアリーール-C₁ - C₆ アルキルであり；

R₆ は、H, C₁ - C₆ アルキル又はC₃ - C₈ シクロアルキルであり；

R₇ は、

【0004】

【化4】

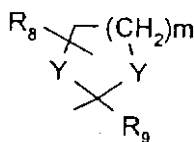
10

20

30

40

50



【0005】

であり；

R_8 と R_9 は、互いに独立して、H又は $C_1 - C_6$ アルキルであり；

X_1 と X_2 は、互いに独立してH又は R_{10} であり；

X_3 は、H又は R_{10} であり；

R_{10} は、ハロゲン、CN, NO_2 , $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ又は $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルチオであり；

R_{21} と R_{22} は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN, NO_2 , OH, SH、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキル- $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、ハロ $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、ハロ $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、ハロ- $C_3 - C_8$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、ハロ $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、ハロ $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $N(R_{23})R_{24}$ 、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ -アルケニルオキシ又は $C_2 - C_8$ -アルキニルオキシであり；

R_{23} と R_{24} は、互いに独立して、H、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル又は $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルであり；

m は、1, 2, 3又は4であり；

n は、0, 1又は2であり；そして

Y は、O又はSである。}により表される化合物、並びに生理学的に許容される付加化合物、及び適宜E/Z異性体、E/Z異性体の混合物、及び/又は互変異性体であって、各場合遊離形態又は農薬として許容される塩形態にあるもの；上記化合物の製法及びそれらの使用、上記化合物からその活性成分が選ばれるところの農薬組成物、並びに上記組成物の製法及びそれらの使用に関する。

【0006】

式(I)の化合物であって、式中、 R_1 が、非置換又はモノ〜ペンター置換アリール又は複素アリールであって、その置換基が、OH、ハロゲン、CN, NO_2 , $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキル、 $C - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハ

10

20

30

40

50

ロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルスルホニル、 $C_2 - C_8$ アルケキル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル、 $-C(=NOR_6) - C_1 - C_6$ アルキル、 R_7 、から選ばれたもの；非置換又はモノー～ペンター置換フェニルであってその置換基が、OH、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキル- $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルスルホニル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル、 $-C(=NOR_6) - C_1 - C_6$ アルキル、及び R_7 から成る群から選ばれたもの；非置換又はモノー～ペンター置換フェノキシ、非置換又はモノー～ペンター置換フェニルチオ、非置換又はモノー～ペンター置換フェニルアミノ、及び非置換又はモノー～ペンター置換N（フェニル）-（ $C_1 - C_6$ アルキル）であってその置換基が、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ、及び $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルチオから成る群から選ばれるものであり；

10

20

R_{21} と R_{22} が互いに独立して、H、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル又は $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルであり；

30

Aが、 $(CR_{11}R_{12})_p$ 、 $O(CR_{11}R_{12})_p$ 、 $S(O)_n(CR_{11}R_{12})_p$ 、非置換又は置換 $C_2 - C_8$ -アルケニレン、非置換又は置換 $C_2 - C_8$ -アルキニレンであってその置換基が、 R_{11} と R_{12} から成る群から選ばれたもの；又は $NR_3(CH_2)_p$ であり； R_3 が、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、アリーール- $C_1 - C_6$ アルキル、 $(CH_2)_pC(O)R_4$ 又は $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_2 - C_6$ アルキルであり；

R_4 はH、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $N(R_5)_2$ 又は $C_1 - C_6$ アルコキシ- $C_2 - C_6$ アルキルであり；

R_5 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル又はアリーール- $C_1 - C_6$ アルキルであり；

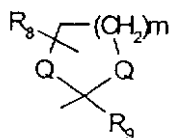
40

R_6 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル又は $C_3 - C_8$ シクロアルキルであり；

R_7 は、

【0007】

【化5】



10

【0008】

であり；

R_8 と R_9 は、互いに独立して、H又は $C_1 - C_6$ アルキルであり；

X_1 と X_2 は、互いに独立してH又は R_{10} であり；

X_3 は、H又は R_{10} であり；

R_{10} は、ハロゲン、CN, NO_2 , $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ又は $C_3 - C_8$ ハロシクロアルキルチオであり；

20

R_{11} と R_{12} は、互いに独立してH又は $C_1 - C_6$ -アルキルであり；

m は、1, 2, 3又は4であり；

n は、0, 1又は2であり；

p は、0, 1, 2, 3, 4, 5又は6であり；そして

Q は、O又はSであるもの、適宜、E/Z異性体、その混合物、及び／又は互変異性体であって、各場合において遊離形態又は農薬として使用されうる塩形態にあるものが好ましい。

【0009】

30

文献中、特定のピリジン誘導体が、家畜動物 (domestic animals) 及び家畜 (productive livestock) のための、及び有用な植物の農作物中の害虫 (pests) のための農薬中の活性成分として提案されている。上記の既知の化合物の生物学的特性は、害虫防除の分野において完全に満足いくものではない。このため、農薬特性を有するさらなる化合物を提供する必要がある、この課題は式 (I) の化合物の開発により本発明に従って解決されるのである。

【0010】

式 (I) の化合物は、塩の形態にあることができ、又は例えば、酸付加塩を形成することができる；しかしながら遊離形態が好ましい。後者は、例えば、強無機酸、例えば、鉍酸、例えば、硫酸、リン酸又はハロゲン化水素酸、強無機有機カルボン酸、典型的には例えば、適宜ハロゲンにより置換された $C_1 - C_4$ アルカンカルボン酸、例えば、酢酸、例えば場合により不飽和のジカルボン酸、例えば、シュウ酸、マロン酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、典型的にはヒドロキシカルボン酸、例えば、アスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は安息香酸、又は有機スルホン酸、典型的には、例えば、ハロゲンにより置換された $C_1 - C_4$ アルカン-又はアリーールスルホン酸、例えば、メタンスルホン酸又は p -トルエンスルホン酸と形成される。本明細書の全体にわたり、式 (I) の遊離化合物又はそれらの塩への言及は、適宜類推によりその対応の塩又は式 (I) の遊離の化合物をも含むと理解されるべきである。

40

【0011】

本明細書中に使用する一般用語は、別段の定めなき場合、以下の意味をもつ。

50

【0012】

別段の定めなき場合、炭素含有基及び化合物は、各々、1～6（含む）、好ましくは1～4（含む）、より特に1又は2の炭素原子を含む。

【0013】

アリールは、フェニル又はナフチルである。

【0014】

複素アリールは、特に、ピリジル、ピリミジル、s-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、チエニル、フラニル、ピリール、ピラゾールイル、イミダゾールイル、チアゾールイル、トリアゾールイル、オキサゾールイル、チアジアゾールイル、オキサジアゾールイル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾールイル、インドールイル又はインダゾールイルであって好ましくは、炭素原子を介して結合されているものであり；チアゾールイル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾールイル又はインドールイル、特にチアゾールイル又はインドールイルが好ましい。

10

【0015】

ハロゲンは、一基自体並びに他の基及び化合物、例えば、ハロアルキル、ハロアルコキシ、及びハロアルキルチオの構造要素としてフッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素、主にフッ素又は塩素である。

【0016】

アルキルは、一基自体並びに他の基及び化合物、例えば、ハロアルキル、アルコキシ、及びアルキルチオの構造要素として一各場合において、着目の基又は化合物内に含まれる炭素原子の数を十分に考慮して、直鎖、すなわち、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチル、又は分枝、例えば、イソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル又はイソヘキシルである。

20

【0017】

シクロアルキルは、一基自体並びに他の基及び化合物、例えば；ハロシクロアルキル、シクロアルコキシ、及びシクロアルキルチオの構造要素として、各場合において、着目の基又は化合物内に含まれる炭素原子の数を十分に考慮して、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルである。

30

【0018】

アルケニルは、一基自体並びに他の基及び化合物の構造要素として、着目の基又は化合物内に含まれる炭素原子及び共役1又は孤立した2重結合の数を十分に考慮して、直鎖、例えば、アリル、2-ブテニル、3-ペンテニル、1-ヘキセニル、1-ヘプテニル、1, 3-ヘキサジエニル又は1, 3-オクタジエニル、又は分枝、例えば、イソプロペニル、イソブテニル、イソプレニル、tert-ペンテニル、イソヘキセニル、イソヘプテニル又はイソオクテニルである。

【0019】

アルキニルは、一基自体並びに他の基及び化合物の構造要素として、各場合において、着目の基又は化合物内に含まれる炭素原子、及び共役し又は孤立した2重結合の数を十分に考慮して、直鎖、例えば、プロパルギル、2-ブチニル、3-ペンチニル、1-ヘキシニル、1-ヘプチニル、3-ヘキセン-1-イニルは1, 5-ペプタジエン-3-イニル、あるいは分枝、例えば、3-メチルブチ-1-イニル、4-エチルペンチ-1-イニル、4-メチル-ヘキシ-2-イニル又は2-メチルペチ-3-イニルである。

40

【0020】

アルキレン、アルケニレン、及びアルキニレンは、直鎖又は分枝橋員、特に、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH(CH_3)CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2C(CH_3)_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-$ ； $-C\equiv C-$ 、及び $-CH_2C\equiv C-$ ；より特に $-CH_2-$ である。

【0021】

50

ハロゲン置換炭素含有基及び化合物、例えば、ハロアルキル、ハロアルコキシ、及びハロアルキルチオは、部分的にハロゲン化又はパーハロゲン化されることができ、ポリハロゲン化の場合のハロゲン置換基は同一であっても相違していてもよい。ハロアルキルの例は、一基自体並びに他の基及び化合物、例えば、ハロアルコキシ及びハロアルキルチオの構造要素として、1～3回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたメチル、例えば、 CHF_2 又は CF_3 ; 1～5回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたエチル、例えば、 CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF 又は CClFCHClF ; 1～7回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたプロピル又はイソプロピル、例えば、 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHF CF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 又は $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; 1～9回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたブチル又はその異性体、例えば、 $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHF CF}_3$ 又は $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; 1～11回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたペンチル又はその異性体、例えば、 $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 又は $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; そして1～13回、フッ素、塩素及び／又は臭素により置換されたヘキシル又はその異性体、例えば、 $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ 又は $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ である。

【0022】

場合により置換された基、例えば、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルケニル又は $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルは、好ましくは、OH, CN、ニトロ、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、フェニル、ハロゲンフェニル、フェノキシ、 NHR_3 , $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、及び $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルである。

【0023】

本発明において本発明の範囲内の好ましい態様は、式(I)の化合物、そして適宜E/Z異性体、その混合物、及び／又は互変異性体であって各場合において遊離形態又は農薬として使用されうる塩形態にあるもの（生理学的に許容される付加化合物を含む）であり、

(1) R_1 は、非置換又はモノー～トリー置換フェニルであり、その置換基は、ハロゲン、CN、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルスルホニルから成る群から選ばれ；非置換又はモノー～トリー置換フェニルから成る群から選ばれ、その置換基は、ハロゲン、CN, NO_2 , $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルチオ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、及び $\text{C}_3 - \text{C}_8$ ハロシクロアルキルスルホニルから成る群から選ばれ；

非置換又はモノー～トリー置換フェノキシ；非置換又はモノー～トリー置換フェニルチオ、非置換又はモノートリ置換フェニルアミノ、及び非置換又はモノー～トリー置換-N（フェニル）（ C_1-C_6 -アルキル）、ここで、それら置換基は、それぞれ、ハロゲン、CN, NO_2 , C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、及び C_3-C_8 -シクロアルコキシから成る群から選ばれ；

好ましくは、モノー又はジ-置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、CN、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシ、非置換又はモノー～トリー置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、CN, NO_2 , C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、及び C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシから成る群から選ばれ、から成る群から選ばれ；非置換又はモノー～トリー置換フェノキシ、及び非置換又はモノー～トリー置換フェニルアミノここで、上記フェノキシ-及びフェニルアミノ-基の置換基は、ハロゲン、CN, NO_2 , C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、及び C_1-C_4 -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ；

好ましくはモノー又はジ-置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、CN、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシ、非置換又はモノー～トリー置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、CN, NO_2 , C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、及び C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシから成る群から選ばれ；非置換又はモノー～トリー置換フェノキシ、及び非置換又はモノー～トリー置換フェニルアミノ、ここで、上記フェノキシ-及びフェニルアミノ-基の置換基は、CN, NO_2 , C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、及び C_1-C_4 -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ、から成る群から選ばれ；

より好ましくは、モノー又はジ-置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、非置換又はモノー～トリー置換フェニル、ここで、その置換基は、ハロゲン、CN, NO_2 , C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、及び C_1-C_4 -ハロアルコキシから成る群から選ばれ、非置換又はモノー～トリー置換フェノキシ、及び非置換又はモノー～トリー置換フェニルアミノ、ここでその置換基は、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、及び C_1-C_6 -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ、から成る群から選ばれ；

最も好ましくは、非置換フェニル、ここで、その置換基は、フッ素、塩素、 C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -ハロアルキル、及び非置換又はモノー又はジ-置換フェニルから成る群から選ばれ、ここで、その置換基は、フッ素、塩素、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロアルコキシ、 C_1-C_2 -アルキルチオ、及

10

20

30

40

50

び $C_1 - C_2$ -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ；

さらに特に、モノ置換フェニル、ここで、その置換基は、モノー又はジ置換フェニルであり、ここで、その置換基は、フッ素、塩素、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ、 $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_2$ -アルキルチオ、及び $C_1 - C_2$ -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ；

(2) R_{21} と R_{22} は、互いに独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、又は $C_1 - C_6$ -ハロアルキル；好ましくはH又はハロゲン；最も好ましくは特にHであり；

(3) Aが単結合、 $C_1 - C_6$ アルキレン、O、O ($C_1 - C_6$ アルキレン)、 $C_2 - C_4$ -アルケニレン、 $C_2 - C_4$ アルキニレン又は NR_3 ；好ましくは、単結合、O、OC H_2 -、 $C \equiv C$ 、 $CH=CH$ 又は NH ；より好ましくは単結合又はO；最も好ましくは単結合であり；

(4) R_3 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル又は $C_1 - C_6$ ハロアルキル；好ましくはH又は $C_1 - C_6$ アルキル；より好ましくはH又は $C_1 - C_2$ アルキルであり；

(5) X_1 と X_2 は、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ；好ましくはハロゲン、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ又は $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ；特にフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシ；特に塩素又はフッ素；より特にフッ素であり；

(6) X_3 は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ；好ましくはH、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ又は $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ；最も好ましくは、H、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシ、特にH、フッ素又は塩素；より特にHであり；

(7) R_1 は、非置換又はモノー～トリ置換フェニル環であり、その置換基は、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルスルホニルから成る群から選ばれ；非置換又はモノー～トリ置換フェニル、この置換基は、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、及び $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキルスルホニルから成る群から選ばれ；非置換又はモノー～トリ置換フェノキシ、非置換又はモノー～トリ置換フェニルチオ、非置換又は、モノー～トリ置換フェニルアミノ及び非置換又はモノー～トリ置換-N (フェニル) ($C_1 - C_6$ -アルキル)、ここで、上記フェノキシ、フェニルチオ、フェニルアミノ、及び-N (フェニル) ($C_1 - C_6$ -アルキル) 基はそれぞれ、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ ハ

10

20

30

40

50

ロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル、及び $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシから成る群から選ばれ；

R_{21} と R_{22} は、互いに独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル又は $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであり；

Aは、単結合、 $C_1 - C_{12}$ アルキレン、O、O ($C_1 - C_{12}$ アルキレン)、 $C_2 - C_8$ アルケニレン、 $C_2 - C_8$ アルキニレン；又は NR_3 であり；

R_3 は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル又は $C_1 - C_6$ ハロアルキルであり；

X_1 と X_2 は、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオであり；

X_3 は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ又は $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオであり；

(8) R_1 は、モノー又はジー置換フェニルであり、その置換基は、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシから成る群から選ばれ、非置換又はモノー又はトリー置換フェニル、その置換基はハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、及び $C_3 - C_8$ ハロシクロアルコキシから成る群から選ばれ、非置換又はモノー〜トリー置換フェノキシ、及び、非置換又はモノー〜トリー置換フェニルアミノ、ここで、上記置換基は、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_8$ -ハロアルコキシ、及び $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシから成る群から選ばれ；

R_{21} と R_{22} は、互いに独立して、H又はハロゲンであり；

Aは、単結合、O、 $C \equiv C$ 、 $CH=CH$ 又は NH であり；

X_1 と X_2 は、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ又は $C_1 - C_2$ ハロアルコキシであり；

X_3 は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ又は $C_1 - C_2$ ハロアルコキシであり；

(9) R_1 は、モノー又はジー置換フェニル、その置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ；非置換又はモノー〜トリー置換フェニル、ここで、上記置換基は、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、及び $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオから成る群から選ばれ；そして非置換又はモノー〜トリー置換フェノキシ、ここで、上記置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、及び $C_1 - C_6$ -アルコキシから成る群から選ばれ；

R_{21} と R_{22} は、Hであり；

Aは単結合であり；

X_1 と X_2 は、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ又は $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシであり；そして

X_3 は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ又は $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシであり；

(10) R_1 は、モノー又はジー置換フェニル、ここで、上記置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキルから成る群から選ばれ；そして非置換又はモノー又はジー置換フェニル、ここで、上記置換基は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル

10

20

30

40

50

、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオから成る群から選ばれ；
 R_{21} と R_{22} はHであり；
Aは、単結合であり；
 X_1 と X_2 は、互いに独立して、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシであり；そして
 X_3 は、H、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシであり；
(11)式中、基 $A - R_1$ は、上記トリアジン環上の5位にある、
である式(I)の化合物である。

【0024】

10

本発明の範囲内では、表1～4中に列記した式(I)の化合物が特に好ましく、そして合成実施例中に言及する化合物が最も特に好ましい。

【0025】

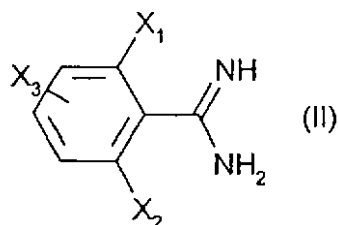
本発明さらなる目的は、各場合において、遊離形態又は塩形態にある、式(I)の化合物の製法であって、

a) 式中、 R_{21} と R_{22} がハロゲン以外であり、そして $A - R_1$ が5位にあるところの式(I)の化合物の製造のために、遊離形態又は塩形態における、以下の式：

【0026】

【化6】

20



30

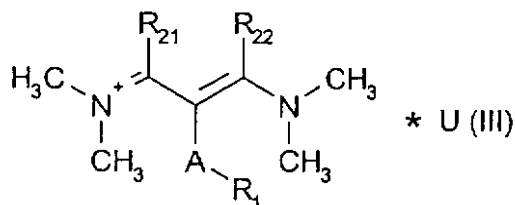
【0027】

{知られており、又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、 X_1 、 X_2 、及び X_3 は、式(I)のために定義したものと同一である。}により表される化合物を、以下の式：

【0028】

【化7】

40



【0029】

50

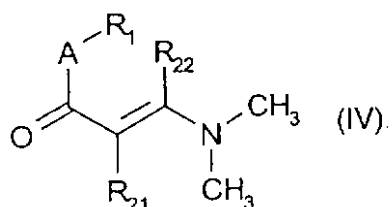
{式中、Uはアニオン、例えば、ハロゲンイド、スルフェート、パークロレート又はニトレートであり、そして知られており、又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、A、 R_1 、 R_{21} 、及び R_{22} は、式(I)のために定義したものと同じである。}により表される化合物と、場合により塩基触媒、例えば、ナトリウム・メチレートの存在下で、反応させ、又は

b) 式中、Aがアルキレン、 $C_2 - C_8$ -アルキレン又は $C_2 - C_8$ -アルキニレンであり、そして R_{22} がハロゲン以外であるところの式(I)の化合物の製造のために、遊離形態又は塩形態における式(II)の化合物を、以下の式：

【0030】

【化8】

10



20

【0031】

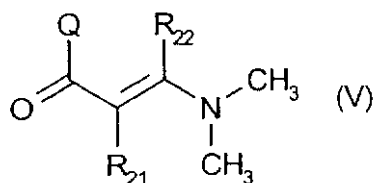
{知られており、又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、 R_1 、 R_{21} 、及び R_{22} は式(I)のために定義したものと同じであり、そしてAはアルキレン、 $C_2 - C_8$ -アルケニレン又は $C_2 - C_8$ -アルキニレンである。}により表される化合物と、場合により塩基触媒、例えば、ナトリウム・メチレートの存在下で反応させ、又は

b) 式中、AがO、O($C_1 - C_{12}$ アルキレン)S(O) $_n$ 又はS(O) $_n$ ($C_1 - C_{12}$ -アルキレン)であり、そして R_{22} がハロゲン以外である式(I)の化合物の製造のために、遊離形態又は塩形態における式(II)の化合物を以下の式：

【0032】

【化9】

30



40

【0033】

{知られており、又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、 R_{21} と R_{22} が式(I)のために定義したものと同じであり、そしてQは脱離基、好ましくはハロゲン又は $C_1 - C_6$ -アルコシキ基である。}により表される化合物と、反

50

応させ、そして得られた生成物を、場合により中間体の単離後に、ハロゲン化剤、好ましくは、 PCl_5 、 POCl_3 又は $(\text{COCl})_2$ と反応させ、そして得られた生成物を、場合により新生中間体の単離後に、以下の式：

$\text{HA}-\text{R}_1$ (VI)

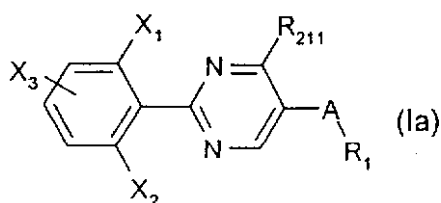
{知られており、又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、Aと R_1 は、式(I)のために定義したものと同一である。}により表される化合物と、場合により塩基触媒の存在下で反応させ、又は

d) 以下の式：

【0034】

【化10】

10



20

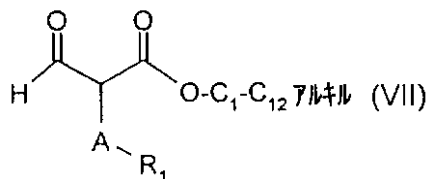
【0035】

{式中、 X_1 、 X_2 、 X_3 、A、及び R_1 は式(I)のために先に定義したものと同一であり、そして R_{211} がハロゲン、OH、SH、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_8 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_3-C_8 -シクロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_3-C_8 -シクロアルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキルスルホニル、 $\text{N}(\text{R}_{23})\text{R}_{24}$ 、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_2-C_8 -アルケニルオキシ又は C_2-C_8 -アルキニルオキシであり、そして R_{23} と R_{24} は式(I)のために先に定義したものと同一である。}により表される化合物の製造のために、上記式(II)の化合物を、以下の式：

【0036】

【化11】

30

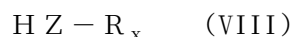


40

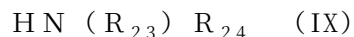
50

【0037】

{式中、AとR₁が式(I)のために先に定義したものと同一である。}により表される化合物と反応させ、そして式中、R₂₁₁がOHであるところのこのようにして得られた式(Ia)の化合物を、場合により、ハロゲン化剤と反応させて、式中R₂₁₁がハロゲン、特に塩素である式(Ia)の化合物を形成させ、そして式中、R₂₁₁がハロゲンであるこのようにして得られた式(Ia)の化合物を、以下の式：



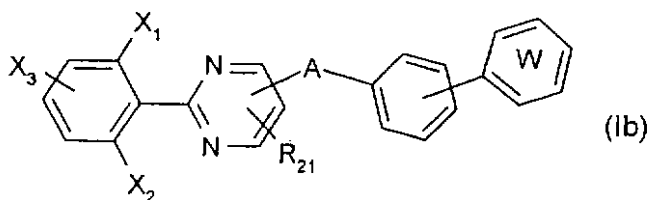
{式中、ZがO又はSであり、そしてR_xがH、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ハロ-C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₈-アルケニル又はC₂-C₈-アルキニルである。}により表される化合物と、又は以下の式：



{式中、R₂₃とR₂₄は式(I)において与えた意味をもつ。}により表される化合物と反応させ、そして式中、置換基R₂₁₁がS原子により上記ピリミジン環に結合されているところのこうして得られた式(Ia)の化合物を、場合により酸化し、又は
e) 以下の式：

【0038】

【化12】

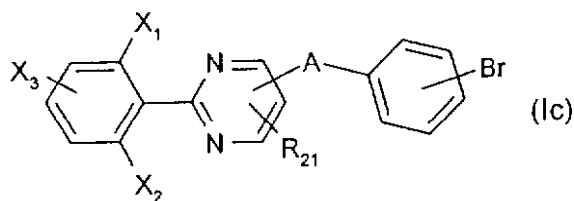


【0039】

{式中、A、X₁、X₂、X₃、R₂₁が式(I)のために先に定義したものと同一であり、そしてWで印をした環が式(I)において示すように置換されている。}により表される化合物の製造のために、以下の式：

【0040】

【化13】

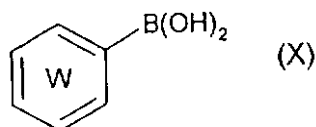


【0041】

{式中、 X_1 , X_2 , X_3 , R_{21} が式 (I) のために先に定義したものと同一である。} により表される化合物を、以下の式：

【0042】

【化14】



10

【0043】

{場合により、式 (I c) において示すWで印をした環内で置換され、そして知られているか又はそれ自体知られた方法により製造されうる。} により表される化合物と反応させ

20

；
そして各場合において、所望により、式 (I) の化合物であって、遊離形態又は塩形態にあり、上記方法に従って又は他の方法により得られうるものを、異なる式 (I) の化合物に変換し、上記方法に従って得られうる異性体混合物を分割し、そして所望の異性体を単離し、そして／又は上記方法に従って得られうる遊離の式 (I) の化合物を塩に変換し、又は上記方法に従って得られうる式 (I) の化合物の塩をその遊離の式 (I) の化合物又は異なる塩に変換する、

ことを含む前記方法にも関する。

【0044】

式 (I) の化合物の塩に関して先に行った言及は、本明細書の全体にわたり言及する出発

30

材料と同様に、それらの塩に関しても適用される。

【0045】

反応ステップ a) ~ h) においては、上記反応体は、そのまますなわち、溶媒又は希釈剤を添加せずに、その熔融状態で、互いに反応することができる。しかしながら、不活性溶媒又は希釈剤又はその混合物を添加することが有利である。

【0046】

変法 a) :

溶媒及び希釈剤の例は：芳香族、脂肪族、及び脂環式炭化水素及びハロゲン化炭化水素、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、テトラリン (Tetralin)、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ブロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン、及びテトラクロロエテン；エーテル、例えば、ジエチル・エーテル、ジプロピル・エーテル、ジイソプロピル・エーテル、ジブチル・エーテル、tert-ブチル・メチル・エーテル、エチレン・グリコール・モノメチル・エーテル、エチレン・グリコール・モノエチル・エーテル、エチレン・グリコール・ジメチル・エーテル、ジメトキシジエチル・エーテル、テトラヒドロフラン、及びジオキサン；ケトン、例えば、アセトン、メチル・エチル・ケトン、及びメチル・イソブチル・ケトン；アルコール、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレン・グリコール、及びグリセロール；及びスルホキシド、例えば、ジメチル・スルホキシドを含む。反応が塩基の存在下で生じる場合、過剰に使用される塩基、例えば、トリエチル

40

50

アミン、ピリジン、N-メチルモルフォリン、又はN, N-ジエチルアニリンも溶媒又は希釈剤として役立つ。アルコールが好ましい。

【0047】

反応は、有利には、約0℃～約+150℃の、好ましくは約20℃～約+100℃の温度範囲内で行われる。

【0048】

変法a)の好ましい態様においては、式(II)の化合物を、約50℃～約100℃、好ましくは約65℃において、アルコール、好ましくはメタノール中、塩基触媒、好ましくはナトリウム・メタノレートの存在下で、式(III)の化合物と反応させる。

【0049】

変法b)：

溶媒及び希釈剤の例は、変法a)の下で与えられる。

【0050】

反応は、有利には、約0℃～約+150℃の、好ましくは約20℃～約+100℃の温度範囲内で行われる。

【0051】

変法b)の好ましい態様においては、式(II)の化合物を、約50℃～約100℃、好ましくは約80℃において、アルコール、好ましくはエタノール中で、塩基触媒、好ましくはカリウムt-ブチレートtの存在下で、式(IV)の化合物と反応させる。

【0052】

変法c)：

溶媒及び希釈剤の例は、変法a)の下に与えられる。

【0053】

反応は、有利には、約0℃～約+150℃の、好ましくは約20℃～約+100℃の温度範囲内で行われる。

【0054】

変法c)の好ましい態様においては、式(II)の化合物を、約50℃～約100℃の、好ましくは約80℃において、アルコール、好ましくはエタノール中、塩基触媒、例えば、カリウムt-ブチレートtの存在下で、式(V)の化合物と反応させ、得られた中間体を単離し、不活性溶媒、好ましくはポリ塩化芳香族化合物中、POCl₃と反応させ、そして得られた生成物を、さらに単離した後、式(VI)の化合物と反応させる。

【0055】

変法d)：

溶媒又は希釈剤の例は、変法a)の下に与えられる。

【0056】

反応は、有利には、約0℃～約+150℃の、好ましくは約20℃～約+100℃の温度範囲内で行われる。

【0057】

好ましい態様においては、式(II)の化合物を、50～150℃、好ましくは約120℃において、トルエン中、有機塩基、例えばトリエチルアミンの存在下、又は酸、例えば、トルエンスルホン酸の存在下、式(VII)の化合物と反応させる。このようにして得られた中間体を、塩素化剤、例えば、POCl₃と反応させ、そしてさらに、式(VIII)の又は式(IX)の化合物と反応させる。

【0058】

変法e)：

溶媒又は希釈剤の例は、変法a)の下に与えられる。

【0059】

反応は有利には、約0℃～約+150℃、好ましくは約20℃～約+100℃の温度範囲内で行われる。

【0060】

10

20

30

40

50

好ましい態様においては、式 (I c) の化合物は、約 40 ~ 90 °C で、好ましくは約 60 °C で、ジメトキシエチレン中、Pd-錯触媒、例えば $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ の存在下、そして水性 NaHCO_3 の存在下、式 (X) の化合物と反応させる。

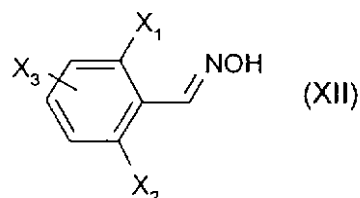
【0061】

本発明のさらなる目的は、

f) 式 (II) の化合物の製造方法であって、以下の式：

【0062】

【化15】



10

【0063】

{知られており又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、 X_1 、 X_2 、及び X_3 が式 (I) のために定義したものと同一である。} により表される化合物を、次亜塩素酸アルキル、好ましくは、塩素、次亜塩素酸 t-ブチル又は N-クロロスクシンイミドで処理し、得られた中間体を、単離せずにアンモニアと反応させ、そして得られたヒドロオキサム酸アミドを、場合により中間体単離の後、水添触媒、好ましくは、ニッケルの存在下で、水素化し；そして各場合において、望ましい場合、遊離形態又は塩形態で存在する上記方法又は他の方法に従って得られうる式 (II) の化合物を、異なる式 (II) の化合物に変換し、上記方法に従って得られうる異性体混合物を分割し、そして所望の異性体を単離し、そして／又は上記方法に従って得られうる式 (II) の遊離化合物を塩に変換し、又は式 (II) の化合物から上記方法に従って得られうる塩を、式 (II) の遊離化合物又は異なる塩に変換する方法である。

20

30

【0064】

ステップ変法 f) の溶媒又は希釈剤の例は、式 (I) の化合物の製造のために変法 a) において与えられる。

【0065】

反応は有利には、約 -20 °C ~ 約 +100 °C、好ましくは 0 °C ~ 約 +30 °C の温度範囲内で行われる。

【0066】

好ましい態様においては、式 (XII) の化合物は、不活性溶媒、好ましくは塩化メチレン中、室温で、次亜塩素酸、t-ブチルで処理され、その生成物を、さらに、単離せずに、アルコール性アンモニア溶液と反応させ、そして中間体を単離した後、触媒としてニッケルを使用して水素添加する。

40

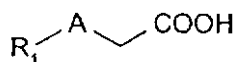
【0067】

本発明のさらなる目的は、

g) 式 (III) の化合物の製造方法であって、例えば、以下の式：

【0068】

【化16】



10

【0069】

{知られており又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、AとR₁が式(I)のために先に与えたように定義されたものである。}により表される化合物を、ジメチル・ホルムアミドとPOCl₃の混合物と反応させ、そして各場合において、望ましい場合、遊離形態又は塩形態で存在する上記方法又は他の方法により得られうる式(III)の化合物を異なる式(II)の化合物に変換し、上記方法に従って得られうる異性体混合物を分割し、そして所望の異性体を単離し、そして／又は上記方法に従って得られうる式(III)の遊離化合物を塩に変換し、又は式(III)の化合物から上記方法に従って得られうる塩を式(III)の遊離化合物又は異なる塩に変換する方法である。

20

【0070】

ステップ変法g)の溶媒又は希釈剤の例は、式(I)の化合物の製造のための本法a)の下に与えられる。

【0071】

反応は、有利には、約-20℃～約100℃、好ましくは-10℃～約+80℃の温度範囲内で行われる。

【0072】

好ましい態様においては、式(XII)の化合物を、約20～80℃で無溶媒で、ジメチルホルムアミドとPOCl₃の混合物と反応させる。

【0073】

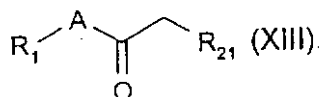
本発明のさらなる目的は、

30

h) 式(IV)の化合物の製造方法であって、以下の式：

【0074】

【化17】



40

【0075】

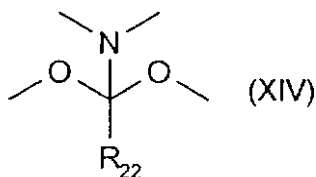
{知られており又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、AとR₁が式(I)のために先に与えたように定義されたものである。但し、Aは、O、O(C₁-C₁₂-アルキレン)、S(O)_n、S(O)_n(C₁-C₁₂-アルキレン)、NR₃又はNR₃(C₁-C₁₂-アルキレン)以外である。}により表される化合物を

50

、以下の式：

【0076】

【化18】



10

【0077】

{知られており又は対応の知られた化合物と同様にして製造されることができ、そして式中、 R_{22} が式(I)のために先に与えたように定義されたものである。}により表される化合物と反応させ、そして各場合において、所望により、遊離形態又は塩形態で存在する上記方法又は他の方法により得られうる式(IV)の化合物を、異なる式(IV)の化合物に変換し、上記方法に従って得られうる異性体混合物を分割し、そして所望の異性体を単離し、そして／又は上記方法に従って得られうる式(IV)の遊離化合物を塩に変換し、又は式(IV)の化合物から上記方法に従って得られうる塩を、式(IV)の遊離化合物又は異なる塩に変換する方法である。

20

【0078】

ステップ変法h)の溶媒又は希釈剤の例は、式(I)の化合物の製造のために変法a)において与えられる。

【0079】

反応は有利には、約 -20°C ～約 $+100^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは -10°C ～約 $+80^{\circ}\text{C}$ の温度範囲内で行われる。

【0080】

好ましい態様においては、式(XIII)の化合物を、約 $20\sim 80^{\circ}\text{C}$ において無溶媒で、ジメチルホルムアミドと POCl_3 の混合物と反応させる。

30

【0081】

式(I)の化合物の塩は、それ自体知られたやり方で調製されることができる。例えば、酸付加塩は、式(I)の化合物から、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理により得られ、そして好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理による塩基との塩である。

【0082】

式(I)の化合物の塩は、慣用のやり方で遊離の式(I)の化合物に変換されることができ；これらは、例えば、好適な塩基組成物又は好適なイオン交換試薬による処理による、酸付加塩、及び例えば、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理による塩基との塩である。

40

【0083】

式(I)の化合物の塩は、それ自体知られたやり方で、式(I)の化合物の他の塩に変換されることができ；酸付加塩は、例えば、形成する無機塩、例えば塩化銀がその中で不溶であり、そしてそれ故反応混合物から析出するところの好適な溶媒中での、酸の好適な金属塩、例えばナトリウム、バリウム又は銀塩による、例えば酢酸銀による、無機酸の塩、例えば、塩化水素塩の処理により、他の酸付加塩に変換されることができる。

【0084】

上記方法及び反応条件に依存して、塩形成特性をもつ式(I)の化合物は、遊離形態又は

50

塩形態において得られうる。

【0085】

式（I）の化合物は、溶媒和物、特にそれらの水和物の形態でも得られる。

【0086】

本発明は、出発化合物又はその方法のいずれかの段階における中間体として得られうる化合物を出発材料として使用し、そして残りのステップの全部又は一部を行い、又は出発材料を誘導体又は塩の形態で使用し、又は特にその反応条件下で形成させるような全ての方法に関する。

【0087】

本発明の方法においては、特に有用なものとして最初に述べた式（I）の化合物をもたらし出す出発材料及び中間体を使用することが好ましい。

10

【0088】

本発明は、特に製造実施例中に記載する方法に関する。

【0089】

式（I）の化合物及びそれらの塩の製造のために本発明に従って使用される遊離形態又は塩形態における新規出発材料及び中間体、それらの使用、並びにそれらの製造方法も同様に本発明の目的を形成する。

【0090】

本発明に係る式（I）の化合物は、害虫防除における使用のための予防的及び／又は治療的利点をもつ活性物であり、そしてひじょうに低い濃度において温血動物、魚、及び植物において好ましい耐性をもつひじょうに好ましい殺生物活性スペクトルを提供する。本発明に係る活性成分は、正常な感受性の動物害虫の全ての又は個々の発達段階に対して有効であり、そして耐性を示す動物害虫、例えば、ダニ（*Acarina*）目の昆虫、及びそのメンバーの全ての又は個々の発達段階に対しても有効である。本発明に係る活性成分の殺虫、殺卵、及び／又は殺ダニ作用は、それ自体直接的に、すなわち、直ちに又はある時機の後に、例えば、脱皮（*moulting*）の間に生じるそれら害虫の、又はそれらの卵の死亡率において、又は間接的に、例えば、低下した産卵、及び／又は孵化率において顕示され、良好な活性は、少なくとも50～60%死亡率に対応する。

20

【0091】

上記動物害虫は、例えば、ヨーロッパ特許出願EP-A-736252中に言及されたものを含む。従って上記明細書中に列記する害虫は、本発明の主題に引用により含まれ；ダニ目の代表例は、特に、

30

アカラス・シロ（*Acarus siro*）、アセリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、アキュラス・シュレヒテンダリ（*Aculus schlechtendali*）、アンブリオンマ種（*Amblyomma* spp.）、アグラス種（*Agas* spp.）、ブーフラス種（*Boophilus* spp.）、ブレビパルパス種（*Brevipalpus* spp.）、ブリオビア・プラエティオサ（*Bryobia praetiosa*）、カリピトリメラス種（*Calipitrimerus* spp.）、コリオプテス種（*Chorioptes*）種、デルマニサス・ガリナエ（*Dermanyssus gallinae*）、エオテトラニカス・カルピニ（*Eotetranychus carpini*）、エリオフィエス種（*Eriophyes* spp.）、ヒアロンマ種（*Hyalomma* spp.）、イクソデス種（*Ixodes* spp.）、オリゴニカス・プラテンシス（*Olygonychus pratensis*）、オルニソドロス種（*Ornithodoros* spp.）、パノニカス種（*Panonychus* spp.）、フィロコプトルタ・オレイボラ（*Phyllocopturta oleivora*）、ポリファゴタルソネムス・ラタス（*Polyphagotarsonemus latus*）、プソロプテス種（*Psoroptes* spp.）、リピセファラス種（*Rhipicephalus* spp.）、リゾグリファス種（*Rhizoglyphus* spp.）、サルコプテス種（*Sarcoptes* spp.）、タルソネムス種（*Tarsonemus* spp.）、及びテトラニクス種（*Tetr*

40

50

anonychus spp.) である。

【0092】

本発明に係る化合物は、農業、園芸、及び林業における、特に植物上で、より特に有用植物、及び観葉植物上で、又は上記植物の部分、例えば、果実、花、葉、茎、根茎又は根上で生じる上述のタイプの害虫を、その後に生育する植物の部分をも上記害虫に対して未だ保護しながら、防除、すなわち、抑制又は破壊するために使用されることができる。

【0093】

標的作物は、天然作物、及び育種又は遺伝子工学的的方法により修飾されている作物の両者を含み、特に、穀物、例えば小麦、大麦、ライ、オーツ、米、メイズ、及びモロコシ；ビート、例えばサトウダイコン及び飼料ビート；果実、例えばナシ状果、石果及び小果樹、例えばリンゴ、ナシ、プラム、桃、アーモンド、さくらんぼ、及びベリー、例えばいちご、ラズベリー及びブラック・ベリー；マメ科植物、例えばインゲン豆、レンズ豆、エンドウ豆、及び大豆；植物油、例えばアブラナ、からし、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、ヒマシ油植物、ココア豆、アメリカホドイモ；ウリ科植物、例えばカボチャ、キュウリ、及びメロン；繊維植物、例えば綿、フラックス、アサ、及びジュート；柑キツ類果実、例えばオレンジ、レモン、グレープフルーツ、及びマンダリン；野菜、例えばホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、玉ねぎ、トマト、ポテト、及びパプリカ；クスノキ科、例えばアボカド、シナモン、及びショウノウ；及びタバコ、ナッツ、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、つる植物、ホップ、バナナ植物、天然ゴム植物、並びに観賞植物を含む。

【0094】

本発明に係る化合物は、綿、果実、柑キツ類、コーン、大豆、ナタネ、及び野菜作物における、ダニ目の昆虫及びそのメンバー、特に植物毒性摂食昆虫、例えば、アンソノマス・グランディス (*Anthonomus grandis*)、ディアブロティカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ヘリオシス・ビレッセンス (*Heliothis virescens*) の幼虫、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) 及びスポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*) の幼虫、及びハダニ (*spider mites*)、例えば、テトラニクス種 (*Tetranychus* spp.) を防除するために特に好適である。

【0095】

本発明に係る化合物の使用のさらなる領域は、保存商品及び保存物の及び材料の保護であり、そしてまた、衛生区画、特に家畜動物、例えば、ウシ、ブタ、ヒツジ及びヤギ、家キン、例えば、雌鳥、七面鳥、及びガチョウ、それらの毛皮のために飼育される動物、例えばミンク、キツネ、チンチラ、ウサギその他、そしてまた、家畜動物及びペット、例えば、ネコ及びイヌ、そしてさらにヒトを含む温血動物を、上述のタイプの害虫に対して保護することにある。

【0096】

例えば、家畜動物及びペットにおけるノミの感染は、その動物の所有者にとっては問題であるが、それに対しては未だ満足いく解決策はない。ノミの複雑なライフサイクルに困って、ノミを防除する知られた方法のいずれも十分に満足いくものではない。なぜなら、特に、それらの知られた方法のほとんどが、その毛皮内の完全に成長したノミを防除することを主に目的としており、そして動物の毛皮内だけではなく、床、カーペット、動物の寝場所、イスの上、庭及びそのはびこった動物がそれに接触するところの他の場所の全ての内でも生きている、ノミのさまざまな若い段階を考慮していないからである。ノミの処理は、一般に費用がかかり、そして長い期間にわたり続けられなければならない。成功は、一般に、その処理が罹患動物、例えばイヌ又はネコだけではなくそれら罹患動物が頻繁に訪れる場所にも同時に適用されるときだけである。

【0097】

本発明に係る式 (I) の化合物は、単独で又は他の殺生物剤とともに使用されることができる。例えば、その効果を高めるために、それらは、同一方向の作用をもつ農薬と併合さ

10

20

30

40

50

れることができ、又はその作用レンジを広げるために、それらは、異なる方向の作用をもつ物質と併合されることができ。内部寄生生物、例えば蠕虫 (wormers) に対する作用レンジを広げることが望ましい場合、式 (I) の化合物は、有利には、内部寄生生物特性をもつ物質と併合される。それらは、もちろん、抗バクテリア剤と併合して使用されることもできる。式 (I) の化合物は“殺成虫剤 (adulticides)”であるので、すなわち、それらは、特に、標的寄生生物の完全に生長した段階に対して有効であるので、上記寄生生物の若い段階に対してより有効である農薬の添加はひじょうに有利であることができる。なぜなら、この方法で、上記寄生生物集団のスペクトル全体が到達され、そしてさらに耐性の進展を回避に対する実質的な貢献があるからである。

【0098】

本発明に係る式 (I) の化合物の良好な寄生生物活性は、上述の害虫の少なくとも 50 ~ 60 % の死亡率に対応する。

【0099】

動物害虫に対する、本発明に係る化合物及びそれらを含む組成物の作用は、他の殺虫剤及び／又は殺ダニ剤の添加によりかなり広げられ、そして与えられた状況に適したものとなることができる。好適な添加物は、例えば、以下のクラスの活性成分を代表するものを含む：有機リン酸化合物、ニトロフェノール及び誘導体、ホルムアミジン、チオウレア、ベンゾイルウレア、カーバメート、ピレスロイド、ネオニコチノイド、塩素化炭化水素、及びバシルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製品。

【0100】

特に好適な混合パートナーは：アザメチフォス (Azamethiphos)；クロルフェンビンフォス (Chlorfenvinphos)；シベルメスリン (Cypermethrin)，シベルメスリン高シス (Cypermethrin high-cis)；シロマジン (Cyromazin)；ジアフェンシウロン (Diafenthiuron)；ダイアジノン (Diazinon)；ジクロルボス (Dichlorvos)；ジクロトフォス (Dicrotophos)；ジシクラニル (Dicyclanil)；フェノキシカーブ (Fenoxycarb)；フルアズロン (Fluazuron)；フラチオカーブ (Furathiocarb)；イサゾフォス (Isazofos)；ジョドフェンフォス (Jodfenphos)；キノプレネ (Kinoprene)；ルフエヌロン (Lufenuron)；メタクリフォス (Methacriphos)；メチダチオン (Methidathion)；モノクロトフォス (Monocrotophos)；フォスファミドン (Phosphamidon)；プロフェノフォス (Profenofos)；ジオフェノラン (Diofenolan)；バチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 株 GC91 又は NCTC11821 から得られうる化合物；ピメトロジン (Pymetrozine)；ブロモプロピレート (Bromopropylate)；メトプレネ (Methoprene)；ジスルフトン (Disulfuton)；キノルフォス (Quinalphos)；タウフルバリネート (Tau-Fluvalinate)；チオシクラム (Thiocyclam)；チオメトン (Thiometon)；アルジカーブ (Aldicarb)；アジンフォスーメチル (Azinphos-methyl)；ベンフラカーブ (Benfuracarb)；ビフェンスリン (Bifenthrin)；ブプロフェジン (Buprofezin)；カルボフラン (Carbofuran)；カルタップ (Cartap)；クロルフルアズロン (Chlorfluazuron)；クロルピリフォス (Chlorpyrifos)；シフルスリン (Cyfluthrin)；ラムダーシハロスリン (Lambda-Cyhalothrin)；アルファーシベルメスリン (Alpha-cypermethrin)；ゼーターシベルメスリン (zeta-cypermethrin)；デルタメスリン (Deltamethrin)；ジフルベンズロン (Diflubenzuron)；エンドスルフアン (Endosulfan)；エチオフェンカーブ (Ethiofencarb)；フェニトロシオン (Fenitrothion)；フェノブカーブ (

10

20

30

40

50

Fenobucarb) ; フェンバレレート (Fenvalerate) ; フォルモチオン (Formothion) ; メチオカーブ (Methiocarb) ; ヘプテノフォス (Heptenophos) ; イミダクロプリッド (Imidacloprid) ; イソプロカーブ (Isoprocarb) ; メタミドフォス (Methamidophos) ; メトミル (Methomyl) ; メビンフォス (Mevinphos) ; パラチオン (Parathion) ; パラチオン-メチル (Parathion-methyl) ; フォサロン (Phosalone) ; ピリミカーブ (Pirimicarb) ; プロボクサー (Propoxur) ; テフルベンズロン (Teflubenzuron) ; テルブフォス (Terbufos) ; トリアザメート (Triazamate) ; アバメクチン (Abamectin) ; フェノムカーブ (Fenobucarb) ; テブフェノジド (Tebufenozide) ; フィプロニル (Fipronil) ; ベータ-シフルスリン (beta-Cyfluthrin) ; シラフルオフエン (Silafluofen) ; フェンピアキシメート (Fenpyroximate) ; ピリダベン (Pyridaben) ; フェナザキン (Fenazaquin) ; ピリプロキシフェン (Pyriproxifen) ; ピリミジフェン (Pyrimidifen) ; ニテンピラム (Nitenpyram) ; NI-25, アセタミプリッド (Acetamiprid) ; アベルメクチン (Avermectin) B₁ アバメクチン (Abamectin) ; 植物の殺虫活性抽出物 ; 殺線虫活性成分含有調製物 ; バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) から得られうる化合物 ; 殺虫活性真菌含有調製物 ; 殺虫活性ウイルス含有調製物 ; AC 303 630 ; アセフェート (Acephate) ; アクリナスリン (Acrinathrin) ; アラニカーブ (Alanycarb) ; アルファメスリン (Alphamethrin) ; アミトラズ (Amitraz) ; AZ 60541 ; アジフォス (Azinphos) A ; アジフォス (Azinphos) M ; アゾシクロチン (Azocyclotin) ; ベンジオカーブ (Bendiocarb) ; ベンスルタップ (Bensultap) ; ベタシフルスリン (Betacyfluthrin) ; BPMC ; ブロフェンプロックス (Brofenprox) ; ブロモフォス (Bromophos) A ; ブフェンカーブ (Bufencarb) ; ブトカルボキシシン (Butocarboxin) ; ブチルピリダベン (Butylpyridaben) ; カジュサフォス (Cadusafos) ; カルバリル (Carbaryl) ; カルボフェノチオン (Carbophenothion) ; クロエトカーブ (Chloethocarb) ; クロルエトキシフォス (Chlorethoxyfos) ; クロルメフォス (Chlormephos) ; シス-レス-メスリン (Cis-Res-methrin) ; クロシスリン (Clopythrin) ; クロフェンテジン (Clofentezin) ; シアノフォス (Cyanophos) ; シクロプロスリン (Cycloprothrin) ; シヘクサチン (Cyhexatin) ; デメトン (Demeton) M ; デメトン (Demeton) S ; デメトン (Demeton) -S-メチル (methyl) ; ジクロフェンチオン (Dichlofenthion) ; ジクリフォス (Dicliphos) ; ジエチオン (Diethion) ; ジメソート (Dimethoat) ; ジメチルビンフォス (Dimethylvinphos) ; ジオキサチオン (Dioxathion) ; エジフェンフォス (Edifenphos) ; エマメクチン (Emamectin) ; エスフェンバレラット (Esfenvalerat) ; エチオン (Ethion) ; エトフェンプロックス (Ethofenprox) ; エトプロフォス (Ethoprophos) ; エトリンフォス (Etrimpfos) ; フェナミフォス (Fenamiphos) ; フェンブタチノキシド (Fenbutatinoxid) ; フェノチオカーブ (Fenothiocarb) ; フェンプロパスリン (Fenpropathrin) ; フェンピラッド (Fenpyrad) ; フェンチオン (Fenthion) ; フルアジナム (Fluazinam) ; フルシクロクスロン (Flucycloxuron) ; フルシトリナット (Flucythrinate) ; フルフェノクスロン (Flufenoxuron) ; フルフェンプロックス (Flufenprox) ; フェノフォス (Fonophos) ; フォスチアザット (Fosthiazate) ; フェブフェンプロックス (Fubfenprox) ; H

10

20

30

40

50

CH;ヘキサフルムロン (Hexaflumuron);ヘキシチアゾックス (Hexythiazox);イプロベンフォス (Iprobenfos);イソフェンフォス (Isofenphos);イソキサチオン (Isoxathion);イベルメクチン (Ivermecthin);ラムダ (Lambda) -シハロスリン (cyhalothrin);マラチオン (Malathion);メカルバム (Mecarbam);メスルフェンフォス (Mesulfenphos);メタルデヒド (Metaldehyd);メトルカーブ (Metolcarb);ミルベメクチン (Milbemectin);モキシデクチン (Moxidectin);ナレド (Naled);NC 184;オメソート (Omethoat);オキサミル (Oxamyl);オキシデメソン (Oxydemethon) M;オキシデプロフォス (Oxydeprofos);ペルメスリン (Permethrin);フェンソート (Phenthoat);フォラット (Phorath);フォスメット (Phosmet);フォキシム (Phoxim);ピリミフォス (Pirimiphos) M;ピリミフォス (Pirimiphos) A;プロメカーブ (Promecarb);プロパフォス (Propaphos);プロチオフォス (Prothiofos);プロソート (Prothoat);ピラクロフォス (Pyrachliphos);ピラダ (Pyrada) -フェンチオン (phenthion);ピレスメトリン (Pyresmethrin);ピレスラム (Pyrethrum);RH 5992;サリチオン (Salithion);セブフォス (Sebufos);スルフォテップ (Sulfotep);スルプロフォス (Sulprofos);テブフェンピラッド (Tebufenpyrad);テブピリムフォス (Tebupirimiphos);テフルスリン (Tefluthrin);テムフォス (Temephos);テルバム (Terbam);テトラコール (Tetrachlor) -ビンフォス (vinphos);チアクロプリッド (Thiacloprid);チアメソキサム (Thiamethoxam);チアフェノックス (Thiafenox);チオジカーブ (Thiodicarb);チオフアノックス (Thiofanox);チオナジン (Thionazin);チューリンゲンシン (Thuringiensin);トラロメスリン (Tralomethrin);トリアセン (Triarthen);トリアゾフォス (Triazophos);トリアズロン (Triazuron);トリクロロフォン (Trichlorofon);トリフルムロン (Triflumuron);トリメタカーブ (Trimethacarb);バミドチオン (Vamidothion);キシリルカーブ (Xyllylcarb);YI 5301/5302;ゼータメトリン (Zetamethrin);DPX-MP062;RH-2485;D 2341又はXMC (3, 5-キシリル・メチルカーバメート (Xy-lyl Methylcarbamate) である。

【0101】

式 (I) の化合物は、非修飾形態で、又は好ましくは、配合技術において慣用されるアジュバントとともに使用され、そしてそれ故、知られたやり方で、例えば、乳化性濃縮液、直接スプレーできる又は希釈することができる溶液、希釈エマルジョン、水和性粉末、可溶性粉末、ダスト、粒剤、そしてまた、ポリマー物質中でのカプセル化に、配合されることができる。

【0102】

式 (I) の化合物 (活性成分)、又はその活性成分と他の農薬活性成分、及び適宜、固体又は液体アジュバントとの併合物を含む、配合品、すなわち、組成物、調製物又は混合物は、知られたやり方で、例えば、その活性成分を伸展剤、例えば溶媒、固体担体、そして場合により表面活性化合物 (界面活性剤) と均一混合し、そして/又はこれとともに粉碎することにより調製され、そしてこれらも本発明を形成する。

【0103】

本発明は、上記組成物の適用方法、すなわち、上述のタイプの害虫を防除し、例えば、意図された目的及び普及環境に従って選択される、スプレー、噴霧、ダスティング、コーティング、ドレッシング、スキヤタリング、又は注ぎ (pouring) 方法にも関し、そして上述のタイプの害虫を防除するための組成物の使用にも関する。典型的な濃度割合 (

rates of concentration) は、0.1～1000ppm、好ましくは0.1～500ppmの活性成分である。1ヘクタール当りの適用割合 (rates of application) は、一般的に、1～2000gの活性成分／1ヘクタール、特に、10～1000g／ha、好ましくは20～600g／haである。

【0104】

植物保護の領域における好ましい適用方法は、植物の葉への適用（葉適用）であり、その適用頻度及び割合は、着目の害虫によるはびこりのリスクに依存する。しかしながら、活性成分は、液体配合品を用いて植物の場を浸漬することにより又は土壌中の活性成分を植物の場、例えば土壌中に、例えば粒剤の形態で取り込むことにより（土壌適用）、その根を通して（浸透作用）その植物に侵入することもできる。水田作物の場合には、このような粒剤は、水を張った水田に計量された量で適用されることができる。

10

【0105】

本発明の作物保護剤は、植物再生材料、例えば、種子、例えば、果実、塊茎又は穀粒、又は植物苗木を動物害虫から保護するためにも好適である。上記再生材料は、栽培開始前に上記組成物により処理されることができる。例えば、種子は、それらが種播きされる前にドレッシングされる。本発明の活性成分は、種子を液体組成物中に浸漬し又はそれらを固体組成物でコーティングすることにより、種子に適用されることができる（コーティング）。上記組成物は、上記再生材料が栽培の場所に導入されるとき、例えば、種子が、種子鋤跡 (seed furrow) 内に播かれるときに、与えられることもできる。植物再生材料のための処理手順及びこのように処理された植物再生材料も、本発明の目的である。

20

【0106】

式(I)の化合物（活性成分）、又はその活性成分と他の農薬活性成分、及び適宜、固体又は液体アジュバントとの併合物を含む、配合品、すなわち、組成物、調製物又は混合物は、知られたやり方で、例えば、その活性成分を伸展剤、例えば溶媒、固体担体、そして場合により表面活性化合物（界面活性剤）と均一混合し、そして／又はこれとともに粉碎することにより調製され、そしてこれらも本発明を形成する。

【0107】

配合補助物質として、例えば、固体担体、溶媒、安定剤、“徐放性”補助物質、塗料、及び場合により表面活性物質（界面活性剤）が使用される。好適な担体及び補助物質は、植物保護組成物中で慣用される物質の全てを含む。本発明に従って使用される組成物中の、好適な補助物質、例えば、溶媒、固体担体、表面活性化合物、非イオン界面活性剤、カチオン界面活性剤、アニオン界面活性剤、及び他の補助物質は、例えば、EP-A-736252中に記載されたものを含み、そしてそれらは、本発明の目的に含まれる。

30

【0108】

好適な石けんは、高級脂肪酸 ($C_{10}-C_{22}$) のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩又は場合により置換されたアンモニウム塩、例えば、オレイン酸又はステアリン酸の、又は例えばココナツ油又は牛脂油から得られうる天然脂肪酸混合物のナトリウム又はカリウム塩である。界面活性剤として脂肪酸メチルタウリン塩も言及される。

【0109】

しかしながら、より頻繁に、いわゆる合成界面活性剤、特に脂肪スルホネート、脂肪スルフェート、スルホネート・ベンズイミダゾール誘導体、及びアルキルアリアルスルホネートが使用される。

40

【0110】

上記脂肪スルホネート又はスルフェートは、通常、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩又は非置換又は置換アンモニウム塩の形態にあり、そして8～22炭素原子をもつアルキル基をもち、それは、アシル基のアルキル成分、例えば、ドデシルスルフェートの、又は天然脂肪酸から得られる脂肪アルコール・スルフェートの混合物の、リグノンスルホン酸のナトリウム又はカルシウム塩をも含む。上記化合物は、硫酸エステル塩、及び脂肪アルコール／酸化エチレン付加物の硫酸塩をも含む。上記スルホン化ベンズイミダゾール

50

誘導体は、好ましくは、2つのスルホン酸基と1つの脂肪酸基であって8～22炭素原子を含むものを含む。アルキルアリールスルホネートの例は、ドデシルベンゼンスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、又はナフタレンスルホン酸／ホルムアルデヒド濃縮生成物のナトリウム、カルシウム又はトリエタノールアミン塩である。対応のホスフェート、例えば、4～14モルの酸化エチレン又はリン脂質をもつノニルフェノールの付加物のリン酸エステルの塩も好適である。

【0111】

式(I)の化合物は、とりわけ、それらの優れた抗ノミ(fleas)のために目立っており、成体ノミが速く殺されるだけでなく、間接的な経路(roundabout route)により、ノミの幼若段階をも殺す。ノミの卵から孵化したノミの幼虫は成体ノミの排泄物を基本的に摂食する。本発明に係る式(I)の化合物は成体ノミをひじょうに速く殺すので、必要な排泄物はなくなり、そして幼若段階は栄養媒体を奪われ、それらは成体段階に達する前に死滅する。

10

【0112】

それ故、本発明は、好ましくは、ヒト、家畜動物、生産家畜、及びペット上の寄生生物を防除する方法であって、少なくとも1の式(I)の化合物又はその生理学的に許容される塩を含む組成物の有効量が、温血動物に、全身的に、又は好ましくは、表在局所的に投与される、前記方法に関する。

【0113】

例えば、配合された形態にある上記活性成分を処理されるべき動物に外部又は内部から投与することによる、さまざまな投与形態をもつ本発明に係る式(I)の化合物により、長期間の作用が達成される。この場合における、“配合された”とは、例えば、粉末、錠剤又は粒剤の形態、リポソーム又はカプセル、エマルジョン、フォーム又はスプレートの形態、マイクロカプセル化された形態又は注ぎ(pour-on)又はスポット(spot-on)形態にあることを意味する。経口的に投与されることができると組合物の全てが、慣用の配合物質に加えて、その宿主動物が上記組成物を経口的・自発的に摂取することを促すさらなる添加物、例えば好適な匂い物質、及び香料を含むと理解される。

20

【0114】

経皮投与、例えば、皮下又は筋中注射によるもの又はインプラントの形態における貯蔵調製物としてのもの、及び表在局所的適用、例えば、注ぎ又はスポット形態は、それらが実施し易いために、本発明の好ましい主題を表す。さらなる投与モードは、経口投与であって、例えば錠剤の形態にあるものである。経皮及び表在局所的投与形態も特に重要であり、そして優れた結果を与える。

30

【0115】

表皮投与形態は、例えば、皮下、筋中、そしてさらに注射することができる形態の静脈内投与を含む。針をもつ慣用のシリンジに加えて、針のない高圧システムを使用することもできる。

【0116】

注ぎ及びスポット配合品は、表在局所的投与形態として特に好ましいが、スプレー、軟膏、溶液又は粉末の形態における投与も好都合である。

40

【0117】

好適な配合品の選択により、上記活性成分がその宿主動物の生きた組織に浸透し、そして／又はそれらの利用能を維持する能力を高めることができる。このことは、例えば、より溶けにくい活性成分であってその低い溶解度が溶解度を高めるための手段を必要とするようなものが使用されるとき、重要である。なぜなら、このような場合、動物の体液は、一度のほんの少量の活性成分を溶解することができるからである。

【0118】

さらに、活性成分の高遅延性放出を得るためには、本発明に係る式(I)の化合物は、マトリックス配合品中に存在することもできる。このマトリックスは、上記活性成分が放出され、そして未成熟で排泄されることを物理的に防止し、そしてその活性成分の生物学的

50

利用能を維持する。このようなマトリックス配合品は、例えば、筋中又は皮下で体内に注射され、そしてそこから上記活性成分が連続的に放出されるところの貯蔵庫の形態としてそこに残る。このようなマトリックス配合品は当業者に知られている。それらは、一般的にワックス様の、半固体物質、例えば、植物ワックス及びポリエチレングリコールであって高分子量をもつもの、又は固体ポリマー配合品、例えば、いわゆる微小球 (microspheres) である。

【0119】

上記インプラントからの上記活性成分の放出速度、及びそれ故、上記インプラントが作用を示すところの時間期間は、上記インプラントがそれを用いて換算されているところの精度 (上記インプラント中の活性成分の量)、上記インプラントの周囲の環境、及び上記インプラントがそれから作られているところのポリマー配合形態により、一般に決定される。

10

【0120】

動物飼料への獣医添加物の投与は、動物の健康の分野において周知である。上記活性成分が液体中に分散され、又は固体担体中に細かく分割された形態にあるところのいわゆるプレミックスをまず調製することが普通である。このプレミックスは、通常、食品中の望ましい最終濃度に依存して、プレミックス 1 kg 当り約 1 ~ 800 mg の化合物を含むことができる。

【0121】

本発明に係る式 (I) の化合物は、食品の構成成分により加水分解されることができるので、それらは、プレミックスに添加される前に、保護マトリックス、例えば、ゼラチン中に配合されるべきである。

20

【0122】

従って、本発明は、加水分解に対して保護されている式 (I) の化合物を、その食品とともにその宿主動物に投与することによる寄生生物の防除の局面にも関する。

【0123】

本発明に係る式 (I) の化合物は、有利には、その宿主動物に基づき、0.01 ~ 800 mg/kg、好ましくは 0.1 ~ 200 mg/kg、特に 0.5 ~ 30 mg/kg、体重の投与量で、投与される。

【0124】

宿主動物に定常的に投与されることができると良好な投与量は、0.5 ~ 100 mg/kg、特に 0.1 ~ 40 mg/kg、体重である。上記投与は、投与モード及び体重に依存して好適な間隔で行われる。

30

【0125】

合計投与量は、同一の活性成分に関して、動物の種間で、そしてまた動物の 1 の種内で変動しうる。なぜなら、それは、とりわけ、その宿主動物の体重、年齢、及び健康状態に依存するからである。

【0126】

本発明に従って使用されるとき、本発明に係る式 (I) の化合物は、通常、純粋な形態ではなく、その活性成分に加えて、宿主動物にとって有益である投与を助ける構成成分を含む組成物の形態で投与されるであろう。もちろん、本発明に従って成体寄生生物を防除することとともに、ノミの幼若段階を防除するための慣用の方法を使用することもできるが、これは不可欠なものではない。

40

【0127】

本発明に従って投与される上記組成物は、一般に、0.1 ~ 99 重量%の、特に 0.1 ~ 95 重量%の、本発明に係る式 (I) の化合物、及び 99.9 ~ 1 重量%の、特に 99.9 ~ 5 重量%の、固体又は液体の、生理学的に許容される担体を含み、0 ~ 25 重量%の、特に 0.1 ~ 25 重量%の、非毒性分散剤を含む。

【0128】

商業品な製品は好ましくは濃縮剤として配合されるであろうが、エンド・ユーザーは、通

50

常、希釈配合物を使用するであろう。

【0129】

このような配合品は、特別な効果を得るために、さらなる補助物質、例えば、安定剤、消泡材、粘度調節剤、バインダー、及び粘着剤、並びに他の活性成分を含むこともできる。

【0130】

経口、経皮、及び表在局所的投与のための獣医実務から知られている生理学的に許容される担体は、配合補助物質として使用されることができる。いくつかの例を以下に与える。

【0131】

好適な担体は、特に、増量剤、例えば、糖、例えば、ラクトース、サッカロース、マンニトール又はソルビトール、セルロース調製品及び／又はリン酸カルシウム、例えば、リン酸3カルシウム又はリン酸水素カルシウム、広義にはバインダー、例えば、デンプン・ペーストであって、例えば、コーン、小麦、米、又はポテト・スターチを使用するもの、ゼラチン、トラガカント、メチルセルロース、及び／又は、所望により、崩壊剤、例えば、上述のデンプン、広義には、またカルボキシメチル・デンプン、架橋ポリビニルピロリドン、寒天、アルギン酸又はその塩、例えばアルギン酸ナトリウムである。賦形剤は、特に流動性改善剤及び潤滑剤、例えば、ケイ酸、タルク、ステアリン酸又はその塩、例えば、ステアリン酸マグネシウム又はカルシウム、及び／又はポリエチレン・グリコールである。錠剤コアは、好適な、場合により腸溶性の、コーティングが提供されることができ、とりわけ、アラビア・ガム、タルク、ポリビニルピロリドン、ポリエチレングリコール、及び／又は2酸化チタンを含むことができる濃縮された糖溶液、又は好適な有機溶媒又は溶媒混合物中のコーティング溶液が、又は腸溶コーティングの調製品のためには、好適なセルロース調製品、例えば、アセチルセルロース・フタレート又はヒドロキシプロピルメチルセルロース・フタレートの溶液が使用される。染料、香料又は顔料が、例えば識別目的のために又は活性成分の異なる量を示すために、錠剤又は糖衣コーティングに添加されることができる。

【0132】

他の経口投与することができる調製品は、ゼラチンのハード・カプセル、そしてまた、ソフトなシールド・カプセルであって、ゼラチン及び可塑剤、例えば、グリセロール又はソルビトールから作られたものである。上記ハード・カプセルは、粒状物の形態で、例えば、増量剤、例えば、ラクトース、バインダー、例えば、スターチ、及び／又は滑剤、例えば、タルク又はステアリン酸マグネシウム、及び、所望により、安定剤も混合されて、上記活性成分を含むことができる。ソフト・カプセル内では、上記活性成分は、好ましくは、好適な液体、例えば、脂肪油、パラフィン油又は液体ポリエチレン・グリコールであって、それに同じく安定剤が添加されることができ、ものの中に溶解又は懸濁される。とりわけ、容易に、かんで飲む又はかまないで飲み込むことができるカプセルが好ましい。

【0133】

上記注ぎ（pour-on）又はスポット（spot-on）方法は、皮膚又は毛皮の局所的に限定された領域に、有利には、動物の首のうしろ又は背骨上に、式（I）の化合物を適用することを含む。これは、例えば、毛皮の比較的小さな領域に上記注ぎ又はスポット配合品を塗布又はスプレーすることにより行われ、そこから、上記活性成分は、動物の動きにより助けられる上記配合品のスプレッディング性によりほとんど自動的に上記毛皮の広い領域にわたり分布されるようになる。

【0134】

注ぎ及びスポット配合品は、好適には、皮膚の表面上で、及び宿主動物の毛皮内での速い分配を助け、そして一般にスプレッディング油といわれる担体を含む。例えば、油状溶液；アルコール性及びイソプロパノール溶液、例えば、2-オクチル・ドデカノール又はオレイル・アルコールの溶液；モノカルボン酸のエステル、例えば、イソプロピル・ミリステート、イソプロピル・パルミテート、ラウリン酸ショウ酸エステル、オレイン酸オレイル・エステル、オレイン酸デシル・エステル、ヘキシル・ラウレート、オレイル・オレエート、デシル・オレエート、鎖長 C_{12} - C_{18} の飽和脂肪アルコールのカプロン酸エステル

中の溶液；ジカルボン酸のエステル、例えば、ジブチル・フタレート、ジイソプロピル・イソフタレート、アジピン酸ジイソプロピル・エステル、ジ-n-ブチル・アジペートの溶液又は脂肪酸、例えばグリコールのエステルの溶液が好適である。医薬又は化粧品産業から知られた分散剤も存在することが有利でありうる。例は、ピロリジン-2-オン、N-アルキルピロリジン-2-オン、アセトン、ポリエチレン・グリコール並びにそのエーテル及びエステル、プロピレン・グリコール又は合成トリグリセリドである。

【0135】

上記油状溶液は、例えば、植物油、例えば、オリーブ油、アメリカホドイモ油、ゴマ油、松油、亜麻仁油、及びヒマシ油を含む。上記植物油は、エポキシ化形態で存在することもできる。パラフィン及びシリコン油を使用することもできる。

10

【0136】

一般に、注ぎ又はスポット配合品は、1～20重量%の式(1)の化合物、0.1～50重量%の分散剤、及び45～98.9重量%の溶媒を含むであろう。

【0137】

上記注ぎ又はスポット方法は、群れをなす動物、例えば、ウシ、ウマ、ヒツジ、及びブタであって、その動物の全てを経口的に又は注射を通じて処理することが難しく又は時間がかかるものために特に有利に、使用されることができ。その単純さのために、上記方法は、もちろん、個々の家畜動物及びペットを含む他の全ての動物のために使用されることができ、そしてそれら動物の占有者にひじょうに人気がある。なぜなら、それはしばしば、獣外科医の専門的支援を伴わずに行われることができるからである。

20

【0138】

非経口及び経皮投与のために好適なものは、油状の注射溶液又は懸濁液であり、好適な親油性溶媒又は媒質、例えば、脂肪油、例えばゴマ油、合成脂肪酸エステル、例えば、オレイン酸エチル、又はトリグリセリド、または水性注射溶液又は懸濁液であって、粘度上昇物質、例えば、ナトリウム・カルボキシメチルセルロース、ソルビトール及び／又はデキストラン、及び、場合により、安定剤を含むものが使用される。

【0139】

本発明の調製品は、それ自体知られたやり方で、例えば、慣用の混合、顆粒化、コーティング、溶解又は凍結乾燥方法により、調製されうる。例えば、経口投与のための医薬調製品は、錠剤又は錠剤コアを形成するために、上記活性成分を、固体担体と併合し、適宜、得られた混合物を粉砕し、そして上記混合物又は顆粒を、所望により又は必要により、好適な賦形剤の添加後に、処理することにより、得られうる。

30

【0140】

以下の実施例は、本発明を単に説明するために役立ち、本発明を限定するものではない。

【0141】

好ましい配合品は特に以下の組成をもつ（全体を通して、パーセンテージは重量である）：

乳化剤濃縮物：

活性成分	：	1～90%、好ましくは5～20%
表面活性剤	：	1～30%、好ましくは10～20%
液体担体	：	5～94%、好ましくは70～85%

40

粉剤（ダスト）：

活性成分	：	0.1～10%、好ましくは0.1～1%
固体担体	：	99.9～90%、好ましくは99.9～99%

懸濁濃縮液：

活性成分	：	5～75%、好ましくは10～50%
水	：	94～24%、好ましくは88～30%
表面活性剤	：	1～40%、好ましくは2～30%

湿潤（水和）性粉末：

活性成分	：	0.5～90%、好ましくは1～80%
------	---	--------------------

50

表面活性剤： 0.5～20%、好ましくは1～15%

固体担体： 5～95%、好ましくは15～90%

顆粒：

活性成分： 0.5～30%、好ましくは3～15%

固体担体： 99.5～70%、好ましくは97～85%

注射溶液：

活性成分： 0.1～10%、好ましくは0.5～5%

非イオン界面活性剤： 0.1～30%、好ましくは0.5～10%

エタノールとプロピレン

グリコールの混合物： 60～99%、好ましくは85～90%

10

注射懸濁液（水性又は油状）：

活性成分： 0.1～20%、好ましくは1～10%

非イオン界面活性剤： 0.1～20%、好ましくは1～10%

水又は植物油： 60～99%、好ましくは85～95%

上記組成物は、特別な効果を得るために、さらなる成分、例えば、安定剤、例えば、植物油又はエポキシ化植物油（エポキシ化ココナッツ油、ナタネ油又は大豆油）、消泡剤、例えば、シリコーン油、保存料、粘度調節剤、バインダー及び粘着剤、並びに肥料又は他の活性成分を含むこともできる。

【0142】

以下の実施例は、上記の発明を説明するが、いかなる方法においてもその範囲を限定するものではない。温度は摂氏で与える。

20

1. 合成実施例

P1. 2：2，6-ジフルオロフェニル-ベンズアミジニウム・クロリド

17.4gの次亜塩素酸のtert.-ブチルを、その温度を20℃に保つことができるような方法で、200mlの塩化メチレン中の2，6-ジフルオロ・ベンズアルデヒド・オキシム26.1gの溶液に滴下する。1時間後、この反応混合物を、100mlの飽和メタノール性アンモニア溶液にゆっくりと滴下する。さらに1時間後、それを水に注ぎ、真空下で濃縮し、そして得られた沈殿を濾過し、そして乾燥させる。

【0143】

220mlの塩酸含有エタノール中のこうして得られたヒドロキサム酸アミドを、9gのラニー・ニッケル上で3バル及び60℃で水添する。濾過、真空下での濃縮、及びエーテルからの再結晶化の後、融点>250℃をもつ表題の化合物を得る。

30

【0144】

P1. 2：2-（4-ブロモフェニル）-1-ジメチルアミノ-3-ジメチルイモニオプロペン・パークロレート

32mlのオキシ塩化リンを、よく冷却し、そして激しく攪拌しながら、10～15℃で、45mlのジメチルホルムアミドに滴下する。その後、25gの4-ブロモフェニル酸を-10℃で分割して添加し、そしてその反応混合物を室温で1時間、その後、60℃で2時間、そして最後に80℃で5時間、攪拌する。この混合物を次に、注意して、0℃において20mlの水で加水分解し、そしてその生成物を、35mlの70%過塩酸の添加により沈殿させる。アセトン／エーテルからの濾過及び再結晶化の後、表題の化合物を、160℃の融点をもつ無色の結晶の形態で得る。

40

【0145】

P1. 3：5-（4-ブロモフェニル）-2-（2，6-ジフルオロフェニル）-ピリミジン

150mlのメタノール中の10.0gの2，6-ジフルオロフェニル・ベンズアミジニウム・クロリドと19.0gの2-（4-ブロモフェニル）-1-ジメチルアミノ-3-ジメチルイモニオプロペン・パークロレートの懸濁液を、メタノール中の5.4モルのNaOMe溶液と混合し、そして還流下、16時間加熱する。冷却した反応混合物を、その後水に注ぎ、そして結晶、無色沈殿物を濾過する。高真空下で乾燥させた後、193～19

50

4℃の融点をもつ表題の化合物を得る。

【0146】

P1. 4: 2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-5-(4'-トリフルオロメトキシビフェニル-4-イル)-ピリミジン

0.70 gの5-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-ピリミジン、0.53 gの4-トリフルオロメトキシフェニル-ホウ酸、と0.07 gのパラジウム-II-アセテートを、1¹/₂ 時間、窒素下で、20 mlのジメトキシエタンと20 mlの飽和、水性炭酸カリウム溶液の混合物中で、加熱する。次にこの反応混合物を冷却し、水で希釈し、そして結晶沈殿物を濾過する。酢酸エチル中に沈殿物を溶解させ、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、そして濃縮した後、215~216℃の融点をもつ薄黄色の結晶の形態で表題の化合物を得る。

10

【0147】

P1. 5: 4-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-ピリミジン

100 mlのエタノール中の10.0 gの2, 6-ジフルオロフェニル-ベンズアミジニウム・クロリド及び10.4 gの1-(4-ブロモフェニル)-3-ジメチルアミノプロペノンの懸濁液を、6.7 gの固体tert.-ブチル・カリウムと混合し、そして16時間、還流下で加熱する。冷却された反応混合物を水に注ぎ、そして結晶沈殿物を濾過する。エーテル/ヘキサンから再結晶化した後、130~131℃の融点をもつ表題の化合物を得る。

20

【0148】

P1. 6: 2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イル)-ピリミジン

0.70 gの5-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-ピリミジン、0.42 gの4-トリフルオロメトキシフェニル-ホウ酸、及び0.07 gのパラジウム-II-アセテートを、窒素下で、1¹/₂ 時間、20 mlのジメトキシエタンと20 mlの飽和、水性炭酸カリウム溶液の混合物中、還流下を加熱する。次に、この反応混合物を冷却し、水で希釈し、そして結晶沈殿物を濾過する。酢酸エチル中で上記沈殿物を溶解させ、硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過し、そして濃縮した後、141~142℃の融点をもつ薄黄色の結晶の形態で表題の化合物を得る。

30

【0149】

P1. 7: 4-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-ヒドロキシ・リミジン

750 mlのトルエン、24.0 gの2, 6-ジフルオロフェニル-ベンズアミジニウム・クロリドと31.9 gの2-(4-ブロモフェニル)-3-ヒドロキシアクリル酸エチル、エステルの懸濁液を、12.6 gのトリエチルアミンと0.5 gのp-トルエンスルホン酸と混合し、そして7時間還流下で加熱する。冷却された反応混合物を、水で抽出し、そしてその溶媒を蒸発させる。上記沈殿物を酢酸エチル中に溶解させ、硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過し、そして濃縮した後、融点>250℃をもつ表題の化合物を得る(化合物3.356)。

40

【0150】

P1. 8: 4-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3-クロロピリミジン

23.2 gの4-(4-ブロモフェニル)-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3-ヒドロキシピリミジンと100 mlのPOCl₃を混合し、110℃で1時間攪拌する。この反応混合物をゆっくりと、水中250 gのNaOH(固体)の溶液に注ぎ、そして濾過する。上記沈殿物を酢酸エチル中に溶解させ、硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過し、そして濃縮した後、146~148℃の融点をもつ表題の化合物を得る(化合物3.354)。

【0151】

50

P 1. 9 : 4 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - シアノ - 2 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - ピリミジン

6 g の 4 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 - クロロピリミジン、80 ml のジメチルホルムアミド、1.53 g の KCN、及び 0.93 g のナトリウム・トリルスルフィネートを、共に混合し、80 °C で 3 時間攪拌し、氷水と混合し、そして濾過する。上記沈殿物を酢酸エチル中に溶解し、硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過し、そして濃縮した後、融点 146 ~ 148 °C をもつ表題の化合物を得る（化合物 3.355）。

【0152】

P 1. 10 : 6 g の 4 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 - メトキシピリミジン

10

6 g の 4 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 - クロロピリミジン、60 ml のメタノール、及び 3.3 g のメタノール性ナトリウム・メタノレート溶液（30 %）を、24 時間還流下で沸騰させ、蒸発により濃縮し、そして残渣を酢酸エチル中に溶かし、そしてその有機相を水で洗浄する。硫酸マグネシウムによる乾燥、濾過、及び濃縮の後、104 ~ 106 °C の融点をもつ表題の化合物を得る（化合物 3.350）。

【0153】

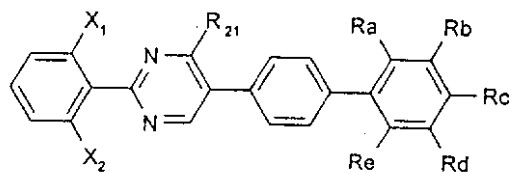
実施例 P 1. 1 ~ P 1. 10 に記載した方法と同様にして、以下の表中に示す物質を製造することもできる。

20

【0154】

【表 1】

表 1 : 以下の式の化合物



No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	m.p. (°C)
1.1	F	F	H	H	Cl	F	H	H	218-220
1.2	F	F	H	H	H	CF ₃	H	H	252-254
1.3	Cl	Cl	H	H	H	CF ₃	H	H	207-208
1.4	Cl	Cl	H	H	H	OCF ₃	H	H	179-181
1.5	Cl	Cl	H	H	Cl	F	H	H	200-202
1.6	Cl	Cl	H	H	Cl	Cl	H	H	224-226
1.7	Cl	Cl	H	H	H	OCH ₃	H	H	242-244
1.8	Cl	Cl	H	H	H	Cl	H	H	205-220
1.9	Cl	Cl	H	H	Cl	H	Cl	H	>220
1.10	Cl	Cl	H	H	H	t-Bu	H	H	200-202
1.11	Cl	F	H	H	Cl	F	H	H	186-189
1.12	Cl	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	160-163
1.13	Cl	F	H	H	Cl	Cl	H	H	196-199
1.14	Cl	F	H	H	CF ₃	H	H	H	187-190
1.15	Cl	F	H	H	H	OCH ₃	H	H	176-179
1.16	Cl	F	H	H	Cl	H	Cl	H	215-218
1.17	Cl	F	H	H	H	CF ₃	H	H	218-221
1.18	F	F	H	H	CF ₃	H	H	H	217-218
1.19	F	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	215-216
1.20	F	F	H	OCH ₃	H	H	H	H	150-151
1.21	F	F	H	H	Cl	H	Cl	H	230-231
1.22	F	F	H	H	H	Ph	H	H	>260
1.23	F	F	H	H	H	F	H	H	212-213
1.24	F	F	H	CF ₃	H	H	H	H	100-102
1.25	F	F	H	H	H	Cl	H	H	220-222
1.26	F	F	CN	H	H	OCF ₃	H	H	180-182
1.27	F	F	CN	H	H	CF ₃	H	H	199-201

【 0 1 5 5 】

【表 2】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	m.p. (°C)
1.28	F	F	CN	H	Cl	H	Cl	H	244-246
1.29	F	F	OCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	158-160
1.30	F	F	OCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	176-178
1.31	F	F	OCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	171-173
1.32	F	F	NHCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	196-197
1.33	F	F	NHCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	214-216
1.34	F	F	NHCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	270-272
1.35	F	F	SCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	173-175
1.36	F	F	Cl	H	H	OCF ₃	H	H	177-179
1.37	F	F	H	H	Cl	H	H	H	178-179
1.38	F	F	CN	H	H	OCF ₃	H	H	180-182
1.39	F	F	OCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	158-160
1.40	F	F	OCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	176-178
1.41	F	F	OCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	171-173
1.42	F	F	CN	H	H	CF ₃	H	H	199-201
1.43	F	F	CN	H	Cl	H	Cl	H	244-246
1.44	F	F	NHCH ₃	H	H	OCF ₃	H	H	196-197
1.45	F	F	NHCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	214-216
1.46	F	F	NHCH ₃	H	Cl	H	Cl	H	270-272
1.47	F	F	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.48	F	F	H	H	H	SOCF ₃	H	H	
1.49	F	F	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.50	F	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.51	F	Cl	H	H	H	SOCF ₃	H	H	
1.52	F	Cl	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.53	Cl	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	H	
1.54	Cl	Cl	H	H	H	SOCF ₃	H	H	
1.55	Cl	Cl	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	H	
1.56	F	F	Cl	H	H	OCF ₃	H	H	177-179
1.57	F	F	-SCH ₃	H	H	CF ₃	H	H	173-175
1.58	F	F	-OC ₂ H ₅	H	H	OCF ₃	H	H	146-147
1.59	F	F	-OC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	170-172
1.60	F	F	-OC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	154-155

10

20

30

40

【 0 1 5 6 】

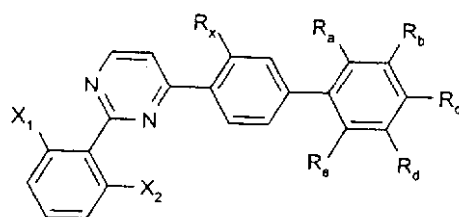
【表 3】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	m.p. (°C)
1.61	F	F	-O-i-Prop	H	H	OCF ₃	H	H	128-129
1.62	F	F	-NH-c-Prop	H	H	OCF ₃	H	H	163-164
1.63	F	F	-O-i-Prop	H	H	CF ₃	H	H	159-160
1.64	F	F	-O-i-Prop	H	Cl	H	Cl	H	143-144
1.65	F	F	-NH-c-Prop	H	H	CF ₃	H	H	187-188
1.66	F	F	-NH-c-Prop	H	Cl	H	Cl	H	172-173
1.67	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	189-190
1.68	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	202-203
1.69	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	H	OCF ₃	H	H	146-147
1.70	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	H	CF ₃	H	H	166-168
1.71	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	Cl	H	Cl	H	200-202
1.72	F	F	-SC ₂ H ₅	H	H	OCF ₃	H	H	127-128
1.73	F	F	-SC ₂ H ₅	H	H	CF ₃	H	H	145-146
1.74	F	F	-SC ₂ H ₅	H	Cl	H	Cl	H	154-156

【 0 1 5 7 】

【表 4】

表 2 : 以下の式の化合物



No.	X ₁	X ₂	R _x	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	m.p. (°C)
2.1	F	F	H	H	Cl	F	H	H	133-134
2.2	F	F	H	H	H	CF ₃	H	H	141-142
2.3	F	F	H	H	H	OCF ₃	H	H	102-103
2.4	F	F	H	H	CF ₃	H	H	H	114-115
2.5	F	F	H	H	Cl	H	Cl	H	116-126
2.6	F	F	H	H	Cl	Cl	H	H	134-140
2.7	F	F	H	H	H	Ph	H	H	258-259
2.8	F	F	H	H	H	F	H	H	145-146

【0158】

【表5】

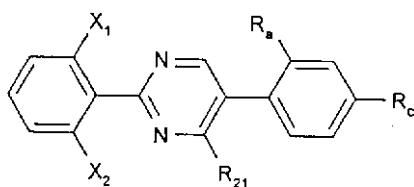
No.	X ₁	X ₂	R _x	R _a	R _b	R _c	R _d	R _e	m.p. (°C)
2.9	F	F	H	Cl	H	Cl	H	H	86-87
2.10	F	F	H	H	Cl	H	H	H	82-83
2.11	F	F	H	H	H	Cl	H	H	167-168
2.12	F	F	H	CF ₃	H	H	H	H	179-180

10

【0159】

【表6】

表 3 : 以下の式の化合物



No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	
3.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.6	F	F	H	CH ₃	4-t-ブチル-Ph	
3.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.16	F	F	H	CH ₃	4-Br	
3.17	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph	
3.18	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
3.19	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.20	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	

【 0 1 6 0 】

【表 7】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.21	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.22	F	F	H	OCH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.23	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.24	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.25	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.26	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	10
3.27	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.28	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.29	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.30	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.31	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph	
3.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	20
3.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.37	F	F	H	CF ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
3.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	30
3.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph	
3.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
3.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
3.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
3.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
3.52	F	F	CH ₃	H	4-t-7'フル-Ph	
3.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	40

【 0 1 6 1 】

【表 8】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
3.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
3.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
3.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
3.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph	10
3.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
3.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
3.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	20
3.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
3.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	30
3.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	40

【 0 1 6 2 】

【表 9】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	10
3.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-t-7'-フル-Ph	
3.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	20
3.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
3.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph	
3.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
3.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
3.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
3.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	30
3.112	F	Cl	H	H	4-t-7'-フル-Ph	
3.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
3.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
3.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
3.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
3.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph	40

【0163】

【表10】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
3.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
3.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	10
3.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.127	F	Cl	H	CH ₃	4-t-7' 7 μ -Ph	
3.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	20
3.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
3.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
3.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-t-7' 7 μ -Ph	
3.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	30
3.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	40

【 0 1 6 4 】

【表 1 1】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.157	F	Cl	H	CF ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	10
3.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
3.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	20
3.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
3.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
3.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
3.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
3.172	F	Cl	CH ₃	H	4-t-7'フル-Ph	
3.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
3.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
3.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	30
3.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
3.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
3.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
3.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
3.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	40

【 0 1 6 5 】

【 表 1 2 】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	10
3.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
3.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
3.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	20
3.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	30
3.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
3.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	40

【 0 1 6 6 】

【表 1 3】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	10
3.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph	
3.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
3.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
3.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
3.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
3.232	Cl	Cl	H	H	4-t-7' 7 ₈ -Ph	
3.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	20
3.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
3.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
3.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
3.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
3.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
3.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
3.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	30
3.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-t-7' 7 ₈ -Ph	
3.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	40

【 0 1 6 7 】

【表 1 4】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	10
3.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
3.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	20
3.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
3.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	30
3.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	40

【 0 1 6 8 】

【表 1 5】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
3.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
3.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
3.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	10
3.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
3.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-t-7'フル-Ph	
3.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
3.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
3.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
3.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
3.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	20
3.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
3.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
3.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
3.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-t-7'フル-Ph	
3.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	30
3.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
3.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	40

【 0 1 6 9 】

【表 1 6】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
3.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-t-7' Fl -Ph	
3.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	10
3.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
3.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
3.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	20
3.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
3.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
3.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
3.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
3.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-t-7' Fl -Ph	
3.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
3.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
3.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
3.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	30
3.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
3.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
3.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
3.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
3.346	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
3.347	F	F	SCH ₃	H	Br	141-142°C
3.348	F	F	OCH ₃	H	Br	103-105°C
3.349	F	F	Cl	H	Br	146-148°C
3.350	F	F	CN	H	Br	148-150°C

10

20

30

40

【 0 1 7 0 】

【表 1 7】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.351	F	F	OH	H	Br	>250°C
3.352	F	F	NH-CH ₃	H	Br	181-183°C
3.353	F	F	H	H	4-F-7I/キシ	
3.354	F	F	H	H	3-CF ₃ -7I/キシ	
3.355	F	F	H	H	4-CF ₃ -7I/キシ	
3.356	F	F	H	H	4-OCF ₃ -7I/キシ	10
3.357	F	F	H	H	4-t-ブチル-7I/キシ	
3.358	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -7I/キシ	
3.359	F	F	H	H	4-SCH ₃ -7I/キシ	
3.360	F	F	H	H	3-Cl-4-F-7I/キシ	
3.361	F	F	H	H	4-SCF ₃ -7I/キシ	
3.362	F	Cl	H	H	4-F-7I/キシ	
3.363	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -7I/キシ	
3.364	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -7I/キシ	
3.365	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -7I/キシ	20
3.366	F	Cl	H	H	4-t-ブチル-7I/キシ	
3.367	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -7I/キシ	
3.368	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -7I/キシ	
3.369	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-7I/キシ	
3.370	F	Cl	H	H	4-SCF ₃ -7I/キシ	
3.371	Cl	Cl	H	H	4-F-7I/キシ	
3.372	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -7I/キシ	
3.373	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -7I/キシ	
3.374	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -7I/キシ	
3.375	Cl	Cl	H	H	4-t-ブチル-7I/キシ	30
3.376	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -7I/キシ	
3.377	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -7I/キシ	
3.378	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-7I/キシ	
3.379	Cl	Cl	H	H	4-SCF ₃ -7I/キシ	
3.380	F	F	H	H	4-F-7Iニル7ミノ	
3.381	F	F	H	H	3-CF ₃ -7Iニル7ミノ	
3.382	F	F	H	H	4-CF ₃ -7Iニル7ミノ	
3.383	F	F	H	H	4-OCF ₃ -7Iニル7ミノ	40

【0171】

【表18】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.384	F	F	H	H	4- <i>t</i> -ブチルフェニル	
3.385	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -フェニル	
3.386	F	F	H	H	4-SCH ₃ -フェニル	
3.387	F	F	H	H	3-Cl-4-F-フェニル	
3.388	F	F	H	H	4-SCF ₃ -フェニル	
3.389	F	Cl	H	H	4-F-フェニル	10
3.390	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -フェニル	
3.391	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -フェニル	
3.392	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -フェニル	
3.393	F	Cl	H	H	4- <i>t</i> -ブチルフェニル	
3.394	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -フェニル	
3.395	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -フェニル	
3.396	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-フェニル	
3.397	F	Cl	H	H	4-SCF ₃ -フェニル	
3.398	Cl	Cl	H	H	4-F-フェニル	20
3.399	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -フェニル	
3.400	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -フェニル	
3.401	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -フェニル	
3.402	Cl	Cl	H	H	4- <i>t</i> -ブチルフェニル	
3.403	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -フェニル	
3.404	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -フェニル	
3.405	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-フェニル	
3.406	Cl	Cl	H	H	4-SCF ₃ -フェニル	
3.407	F	F	-OC ₂ H ₅	H	Br	111-113
3.408	F	F	-OCH ₂ CCH	H	Br	140-142
3.409	F	F	-O- <i>i</i> -Prop	H	Br	130-132
3.410	F	F	-NH- <i>c</i> -Prop	H	Br	136-138
3.411	F	F	-NHC ₂ H ₅	H	Br	207-209
3.412	F	F	-N(CH ₃) ₂	H	Br	236-238
3.413	F	F	-SCH ₃	H	Br	141-142
3.414	F	F	-NHCH ₂ CCH	H	Br	168-171
3.415	F	F	-SC ₂ H ₅	H	Br	138-140

10

20

30

40

【0172】

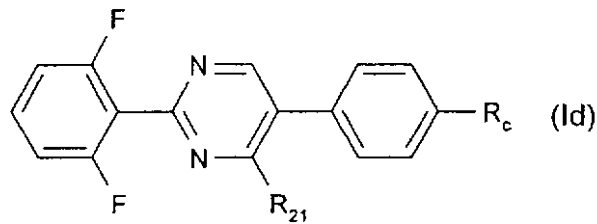
【表19】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
3.416	F	F	-SH	H	Br	222-224

【0 1 7 3】

【表 2 0】

表 3 A : 以下の式の化合物



10

No.	R _c
3A.1	4-F-Ph
3A.2	4-Cl-Ph
3A.3	3-CF ₃ -Ph
3A.4	4-CF ₃ -Ph
3A.5	4-OCF ₃ -Ph
3A.6	4-t-ブチル-Ph
3A.7	2,4-Cl ₂ -Ph
3A.8	3,5-Cl ₂ -Ph
3A.9	2-CF ₃ -Ph
3A.10	4-OCH ₃ -Ph
3A.11	4-SCH ₃ -Ph
3A.12	3-OCH ₃ -Ph
3A.13	3-Cl-Ph
3A.14	3,4-Cl ₂ -Ph
3A.15	3-Cl-4-F-Ph
3A.16	4-Br
3A.17	4-CH ₃ -Ph

20

30

【0174】

40

表 3. 1 : 式中、R₂₁が-OHであり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0175】

表 3. 2 : 式中、R₂₁が-CNであり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0176】

表 3. 3 : 式中、R₂₁が-OCH₃であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0177】

表 3. 4 : 式中、R₂₁が-NHCH₃であり、そして各場合における化合物について、

50

置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0178】

表 3. 5: 式中、 R_{21} が $-SCH_3$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0179】

表 3. 6: 式中、 R_{21} が $-O-i$ -プロピルであり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0180】

表 3. 7: 式中、 R_{21} が $-O-C_2H_5$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

10

【0181】

表 3. 8: 式中、 R_{21} が $-S-C_2H_5$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0182】

表 3. 9: 式中、 R_{21} が $-NH-C$ -プロブであり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0183】

表 3. 10: 式中、 R_{21} が $-NH-CH_2-CCH$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0184】

20

表 3. 11: 式中、 R_{21} が $-N(CH_3)_2$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0185】

表 3. 12: 式中、 R_{21} が $-NH-C_2H_5$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0186】

表 3. 13: 式中、 R_{21} が $-O-CH_2CH_2-OCH_3$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0187】

表 3. 14: 式中、 R_{21} が $-S-CH_2CH_2-OCH_3$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

30

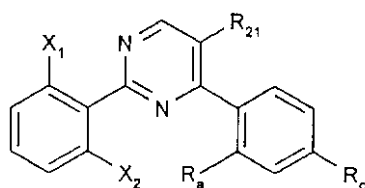
【0188】

表 3. 15: 式中、 R_{21} が $-NH-CH_2CH_2-OCH_3$ であり、そして各場合における化合物について、置換基 R_c が、表 3 A 中の行に対応する、一般式 (I d) の化合物。

【0189】

【表 21】

表 4 : 以下の式の化合物



No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	
4.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.6	F	F	H	CH ₃	4-t-7'-フル-Ph	
4.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.16	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph	
4.17	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.18	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.19	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.20	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.21	F	F	H	OCH ₃	4-t-7'-フル-Ph	
4.22	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.23	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.24	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.25	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.26	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	

【 0 1 9 0 】

【 表 2 2 】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.27	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.28	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
4.29	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.30	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.31	F	F	H	OCH ₃	4-Br	
4.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph	10
4.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.37	F	F	H	CF ₃	4- <i>t</i> -7'-フル-Ph	
4.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	20
4.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
4.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph	
4.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
4.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
4.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	30
4.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
4.52	F	F	CH ₃	H	4- <i>t</i> -7'-フル-Ph	
4.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
4.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
4.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
4.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
4.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph	40

【 0 1 9 1 】

【表 2 3】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
4.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
4.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	10
4.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -ブチル-Ph	
4.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	20
4.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
4.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4- <i>t</i> -ブチル-Ph	
4.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	30
4.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
4.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	40

【 0 1 9 2 】

【表 2 4】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-t-7' Fl -Ph	
4.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	10
4.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
4.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph	20
4.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
4.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
4.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
4.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
4.112	F	Cl	H	H	4-t-7' Fl -Ph	
4.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
4.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	30
4.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
4.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
4.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
4.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
4.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
4.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	40

【 0 1 9 3 】

【表 2 5】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.127	F	Cl	H	CH ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	10
4.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
4.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	20
4.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	30
4.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
4.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.157	F	Cl	H	CF ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	40

【 0 1 9 4 】

【表 2 6】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	10
4.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
4.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
4.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
4.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
4.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
4.172	F	Cl	CH ₃	H	4-t-7'フル-Ph	
4.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	20
4.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
4.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
4.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
4.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
4.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
4.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
4.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
4.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	30
4.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-t-7'フル-Ph	
4.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	40

【 0 1 9 5 】

【表 2 7】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	10
4.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-t-7' 7 ₈ -Ph	
4.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	20
4.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
4.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
4.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	30
4.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-t-7' 7 ₈ -Ph	
4.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	40

【 0 1 9 6 】

【表 2 8】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph	
4.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
4.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
4.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	10
4.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
4.232	Cl	Cl	H	H	4-t-ブチル-Ph	
4.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
4.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
4.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
4.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
4.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph	20
4.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
4.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
4.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	30
4.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	40

【 0 1 9 7 】

【表 2 9】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-t-7' 7 μ -Ph	
4.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	10
4.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
4.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	20
4.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-t-7' 7 μ -Ph	
4.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2Ph	
4.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	30
4.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
4.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
4.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
4.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
4.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	40

【 0 1 9 8 】

【表 3 0】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
4.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-t-ブチル-Ph	
4.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
4.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	10
4.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
4.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
4.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
4.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
4.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
4.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
4.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	20
4.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
4.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	30
4.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
4.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
4.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-t-ブチル-Ph	
4.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	40

【 0 1 9 9 】

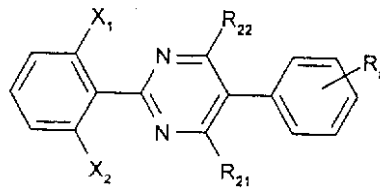
【表 3 1】

No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R _a	R _c	物理データ
4.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	10
4.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
4.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
4.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
4.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
4.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
4.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
4.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
4.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-t-7' π μ $\cdot$ Ph	20
4.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
4.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
4.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
4.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
4.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
4.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
4.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
4.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
4.346	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	30

【 0 2 0 0 】

【表 3 2】

表5：以下の式の化合物



No.	X ₁	X ₂	R ₂₁	R ₂₂	R _a	物理データ
5.1	F	F	OH	OH	4-Br	> 300

【0201】

【表33】

5.2	F	F	OH	H	3-Br	220-222
5.3	F	F	Cl	Cl	4-Br	221-222
5.4	F	F	Cl	H	3-Br	88-90
5.5	F	F	OCH ₃	H	3-Br	89-91
5.6	F	F	CN	H	3-Br	185-187
5.7	F	F	Cl	OCH ₃	4-Br	169-171
5.8	F	F	OCH ₃	H	3-(4-OCF ₃ -Ph)	120-122
5.9	F	F	OCH ₃	H	3-(4-CF ₃ -Ph)	154-156
5.10	F	F	OCH ₃	H	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	143-145
5.11	F	F	CN	H	3-(4-OCF ₃ -Ph)	91-93
5.12	F	F	CN	H	3-(4-CF ₃ -Ph)	114-117
5.13	F	F	CN	H	3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	161-163

【0202】

2. 配合実施例

2. 1 乳化性濃縮物

	a)	b)	c)
活性成分	25%	40%	50%
カルシウム・ドデシルベンゼンスルホネート	5%	8%	6%
ヒマ・ポリエチレン・グリコール・エーテル (36molのエチレン・オキシド)	5%	—	—
トリブチルフェノール・ポリエチレン・ グリコール・エーテル			

(30 mol のエチレン・オキシド) — 12% 4%
シクロヘキサノン — 15% 20%
キシレン混合物 65% 25% 20%
いずれかの所望の濃度のエマルジョンを、水での希釈により上記濃縮物から調製することができる。

2. 2乳化性濃縮物 a) b) c)

活性成分 10% 8% 60%

オクチルフェノール・ポリエチレン・グリコール・エーテル

(4~5 mol のエチレン・オキシド) 3% 3% 2% 10

カルシウム・ドデシルベンゼン・

スルホネート 3% 4% 4%

ヒマ・ポリエチレン・グリコール・エーテル

(35 mol のエチレンオキシド) 4% 5% 4%

シクロヘキサノン 30% 40% 15%

キシレン混合物 50% 40% 15%

いずれかの所望の濃度のエマルジョンを、水での希釈により上記濃縮物から調製することができる。

2. 3懸濁濃縮物 20

活性化合物 40%

エチレン・グリコール 10%

ノニルフェノール・ポリエチレン・グリコール・エーテル

(15 mol のエチレン・オキシド) 6%

ナトリウム・リグニンスルホネート 10%

カルボキシメチルセルロース 1%

37%水性ホルムアルデヒド溶液 0.2%

75%水性エマルジョンの形態に

おけるシリコン油 0.8% 30

水 32%

細かく粉碎した活性成分を、上記アジュバントと直接混合する。この方法で、懸濁濃縮物を得、これからいずれかの所望の濃度の懸濁液を、水による希釈により得ることができる。

2. 4水中で分散可能な粉末混合物 a) b) c)

活性成分 25% 50% 75%

ナトリウム・リグニンスルホネート 5% 5% —

オレイン酸 3% — 5%

ナトリウム・ジイソブチルナフタレン・

スルホネート — 6% 10% 40

オクチルフェノール・ポリエチレン・グリコール・エーテル

(7~8 mol のエチレン・オキシド) — 2% —

高分散ケイ酸 5% 10% 10%

カオリン 62% 27% —

上記活性成分を、上記アジュバントと完全混合し、そしてその混合物を好適なミル内で微粉碎し、水により希釈することができる水和性粉末を得て所望の濃度の懸濁液を得る。

2. 5ダスト a) b)

表1~6からの活性成分 2% 5%

高分散ケイ酸 1% 5% 50

タルク	97%	—
カオリン	—	90%

直ぐに使用できるダストを、上記担体を上記活性成分とじかに混合し、そしてこの混合物を粉砕することにより得る。

2. 6 粒剤 (granulate) a) b)

表1～6からの活性成分	5%	10%
カオリン	94%	—
高分散ケイ酸	1%	—
アタパルジット	—	90%

上記活性成分を、塩化メチレン中に溶解し、そしてその溶液を担体上にスプレーし、そしてこの溶媒をその後、真空で蒸発させる。このような粒剤を動物飼料と混合することができる。

2. 7 粒剤

活性成分	10%
ナトリウム・リグニンスルホネート	2%
カルボキシメチルセルロース	1%
カオリン	87%

上記活性成分を、上記アジュバントと混合・粉砕し、そしてこの混合物を水で温められる。この混合物を押出し、そして次に気流中で乾燥させる。

2. 8 粒剤

活性成分	3%
ポリエチレン・グリコール (MW 200)	3%
カオリン	94%

(MW = 分子量)

微粉砕された活性成分を、ミキサー内で、ポリエチレン・グリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。非発塵性コート粒剤を、このやり方で得る。

2. 9 錠剤

組成 (1000錠剤当り) :

活性成分	25.0 g
ラクトース	100.7 g
小麦デンプン	7.5 g
ポリエチレン・グリコール 6000	5.0 g
タルク	5.0 g
ステアリン酸マグネシウム	1.8 g
脱塩水	適量

まず、固体成分の全てを、0.6mmメッシュ・サイズの節を通す。次に、活性成分、ラクトース、タルクとデンプンの半量をとともに混合する。デンプンの残り半分を40mlの水に懸濁させ、そしてその懸濁液を、100mlの水中のポリエチレン・グリコールの沸騰溶液に添加する。得られたデンプン・ペーストを、メイン・バッチに添加し、そして混合物を、必要な場合、水を添加して粒状化する。この粒剤を35℃で一夜乾燥させ、1.2mmのメッシュ・サイズを通過させ、ステアリン酸マグネシウムと混合し、そして圧縮して、約6mmのメッシュサイズをもち、かつ、両側がくぼんだ錠剤を形成する。

2. 10. 注射配合品

A. 油状媒体 (遅延放出)

表1～6の化合物	0.1～1.0 g
アメリカホドイモ油	100mlまで
活性成分	0.1～1.0 g
ゴマ油	100mlまで

活性成分を、攪拌し、そして場合により緩やかに加熱しながら上記油の一部分中に溶解し、そして冷却後、溶液を所望の容量に調整し、そして好適な0.22mmの膜フィルターを

通して滅菌濾過する。

B. 水混和性溶媒（平均の放出速度）

活性成分 0.1～1.0 g

4-ヒドロキシメチル-1,3-ジオキソラン
（グリセロール・ホルマー）

40 g

1,2-プロパンジオール

100 mlまで

活性成分

0.1～1.0 g

グリセロール・ジメチル・ケタール

40 g

1,2-プロパンジオール

100 mlまで

活性成分を、攪拌しながら上記溶媒の一部中に溶解させ、そしてその溶液を所望の容量に調整し、そして好適な0.22 mm膜フィルターを通して滅菌濾過する。

10

C. 溶解産物（速い放出）

活性成分 0.1～1.0 g

ポリエトキシ化ヒマシ油

（40 エチレン・オキシド単価）

10 g

1,2-プロパンジオール

20 g

ベンジル・アルコール

1 g

注射器への水

100 mlまで

活性成分

0.1～1.0 g

ポリエトキシ化ソルビタン・モノオレエート

20

（20 エチレン・オキシド単位）

8 g

4-ヒドロキシメチル-1,3-ジオキソラン

（グリセロール・ホルマー）

20 g

ベンジル・アルコール

1 g

注射器への水

100 mlまで

調製：活性成分を、上記溶媒と界面活性剤中に溶解し、そしてその溶液を、水により所望の容量に調整する。次に滅菌濾過を、0.22 mmの多孔直径をもつ好適な膜を通して行う。

【0203】

上記水性系を、経口及び／又は脈管内投与のためにも好ましいやり方で使用することができる。

30

2. 11. 注ぎ（Pour on）

A.

活性成分 10 %

エポキシ化大豆油 5 %

オレイル・アルコール 85 %

B.

活性成分 20 %

ピリジン-2-オン 15 %

イソプロピル・ミリステート 65 %

40

上記組成物に、式（I）の化合物に対して中立であり、そして処置される宿主動物に対して有害な効果をもたないさらなる生物学的に活性な物質又は添加物、そしてまた無機塩又はビタミンを添加することもできる。

3. 生物学的実施例

A. 殺虫作用

3. 1. アフィス・クラシボラ（Aphis craccivora）に対する作用

エンドソの苗木にアフィス・クラシボラをはびこらせ、その後に、100 ppmの活性成分を含むスプレー混合物をスプレーし、そして次に、20℃においてインキュベートする。3及び6日後、集団におけるパーセンテージ低下（%応答）を、処理された植物上の死んだアブラムシの数を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する

50

。

【0204】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

3. 2. ディアブロティカ・バルテアタ (Diabrotica balteata) に対する作用

コーンの苗木に、100ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーし、そのスプレーコーティングが乾燥した後、第2段階にある10匹のディアブロティカ・バルテアタの幼虫を宿らせ、そして次にプラスチック容器内に入れる。6日後、集団におけるパーセンテージ低下(%応答)を、処理された植物上の死んだ幼虫の数と、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

10

【0205】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示し；特に化合物1. 1と2. 4は、80%超の効果を示す。

3. 3. ヘリオシス・ビレッセンス (Heliothis virescens) に対する作用

若い大豆植物に、100ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーし、そしてそのスプレーコーティングを乾燥させた後、第1段階にある10匹のヘリオシス・ビレッセンスの毛虫を宿らせ、そして次にプラスチック容器内に入れる。6日後集団(数)及び摂食障害におけるパーセンテージ低下(%応答)を、処理された植物上の死んだ毛虫の数及び摂食障害を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

20

【0206】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示し；特に、化合物1. 17は、80%超の効果を示す。

3. 4. スポドプテラ・リトラリス (Spodoptera littoralis) に対する作用

若い大豆植物に、100ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーし、そのスプレーコーティングが乾燥した後、第3段階にある10匹のスポドプテラ・リトラリスの毛虫を宿らせ、そして次にプラスチック容器内に入れる。3日後、集団(数)におけるパーセンテージ低下及び摂食障害におけるパーセンテージ低下(%応答)を、処理された植物上の死んだ毛虫の数と摂食障害を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

30

【0207】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示し；特に、化合物1. 1～1. 6, 1. 8～1. 14, 1. 16, 1. 16～1. 25、及び2. 4は、80%超の効果を示す。

3. 5. ニラパルバタ・ルゲンス (Nilaparvata lugens) に対する作用

米植物(rice plants)を、400ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物で処理する。そのスプレーコーティングが乾燥した後、上記米植物に、第2及び第3段階にあるヨコバイの幼虫を宿らせる。評価を21日後に行う。集団(数)におけるパーセンテージ低下(%応答)を、処理された植物上の生存ヨコバイの数を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

40

【0208】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

3. 6. クロシドロミア・ビノタリス (Crocidolomia binotalis) に対する作用

若いキャベツ植物に、400ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーする。そのスプレーコーティングが乾燥した後、上記キャベツ植物に、第3段階にある10匹のクロシドロミア・ビノタリスの毛虫を宿らせ、そしてプラスチック容器

50

内に入れる。評価を3日後に行う。集団（数）におけるパーセンテージ低下及び摂食障害におけるパーセンテージ低下（%応答）を、処理された植物上の死んだ毛虫の数と摂食障害を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

【0209】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

3. 7. アンソノマス・グランディス (*Anthonomus grandis*) に対する作用

若い綿植物に、400ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーする。そのスプレー・コーティングが乾燥した後、綿植物に、10匹のアンソノマス・グランディス成体を宿し、そしてプラスチック容器内に入れる。評価を3日後に行う。集団（数）におけるパーセンテージ低下、及び摂食障害におけるパーセンテージ低下（%応答）を、処理された植物上の死んだ甲虫の数と摂食障害を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

10

【0210】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

3. 8. アオニジエラ・オーランチイ (*Aonidiella aurantii*) に対する作用

ポテト塊茎に、アオニジエラ・オーランチイのは行動物 (*crawlers*) を宿らせる。約2週間後、上記ポテトを、400ppmの活性成分を含む水性エマルジョン又は懸濁スプレー混合物中に浸漬する。上記塊茎が乾燥したとき、それらをプラスチック容器内でインキュベートする。評価のために、10～12週後、処理された集団の最初の次世代のは行動物の生存率を、処理されていない対照のものと比較する。

20

【0211】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

3. 9. ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*) に対する作用

ツルナシインゲン (*Dwarf bean*) 植物を、ケージ・カゴ内に入れ、そしてそれにベミシア・タバシの成虫を宿す。産卵が生じた後、成虫の全てを取り出す。10日後、上記植物とその上にいる若虫 (*nymphs*) に、400ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーする。さらに14日後、孵化した卵のパーセンテージを、処理されていない対照と比較して評価する。

30

【0212】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

B. 殺ダニ作用

3. 10. テトラニカス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) に対する作用

若いインゲン豆植物に、テトラニカス・ウルチカエの混合集団を宿し、そして1日後、100ppmの活性成分を含む水性エマルジョン・スプレー混合物をスプレーし、そしてこれを25℃で6日間インキュベートし、そして次に評価する。集団（数）におけるパーセンテージ低下（%応答）を、処理された植物上の死んだ卵、幼虫、及び成虫の数を、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

40

【0213】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示し；特に化合物1. 1, 1. 5, 1. 11～1. 19、及び1. 21は、80%超の効果を示す。

3. 11. パノニカス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (有機リン酸及びカルバリルに対する耐性) に対する作用

リンゴの苗木に、パノニカス・ウルミの生態雌を宿す。7日後、はびこった植物に、400ppmのテスト化合物を含む水性エマルジョン・スプレー混合物を、しずくが垂れるまでスプレーし、そして温室内で栽培する。評価を、14日後に行う。集団（数）におけるパーセンテージ低下（%応答）を、処理された植物上の死んだハダニ (*spider mites*) の数と、処理されていない植物上のものと比較することにより測定する。

50

【0214】

表1～4の化合物は、本テストにおいて良い効果を示す。

C. 殺内部寄生生物作用

3. 12. 注ぎ (pour-on) 適用によるネコにおける成体ノミの防除

成体ノミに対するテスト化合物の有効性を測定するために、各々2匹のネコである4群を使用する。各ネコに、100ネコ・ノミ [クテロセファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis) (Bouche)] をはびこらせ、そしてこれを、体重1kg当り20mgの活性成分で処理する。この処理を、ネコの首のうしろ上の局所的に限定された領域に上記配合品を適用することにより行う。1群にノミをはびこらせたがプラセボ、すなわち、活性成分を含まない配合品だけで処理し、そして対照として役立たせた。他の群を、比較物質としてのニテンピラム (nitenpyram) で処理し；残りの2群を、テスト化合物で処理する。動物の毛皮からの生存ノミを櫛ですき、それをカウントし、そしてそのカウントされた数を、対照群及びニテンピラムにより処理された群におけるノミの数と比較することにより、各群において評価する。詳細な手順は以下のようなものである：各ネコに、0日目に処理直後に100匹のノミをはびこらせる。+1日目に、各動物を櫛ですき、生存ノミの数を測定し；次に生存ノミを、同一のネコ上に戻し、そして24時間後に、上記の櫛すき及び評価を繰り返す。上記の24時間後に未だ生存しているノミは、そのネコに戻さない。次に、上記手順を、+3日目、+7日目、+9日目、+14日目、+21日目、+28日目、+35日目、+42日目、及び+49日目に繰り返し、そしてこの方法で、有効性及び作用の継続時間を測定する。生存ノミが櫛ですかれて取り出される日には、約2.7mlの血液サンプルを各ネコから採取し一旦し、対照群を除く一、そして活性成分の含有量を計測する。有効性を、以下の式に従って測定する：

【0215】

【数1】

$$\% \text{活性} = \frac{\frac{\text{生きているノミの数} / \text{対照動物}}{\text{生きているノミの数} / \text{試験動物}} - 1}{\text{生きているノミの数} / \text{対照動物}} \times 100$$

【0216】

本発明に係る式 (I) の化合物が、ニネンピラムに比較して優れた長期間の作用を達成していることが示される。

【0217】

イヌにおいては、上記テストは全く同様のやり方で進行する。同様の効果が、上記物質が注ぎ (pour-on) の形態ではなく、注射溶液の形態において投与されるときにも観察される。

3. 13. 皮下注射によるネコにおける成体ノミの防除

十分に成長したノミに対するテスト化合物の有効性を測定するために、生後1.5～4年の各々2匹のネコである4群を使用する。各ネコに、100ネコ・ノミ [Ctenocephalides felis (Bouche)] をはびこらせ、そしてこれを、体重1kg当り20mgの活性成分で処理する。この処理を、左肩甲骨のうしろに活性成分の溶液を皮下注射することにより行う。1群をノミではびこらせたがプラセボ、すなわち活性成分を含まない配合品だけで処理し、そして対照として役立たせる。他の群を、比較物質としてニテンピラムで処理し；残りの2群をテスト化合物で処理する。評価を各場合において先の実施例と同様にして行う。

【0218】

これは、皮下注射後、本発明に係る表 1～4 の物質が、ニテンピラムと比較して優れた長期間の効果をもたらすことを示している。

【0219】

イヌを用いた同様のテストは、これに見合う結果を導く。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
<i>C 0 7 D 239/38</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 239/38	
<i>C 0 7 D 239/42</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 239/42	Z
<i>A 0 1 N 43/54</i>	<i>(2006.01)</i>	A 0 1 N 43/54	B
<i>A 0 1 P 7/02</i>	<i>(2006.01)</i>	A 0 1 P 7/02	
<i>A 0 1 P 7/04</i>	<i>(2006.01)</i>	A 0 1 P 7/04	
<i>A 6 1 K 31/505</i>	<i>(2006.01)</i>	A 6 1 K 31/505	
<i>A 6 1 P 33/14</i>	<i>(2006.01)</i>	A 6 1 P 33/14	

- (72)発明者 エベルレ, マルティン
スイス国, ツェーハー 4 1 0 3 ボットミンゲン, アステルハクシュトラーク 2 2
- (72)発明者 イアングナト, アンドレ
スイス国, ツェーハー 4 0 5 4 バーゼル, ビルシクシュトラーク 8 1
- (72)発明者 ツァムバッハ, ベルナー
スイス国, ツェーハー 4 1 1 2 ベトビル, クレデレンバーク 3 5
- (72)発明者 ステイガー, アルトゥル
スイス国, ツェーハー 4 1 4 4 アルレスハイム, ブリュージュバーク 1 4
- (72)発明者 ファルオーク, ザレーム
スイス国, ツェーハー 4 4 2 2 アリスドルフ, キルハッケルシュトラーク 2 7

審査官 大野 晃

- (56)参考文献 特表平07-508999 (JP, A)
特開平07-033748 (JP, A)
特表平09-508108 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D 239/26
C07D 239/28
C07D 239/30
C07D 239/34
C07D 239/36
C07D 239/38
C07D 239/42
A01N 43/54
A61K 31/505
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)