

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7690404号
(P7690404)

(45)発行日 令和7年6月10日(2025.6.10)

(24)登録日 令和7年6月2日(2025.6.2)

(51)国際特許分類		F I	
C 0 7 D	471/04 (2006.01)	C 0 7 D	471/04 1 0 5 C
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04
A 0 1 N	43/90 (2006.01)	A 0 1 N	43/90 1 0 4
C 0 7 D	519/00 (2006.01)	A 0 1 N	43/90 1 0 3
請求項の数 15 (全157頁) 最終頁に続く			
(21)出願番号	特願2021-573834(P2021-573834)	(73)特許権者	519135367
(86)(22)出願日	令和2年6月12日(2020.6.12)		ピーアイ インダストリーズ リミテッド
(65)公表番号	特表2022-536757(P2022-536757 A)		P I I N D U S T R I E S L T D
(43)公表日	令和4年8月18日(2022.8.18)		インド共和国 3 1 3 0 0 1 ラージャス
(86)国際出願番号	PCT/IB2020/055513		ターン, ウダイプル, ウダイサガー ロード
(87)国際公開番号	WO2020/250183	(74)代理人	100103894
(87)国際公開日	令和2年12月17日(2020.12.17)		弁理士 家入 健
審査請求日	令和5年6月12日(2023.6.12)	(72)発明者	ククレジャ ガガン
(31)優先権主張番号	201911023447		インド共和国 1 1 0 0 3 4 デリー, ビ
(32)優先日	令和1年6月13日(2019.6.13)		タムブラ, オービーピー. ビー. ビー
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)		インターナショナル スクール, サーダー
			パタル アpartment, エルディー1 6 6
		(72)発明者	クマール ヴィカース
			最終頁に続く

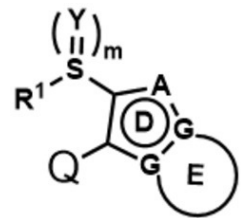
(54)【発明の名称】 縮合複素環式化合物、組成物、混合物、害虫駆除方法、害虫駆除剤としてのその使用、及び種子

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物であって、

【化1】



式(I)

ここで、

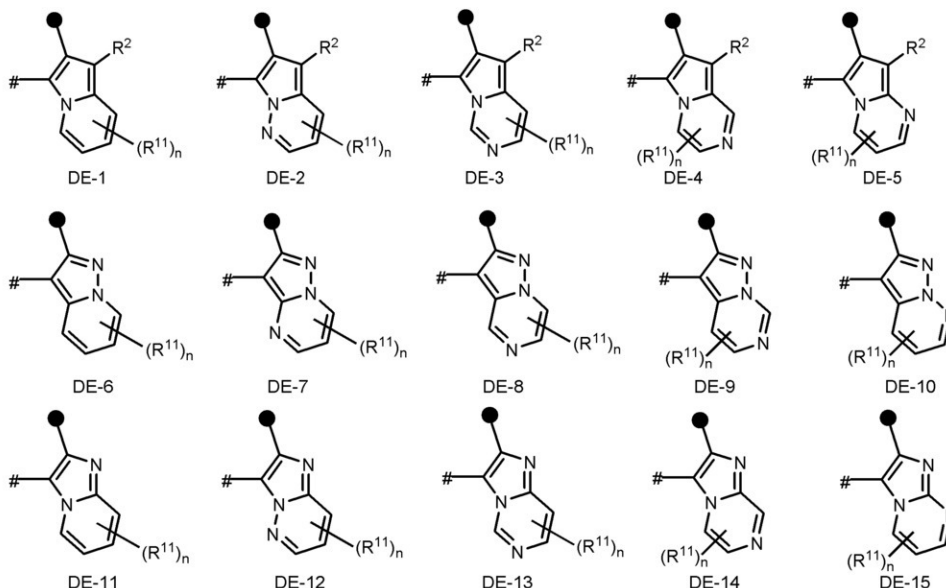
R¹は、C₁~C₆-アルキルであり、

Yは、独立して、O又はNR^Yから選択され、

R^Yは、水素、シアノ、C₁~C₄-アルキル、C₂~C₄-アルケニル、C₂~C₄-アルキニル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₂~C₄-ハロアルケニル、C₃~C₅-シクロアルキル、及びC₃~C₅-シクロアルキル-C₁~C₃-アルキルからなる群から選択され、

縮合環D及びEは、下記DE-1~DE-15から選択され、

【化 2】



ここで、#は、環Qへの結合点を示し、●は、基- $S(Y)_mR^1$ への結合点を示し、 n は、0～4の整数であり、

R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{2a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^2 の環状基は、1つ又は複数の R^{2b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{2a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{2b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $Si(R')_3$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、及び $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ からなる群から選択され、

Qは、下記Q1a～Q10bから選択され、

10

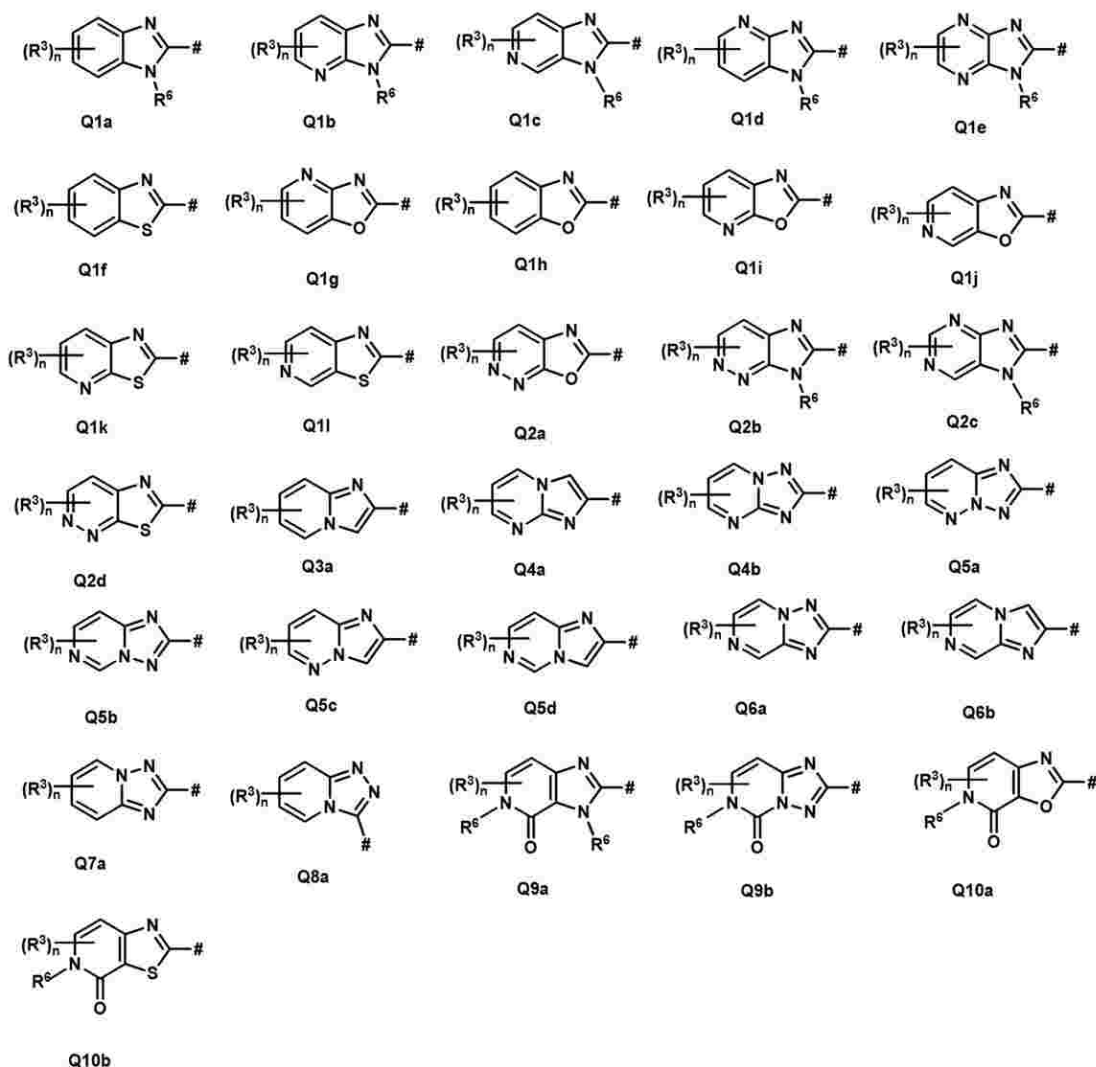
20

30

40

50

【化 3】



ここで、 $\#$ は、前記縮合環Dへの結合点を示し、 $\bullet$ は、基 $-S(Y)_mR^{11}$ への結合点を示し、 n は、 $0 \sim 4$ の整数であり、

R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、及び $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ からなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{3a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^3 の環状基は、1つ又は複数の R^{3b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{3a} は、ハロゲン及びシアノからなる群から選択され、

R^{3b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルからなる群から選択され、

2つの R^3 は、それらが結合している原子と一緒に、又はC、N、O、Sからなる群から選択される更なる原子と一緒に、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 、及び $Si(R')_2$ からなる群から選択される1~3つの環員を任意選択的に含んで、3~7員環を形成してもよく、該3~7員環は、その部分についてハロゲン、シアノ、 R^{3c} 、 OR^{3c} 、 SR^{3c} 、 NR^{3c}_2 、 $Si(R^{3c})_3$ 、 $COOR^{3c}$ 、及び $CONR^{3c}_2$ からなる群から選択される1つ又は複数の基で置換されていてもよく、

R^{3c} は、水素、ハロゲン、直鎖又は分枝鎖 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、及び環状 $C_3 \sim C_8$ -アルキルからなる群から選択され、 R^{3c} の基は、1つ又は複数のハロゲンで任意選択的に置換されており、

R^{11} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim$

C_6 -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $P(=O)(OR')_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{11a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^{11} の環状基は、1つ又は複数の R^{11b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{11a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

10

R^{11b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $C(R')_2 - NR^5R^6$ 、 $C(R')_2 - OR^4$ 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^4 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、及び $C_6 \sim C_{10}$ -アリールからなる群から選択され、各脂肪族基は、任意選択的に R^4a で置換されていてもよく、 R^4 の環状基は、1つ又は複数の R^4b 基で任意選択的に置換されていてもよく、

20

R^4a は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、及び $S(\oplus)_2R'$ からなる群から選択され、

R^4b は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルからなる群から選択され、

R^5 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $NR'R''$ 、 $S(\oplus)_2R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、 R^5a で任意選択的に置換されていてもよく、 R^5 の環状基は、1つ又は複数の R^5b 基で任意選択的に置換されていてもよく、

30

R^5a は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\oplus)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $Si(R'_3)C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^5b は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\oplus)_2R'$ 、 $Si(R'_3)$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

40

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 NR^5R^6 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^7a 基で任意選択的に

50

置換されていてもよく、 R^7 の環状基は、1つ又は複数の R^{7b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{7a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\text{Q})_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{7b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\text{Q})_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

10

R^8 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 NR^5R^6 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪酸基は、1つ又は複数の R^{8a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^8 の環状基は、1つ又は複数の R^{8b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{8a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\text{Q})_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

20

R^{8b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\text{Q})_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^9 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

R^{10} は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $Si(R')_3$ 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

30

R' は、ハロゲン、シアノ、 R'' 、 OR'' 、 $N \frac{1}{2}R^5S'(O)_{0 \sim 2}R''$ 、 $C(=O)R''$ 、 $C(=O)OR''$ 、及び $C(=O)N(R^8)$ からなる群から選択され、

R'' は、水素、 $1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、及び $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキルからなる群から選択され、各々は、ハロゲンで任意選択的に置換されていてもよく、

$R^1 \sim R^{11}$ 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2ab} 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3ab} 、 R^{3c} 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{8a} 、及び R^{8b} の各基は、ハロゲン、シアノ、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $N(R'_2)COOR'$ 、及び $CON(R'_2)$ からなる群から選択される1つ又は複数の基で任意選択的に置換されていてもよく、

40

m は、0～2の範囲の整数である、

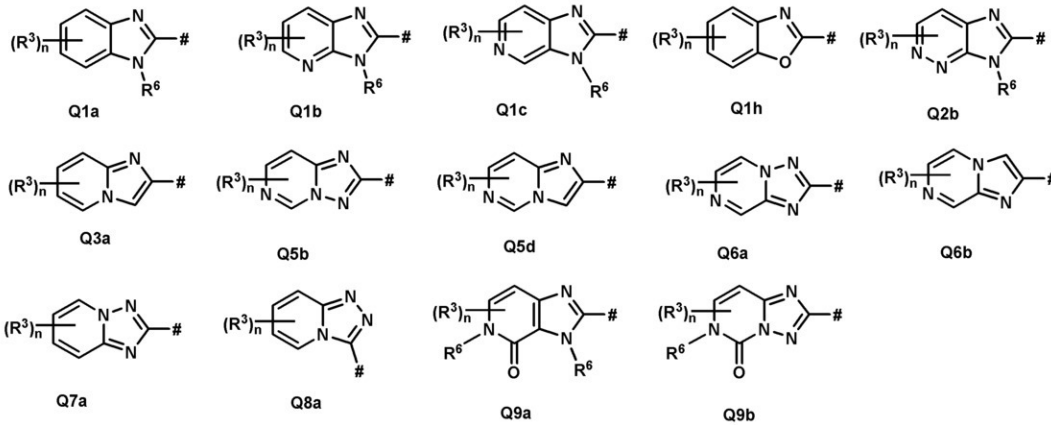
化合物、又は農学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、多形体、金属錯体、又はN-オキシド。

【請求項2】

Qが、下記から選択され、

50

【化 4】



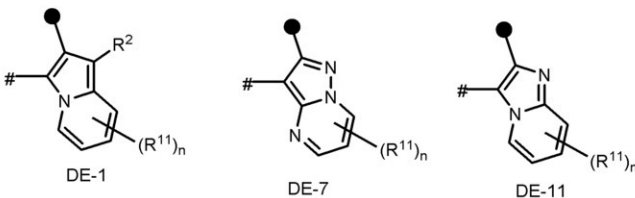
ここで、# は、前記縮合環 D への結合点を示し、

R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、及び $S(Y)_0 \sim 2 R^7$ からなる群から選択され、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -シクロアルキルからなる群から選択され、

前記縮合環 D 及び E は、下記から選択され、

【化 5】



ここで、# は、前記環 Q への結合点を示し、● は、基 $-S(Y)_m R^1$ への結合点を示し、

R^2 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_6 \sim C_8$ -アリール、 $C_7 \sim C_9$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_6$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1 つ又は複数の R^{2a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^2 の環状基は、1 つ又は複数の R^{2b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

m は、0 ~ 2 の範囲の整数であり、

n は、0 ~ 4 の範囲の整数であり、

R^{11} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $NR^5 R^6$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1 つ又は複数の R^{11a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^{11} の環状基は、1 つ又は複数の R^{11b} 基で任意選択的に置換されていてもよい、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物が、

2 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン；

6 - (1 - ブロモ - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (トリフルオロメチル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (8 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) - 7 - (トリフルオロメチル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

10

2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

20

2 - (2 - (エチルチオ) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) チオ) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

30

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) チオ) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

40

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3

50

-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
 2-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ
 [4,5-c]ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダ
 ザゾ[4,5-b]ピリジン;
 2-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,
 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イ
 ミダゾ[4,5-b]ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ
 [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3
 H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ
 [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3
 H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
 ラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル
)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
 ラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル
)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ
 [1,5-a]ピリミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ[d]
]オキサゾール;
 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
 ラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)スルホニル
)ベンゾ[d]オキサゾール;
 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピ
 リミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ[d]オキサゾール;
 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ[d]
]オキサゾール;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリ
 ミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,
 5-c]ピリジン;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリ
 ミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,
 5-b]ピリジン;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ
 [4,5-c]ピリジン;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリ
 ミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ[d]オキサゾール;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ
 [4,5-b]ピリジン;
 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]
]ピリミジン-3-イル)-5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ[d]オ
 キサゾール;

10

20

30

40

50

2 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) チオ) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

10

2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

20

2 - (6 - クロロ - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 6 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (6 - クロロ - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

30

2 - (6 - クロロ - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (6 - クロロ - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

40

2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリ

50

ミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-5-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-5-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-5-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

10

2-(2-(エチルスルホニル)-5-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(6-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-6-フェニルピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

20

2-(5-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-6-フェニルピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

2-(5-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(5-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

30

2-(5-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

2-(6-ブromo-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(6-ブromo-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

40

2-(6-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

2-(6-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

2-(6-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-5-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)

50

2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

50

3 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - a] プリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] プリジン;

3 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - a] プリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 6 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

10

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

20

2 - (7 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] プリジン;

2 - (7 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

30

2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

40

2 - (エチルチオ) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

2 - (エチルスルホニル) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエト

50

キシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;

3-(7-(3, 5-ジクロロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -6-(トリフルオロメチル) -[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン;

3-(7-(3, 5-ジクロロフェニル) -2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -6-(トリフルオロメチル) -[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン;

2-(7-(2, 3-ジクロロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

10

2-(2-(エチルチオ) -7-フェニルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(2, 3-ジクロロフェニル) -2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル) -7-フェニルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

20

2-(7-(4-クロロ-3-フルオロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(3, 5-ジクロロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(4-クロロ-3-フルオロフェニル) -2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(4-クロロ-3-フルオロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;

30

2-(7-(2, 4-ジクロロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(2, 4-ジクロロフェニル) -2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2-(7-(2, 4-ジクロロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;

40

2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;

2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル) -2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;

2-(7-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル) フェニル) -2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

50

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (7 - (3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - メチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - メチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

(7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 2 - イル) (エチル) (イミノ) - 6 - スルファノン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - メチルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン;

2 - (7 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 5, 7 - ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (エチルチオ) - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 (4 H) - オン;

2 - (7 - ブロモ - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル

10

20

30

40

50

-) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (エチルスルホニル) - N - メチル - 3 - (7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン ;
 6 - (8 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (エチルチオ) - N - メチル - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - フルオロフェノキシ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 6 - (8 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン ;
 2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピラジン ;
 4 - (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン - 6 - イル) インドリジン - 8 - イル) - 2 - フルオロベンゾニトリル ;
 2 - (8 - (シクロプロピルメチル) - 2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (7 - (4 - クロロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン ;
 2 - (7 - シクロプロピル - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピラジン ;
 2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン ;
 4 - (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - イル) モルホリン ;
 2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾ

10

20

30

40

50

ロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7-ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

6 - (1-プロモ-2 - (エチルスルホニル) - 8-メチルインドリジン-3-イル) - 7-メチル-3 - (トリフルオロメチル) - 7H-イミダゾ [4, 5-c] ピリダジン; 10

6 - (8-プロモ-2 - (エチルスルホニル) インドリジン-3-イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 7-メチル-7H-イミダゾ [4, 5-c] ピリダジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7-メトキシピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (メチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2 - (エチルスルホニル) - 3 - (3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7 (4H) -チオン; 20

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;

2 - (7-エトキシ-2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピラジン;

ジエチル (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピラジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-イル) イミノ) - 16-スルファノン;

2 - (エチルスルホニル) - N, N-ジメチル-3 - (3-メチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-8-アミン; 30

6 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 7-メチル-3 - (トリフルオロメチル) - 7H-イミダゾ [4, 5-c] ピリダジン;

2 - (7 - (4-クロロ-3-フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3, 5-ジメチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3, 5-ジヒドロ-4H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン-4-オン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) - 1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3, 5-ジメチル-6 - (トリフルオロメチル) - 3, 5-ジヒドロ-4H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン-4-オン; 40

2 - (7 - (3-クロロ-5-フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピラジン;

2 - (7 - (3, 5-ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-c] ピリミジン;

2 - (7 - (4-クロロ-3-フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 6-メチル-7 - (トリフルオロメチル) - 50

[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン-5 (6H) -オン;
2-(7-(5-クロロピリジン-2-イル))-2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン;
2-(2-(エチルスルホニル)-7-(5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-6-メチル-7-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン-5 (6H) -オン;
2-(2-(エチルスルホニル)-7-(3-(トリフルオロメチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-7-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン;
エチル (3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-2-イル) (メチルイミノ)-16-スルファノン、から選択される、
請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

昆虫及び／又はダニ害虫を防除又は防虫するための組成物であって、
生物学的に有効な量の請求項1に記載の化合物、又は農学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、多形体、金属錯体、又はN-オキシドと、
界面活性剤及び助剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加の成分と、を含む、
組成物。

【請求項5】

殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、又は栄養素から選択される少なくとも1つの追加の生物学的活性適合化合物をさらに含む、
請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

前記化合物の前記生物学的に有効な量が、前記組成物の総重量に対して0.1～99重量%の範囲である、
請求項4に記載の組成物。

【請求項7】

前記化合物の前記生物学的に有効な量が、前記組成物の総重量に対して5～50重量%の範囲である、
請求項4に記載の組成物。

【請求項8】

生物学的に有効な量の請求項1に記載の化合物と、
殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、及び栄養素から選択される少なくとも1つの追加の生物学的活性適合化合物と、を含む、
混合物。

【請求項9】

昆虫及びダニ害虫を駆除する方法であって、
前記昆虫及びダニ害虫、前記昆虫及びダニ害虫が成長する又は成長し得るその生息地、繁殖地、食物供給物、植物、種子、土壌、領域、材料、又は環境、又は害虫の攻撃又は侵入から保護される材料、植物、種子、土壌、表面、又は空間と、請求項1に記載の、又は請求項4に記載の組成物又は請求項8に記載の混合物に含まれる、生物学的に有効な量の化合物、又はその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、又は多形体とを、接触させることを含む、
方法。

【請求項 10】

昆虫及びダニ害虫による攻撃又は侵入から作物を保護するための方法であって、

前記作物と、請求項 1 に記載の、又は請求項 4 に記載の組成物又は請求項 8 に記載の混合物に含まれる、生物学的に有効な量の化合物、又はその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、又は多形体とを、接触させることを含む、

方法。

【請求項 11】

農作物又は園芸作物に 1 ヘクタール当たり 1 g a i ~ 5 0 0 0 g a i の範囲の量の有効投与量の化合物を適用することを含む、

請求項 9 又は 10 に記載の方法。

【請求項 12】

種子、植物、及び植物部分を土壌昆虫から保護し、苗木の根及び芽を土壌及び葉面昆虫から保護するための方法であって、

前記種子と、青刈前及び／又は発芽後に、請求項 1 に記載の、又は請求項 4 に記載の組成物又は請求項 8 に記載の混合物に含まれる、生物学的に有効な量の化合物、又はその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、又は多形体とを、接触させることを含む、

方法。

【請求項 13】

農作物及び園芸作物における昆虫及びダニ害虫の駆除のための、請求項 1 に記載の、又は請求項 4 に記載の組成物又は請求項 8 に記載の混合物に含まれる化合物、又はその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、又は多形体の、

使用。

【請求項 14】

前記農作物が、穀物、トウモロコシ、ソルガム、バジュラ、米、大豆、油料種子及び他のマメ科植物、果実及び果樹、ブドウ、ナッツ及びナッツの木、柑橘類及び柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科植物、油産生植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、甜菜、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、コショウ、他の野菜、及び観賞用植物である、

請求項 13 に記載の使用。

【請求項 15】

請求項 1 に記載の、又は請求項 4 に記載の組成物又は請求項 8 に記載の混合物に含まれる化合物、又はその塩、金属錯体、N-オキシド、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、又は多形体を含む種子であって、

前記種子中の前記化合物の量が、0.0001 重量% ~ 1 重量% の範囲である、種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、縮合複素環式化合物に関する。より詳細には、本発明は、式 (I) の縮合複素環式化合物及びその調製方法に関する。本発明はさらに、害虫駆除剤としての式 (I) の縮合複素環式化合物の使用に関する。

【背景技術】

【0002】

現在利用可能な近代の殺虫剤及びダニ駆除剤は、例えば、有効性のレベル、残効性、及び抗菌カスペクトル、並びに更なる有益な効果、並びにそれらの可能な使用に関する多くの要件を満たさなければならない。昆虫又はダニにのみ存在する生化学的作用機序に特異的に作用するが、既知の殺虫剤とは異なる特性を有利な方法でさらに示す選択的殺虫剤を

10

20

30

40

50

開発するための努力が過去数十年にわたって行われてきた。

【0003】

防除活性を有する複素環式化合物は既知であり、例えば、WO2016091731、WO2016162318、WO2017061497、WO2017125340、WO2017001311、WO2018095953、WO2019068572、及びWO2019038195に記載されている。

【0004】

しかしながら、このような防除剤を長期間使用することにより、多くの害虫が耐性を獲得し、長年にわたって従来使用されてきた既存の殺虫剤及び殺菌剤による効果的な防除がますます困難になり、この現象は近年さらに増加している。さらに、それらの既存の防除剤のうちの一部は、非常に有毒であるか、又はそれらの残留特性のために環境に長期間とどまり、生態系の破壊のために深刻な問題になり得る。

10

【0005】

したがって、より効果的で、毒性が低く、環境的に安全であり、及び／又は異なる作用様式を有する新しい化合物が継続的に必要とされている。

【0006】

上記を考慮して、本発明は、先行技術に関連する欠点を満たすか又は克服するそのような化合物を企図している。

【0007】

驚くべきことに、今や、本発明の対象である硫黄含有置換基を有する特定の新規な防除活性のある縮合複素環式化合物が、所望のように防除剤として好ましい特性を有することが見出された。

20

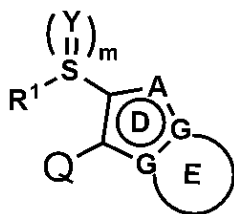
【発明の概要】

【0008】

したがって、本発明は、式(I)の縮合複素環式化合物又は農学的に許容されるその塩、異性体／構造異性体、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、互変異性体、金属錯体、多形体、又はN-オキシドを提供する：

【0009】

【化1】



30

【0010】

式(I)

【0011】

[式中、 R^1 、Y、Q、A、G、m、及びEは、詳細な説明で定義される通りである]。

40

【0012】

一実施形態では、本発明は、式(I)の化合物又は農学的に許容されるその塩を調製するためのプロセスを提供する。

【0013】

別の実施形態では、本発明は、無脊椎害虫動物を防除又は防虫するための組成物であって、生物学的に有効な量の式(I)の化合物、農学的に許容されるその塩、異性体／構造異性体、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、互変異性体、金属錯体、多形体、又はそのN-オキシド、並びに界面活性剤及び助剤からなる群より選択される少なくとも1つの追加の成分を含む、組成物を提供する。

【0014】

50

さらに別の実施形態では、組成物は、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、又は栄養素から選択される少なくとも1つの追加の生物学的に活性で適合性のある化合物をさらに含む。

【0015】

さらに別の実施形態では、本発明は、農作物及び／若しくは園芸作物における無脊椎害虫又は動物寄生虫を駆除するための、式(I)の化合物、農学的に許容されるその塩、異性体／構造異性体、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、互変異性体、金属錯体、多形体、又はN-オキシド、組成物、又は組み合わせの使用を提供する。

【0016】

さらに別の実施形態では、本発明は、無脊椎害虫動物を駆除する方法であって、無脊椎害虫動物、が成長する若しくは成長し得るその生息地、繁殖地、食物供給物、植物、種子、土壌、領域、材料、若しくは環境、又は害虫の攻撃若しくは侵入から保護される材料、植物、種子、土壌、表面、若しくは空間を、生物学的に有効な量の式(I)の化合物又は農学的に許容されるその塩、異性体／構造異性体、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、互変異性体、金属錯体、多形体、又はN-オキシド、組成物、又は組み合わせと接触させることを含む、方法を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0017】

定義：

【0018】

本開示で使用される用語のために本明細書で提供される定義は、例示目的のためであり、本開示で開示される本発明の範囲を決して制限するものではない。

【0019】

本明細書で使用される場合、用語「含む(comprises)」、「含む(comprising)」、「含む(includes)」、「含む(including)」、「有する(has)」、「有する(having)」、「含む(contains)」、「含む(containing)」、「を特徴とする」、又はそれらの他の任意の変形は、明示された任意の制限を受ける非排他的な含入を包含することを意図する。例えば、列挙された構成要素を含む組成物、混合物、プロセス、又は方法は、必ずしもそれらの構成要素のみに限定されず、明示的に列挙されていない又はそのような組成物、混合物、プロセス、若しくは方法に特有ではない他の構成要素を含み得る。

【0020】

「からなる」という移行句は、特定されていない任意の要素、工程、又は成分を除外する。特許請求の範囲にある場合、それに通常関連する不純物を除いて、記載されている材料以外の材料の含入に対して特許請求の範囲をクローズさせる。プレアンプルの直後ではなく、特許請求の範囲の本文の節において「からなる」という句が現れる場合、それはその節に記載されている構成要素のみを制限し、他の構成要素は全体として特許請求の範囲から除外されない。

【0021】

「本質的にからなる」という移行句は、文字通り開示されたものに加えて、材料、工程、特徴、要素、又は構成要素を含む組成物又は方法であって、ただし、これらの追加の材料、工程、特徴、要素、又は構成要素は、特許請求の範囲に記載された発明の基本的かつ新規の特性に実質的に影響を与えるものではない、組成物又は方法を定義するために使用される。「本質的にからなる」という用語は、「含む」及び「からなる」の中立を取る。

【0022】

さらに、明示的に反対の記載がない限り、「又は」は、包括的な「又は」を指し、排他的な「又は」を指すものではない。例えば、条件A「又は」Bは、次のいずれかによって満たされる：Aが○であり（又は存在する）及びBが×である（又は存在しない）、Aが×である（又は存在しない）及びBが○である（又は存在する）、並びにA及びBの両方が○である（又は存在する）。

【0023】

10

20

30

40

50

また、本発明の要素又は構成要素に先行する不定冠詞「a」及び「an」は、要素又は構成要素の場合（すなわち発生）の数に関して非制限的であることを意図している。したがって、「a」又は「an」は、1つ又は少なくとも1つを含むように読み取る必要があり、要素又は構成要素の単数形には、数が単数であることを明らかに意味しない限り、複数も含まれる。

【0024】

本開示において言及されるように、「無脊椎動物害虫」という用語は、害虫として経済的に重要な節足動物、腹足類、及び線虫を含む。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ダンゴムシ、コムカデが含まれる。「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジ、及び他の柄眼類が含まれる。「線虫」という用語は、線中門の生物を指す。「蠕虫」という用語には、回虫、犬糸状虫、植食性線虫（phytophagous nematode）（線虫綱（Nematoda））、吸虫（fluke）（吸虫綱（Trematoda））、鉤頭虫、条虫（tapeworm）（条虫綱（Cestoda））が含まれる。

10

【0025】

「農学的な（agronomic）」という用語は、食品及び繊維などの畑作物の生産を指し、トウモロコシ（corn）、大豆及び他のマメ科植物、米、穀物（例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦、米、トウモロコシ（maize））、葉野菜（例えば、レタス、キャベツ、及び他の菜作物など）、結実野菜（例えば、トマト、コショウ、ナス、アブラナ科植物、及びキュウリ）、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿、木の実（例えば、ナシ状果、核果、柑橘類）、小果樹類（例えば、ベリー、サクランボ）及び他の特殊作物（例えば、カノーラ、ヒマワリ、オリーブ）の成長を含む。

20

【0026】

「非農学的な（nonagronomic）」という用語は、農作物以外、例えば、園芸作物（例えば、畑で育てられていない温室植物、苗（nursery plant）、又は観賞用植物）、住宅、農業、商業、及び工業用構造物、芝生（turf）（例えば、芝生農場、牧草地、ゴルフコース、芝生（lawn）、スポーツ場など）、木製品、貯蔵製品、混農林業及び植生管理、公衆衛生（すなわちヒト）並びに動物の健康（例えば、ペット、家畜、及び家禽などの家畜化動物、野生生物などの非家畜化動物）の適用を指す。

【0027】

非農学的用途には、典型的には獣医使用のために製剤化された組成物の形態の、寄生虫駆除的に（parasitically）有効な（すなわち生物学的に有効な）量の本発明の化合物を保護される動物に投与することにより、無脊椎動物寄生害虫から動物を保護することが含まれる。本開示及び特許請求の範囲で言及されるように、「寄生虫駆除剤（parasiticide）」及び「寄生虫駆除的に」という用語は、害虫から動物を保護するための無脊椎動物寄生害虫に対する観察可能な効果を指す。寄生虫駆除効果は、典型的には、標的の無脊椎動物寄生害虫の発生又は活動の減少に関する。害虫に対するそのような効果には、壊死、死滅、成長の遅延、移動性の低下、又は宿主動物上若しくは宿主動物内にとどまる能力の低下、摂食の低下、並びに繁殖の阻害が含まれる。無脊椎動物寄生害虫に対するこれらの効果は、動物の寄生虫侵入又は感染の制御（予防、減少、又は排除を含む）を提供する。

30

【0028】

本開示の化合物は、純粋な形態で、又は立体異性体若しくは構造異性体などの異なる可能な異性体形態の混合物として存在し得る。様々な立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、キラル異性体、アトロプ異性体、配座異性体、回転異性体、互変異性体、光学異性体、多形体、及び幾何異性体が含まれる。これらの異性体の任意の所望の混合物は、本開示の特許請求の範囲内である。当業者は、1つの立体異性体が、他の異性体と比較して濃縮されたとき又は他の異性体から分離されたときに、より活性であり得、及び／又は有益な効果を示し得ることを理解するであろう。さらに、当業者は、上記異性体を分離、濃縮、及び／又は選択的に調製するためのプロセス又は方法又は技術を知っている。

40

【0029】

ここで、本説明に使用される様々な用語の意味を説明する。

50

【0030】

本明細書で使用される「脂肪族化合物」又は「脂肪族基」という用語は、炭素原子が直鎖、分枝鎖、又は非芳香族環に連結されている有機化合物である。

【0031】

単独で、又は「アルキルチオ」若しくは「ハロアルキル」若しくは-N（アルキル）若しくはアルキルカルボニルアルキル若しくはアルキルスフォニルアミノなどの複合語のいずれかで使用される「アルキル」という用語は、直鎖状又は分枝状C₁～C₂₄アルキル、好ましくはC₁～C₁₅アルキル、より好ましくはC₁～C₁₀アルキル、最も好ましくはC₁～C₆アルキルを含む。アルキルの代表的な例には、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1, 1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、及び1-エチル-2-メチルプロピル、又は異なる異性体が含まれる。例えば、アルキルシクロアルキルのように、アルキルが複合置換基の端部にある場合、開始での複合置換基の部分、例えば、シクロアルキルは、アルキルによって同一又は異なって独立して一置換又は多置換されていてもよい。他の基、例えば、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、ハロゲン、カルボニル、カルボニルオキシなどが端部にある複合置換基にも同じことが当てはまる。

【0032】

単独で又は複合語のいずれかで使用される「アルケニル」という用語は、直鎖状又は分枝状C₂～C₂₄アルケン、好ましくはC₂～C₁₅アルケン、より好ましくはC₂～C₁₀アルケン、最も好ましくはC₂～C₆アルケンを含む。アルケンの代表的な例には、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-1-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-1-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、3, 3-ジメチル-1-ブテニル、3, 3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、

及び 1-エチル-2-メチル-2-プロピニル、並びに異なる異性体が含まれる。「アルキル」には、1, 2-プロパジエニル及び 2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンも含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルケニルなどの一部としてのアルケニルに適用される。

【0033】

単独で又は複合語のいずれかで使用される「アルキニル」という用語は、直鎖状又は分枝状 $C_2 \sim C_{24}$ アルキン、好ましくは $C_2 \sim C_{15}$ アルキン、より好ましくは $C_2 \sim C_{10}$ アルキン、最も好ましくは $C_2 \sim C_6$ アルキンを含む。アルキンの非限定的な例には、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、3, 3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、及び 1-エチル-1-メチル-2-プロピニル、並びに異なる異性体が含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルキニルの一部としてのアルキニルなどに適用される。「アルキニル」という用語はまた、2, 5-ヘキサジエニルなどの複数の三重結合からなる部分を含むことができる。

【0034】

「シクロアルキル」という用語は、環を形成するように閉じたアルキルを意味する。非限定的な例には、シクロプロピル、シクロペンチル、及びシクロヘキシルが含まれるが、これらに限定されない。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばシクロアルキルアルキルなどの一部としてのシクロアルキルに適用される。

【0035】

「シクロアルケニル」という用語は、単環式の部分不飽和のヒドロカルビル基を含む環を形成するように閉じたアルケニルを意味する。非限定的な例には、シクロプロピニル、シクロペンテニル、及びシクロヘキセニルが含まれるが、これらに限定されない。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばシクロアルケニルアルキルなどの一部としてのシクロアルケニルに適用される。

【0036】

「シクロアルキニル」という用語は、単環式の部分不飽和の基を含む環を形成するように閉じたアルキニルを意味する。非限定的な例には、シクロプロピニル、シクロペンチニル、及びシクロヘキシニルが含まれるが、これらに限定されない。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばシクロアルキニルアルキルなどの一部としてのシクロアルキニルに適用される。

【0037】

「シクロアルコキシ」、「シクロアルケニルオキシ」などの用語も同様に定義される。シクロアルコキシの非限定的な例には、シクロプロピルオキシ、シクロペンチルオキシ、及びシクロヘキシルオキシが含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばシクロアルコキシアルキルなどの一部としてのシクロアルコキシに適用される。

【0038】

単独で又は「ハロアルキル」などの複合語のいずれかでの「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素、又はヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で使用

10

20

30

40

50

される場合、該アルキルは、同じであっても又は異なってもよいハロゲン原子で部分的又は完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」の非限定的な例には、クロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、1, 1-ジクロロ-2, 2, 2-トリフルオロエチル、及び1, 1, 1-トリフルオロプロパー-2-イルが含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルキルアミノアルキルなどの一部としてのハロアルキルに適用される。

【0039】

「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」という用語は、アルキル基の代わりに、アルケニル及びアルキニル基が置換基の一部として存在することを除いて、同様に定義される。

【0040】

「ハロアルコキシ」という用語は、基の水素原子の一部又はすべてが上記で特定されたハロゲン原子で置き換えられていてもよい、直鎖状又は分枝状アルコキシ基を意味する。ハロアルコキシの非限定的な例には、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、及び1, 1, 1-トリフルオロプロパー-2-オキシが含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルコキシアルキルなどの一部としてのハロアルコキシに適用される。

【0041】

「ハロアルキルチオ」という用語は、基の水素原子の一部又はすべてが上記で特定されたハロゲン原子で置き換えられていてもよい、直鎖状又は分枝状アルキルチオ基を意味する。ハロアルキルチオの非限定的な例には、クロロメチルチオ、ブロモメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-クロロエチルチオ、1-ブロモエチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリクロロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、及び1, 1, 1-トリフルオロプロパー-2-イルチオが含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルキルチオアルキルなどの一部としてのハロアルキルチオに適用される。

【0042】

「ハロアルキルスルフィニル」の非限定的な例には、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ が含まれる。「ハロアルキルスルホニル」の例には、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ が含まれる。

【0043】

「ヒドロキシ」という用語は、 $-\text{OH}$ を意味し、アミノは $-\text{NR}_2$ を意味し、式中、Rは、H又はアルキルなどの任意の可能な置換基であり得る。カルボニルは $-\text{C}(\text{O})-$ を意味し、カルボニルオキシは $-\text{OC}(\text{O})-$ を意味し、スルフィニルは SO を意味し、スルホニルは $\text{S}(\text{O})_2$ を意味する。

【0044】

単独で又は複合語のいずれかで使用される「アルコキシ」という用語は、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、好ましくは $C_1 \sim C_{15}$ アルコキシ、より好ましくは $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、最も好ましくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシを含む。アルコキシの例には、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ、1, 1-ジメチルエトキシ、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、2, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1, 1-ジメチルプロポキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1, 1, 2-トリメチルプロポキシ、1, 2, 2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、及び1-エチル-2-メチルプロポキシ、並びに異なる異性体が含まれる。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルコキシ、アルキニルアルコキシなどの一部としてのアルコキシに適用される。

10

【0045】

「アルコシアルキル」という用語は、アルキル上のアルコキシ置換を示す。「アルコシアルキル」の非限定的な例には、 CH_3OCH_2 、 $CH_3OCH_2CH_2$ 、 $CH_3CH_2OCH_2$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$ 、及び $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ が含まれる。

20

【0046】

「アルコシアルコキシ」という用語は、アルコキシ上のアルコキシ置換を示す。

【0047】

「アルキルチオ」という用語は、分枝状又は直鎖状アルキルチオ部分、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ、1, 1-ジメチルエチルチオ、ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、2, 2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1, 1-ジメチルプロピルチオ、1, 2-ジメチルプロピルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1, 1-ジメチルブチルチオ、1, 2-ジメチルブチルチオ、1, 3-ジメチルブチルチオ、2, 2-ジメチルブチルチオ、2, 3-ジメチルブチルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ、1, 2, 2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ、及び1-エチル-2-メチルプロピルチオ、並びに異なる異性体が含まれる。

30

【0048】

ハロシクロアルキル、ハロシクロアルケニル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルコシアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ハロアルコシアルキルなどは、上記の例と同様に定義される。

40

【0049】

「アルキルチオアルキル」という用語は、アルキル上のアルキルチオ置換を意味する。「アルキルチオアルキル」の代表的な例には、 $-CH_2SCH_2$ 、 $-CH_2SCH_2CH_2$ 、 $CH_3CH_2SCH_2$ 、 $CH_3CH_2CH_2CH_2SCH_2$ 、及び $CH_3CH_2SCH_2CH_2$ が含まれる。「アルキルチオアルコキシ」は、アルコキシ上のアルキルチオ置換を示す。「シクロアルキルアルキルアミノ」という用語は、アルキルアミノ上のシクロアルキル置換を示す。

【0050】

アルコシアルコシアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル

50

、シクロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノカルボニルなどの用語は、「アルキルチオアルキル」又はシクロアルキルアルキルアミノと同様に定義される。

【0051】

「アルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル基（ —CO— ）を介して骨格に結合したアルコキシ基である。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばシクロアルキルアルコキシカルボニルなどの一部としてのアルコキシカルボニルに適用される。

【0052】

「アルコキシカルボニルアルキルアミノ」という用語は、アルキルアミノ上のアルコキシカルボニル置換を示す。「アルキルカルボニルアルキルアミノ」は、アルキルアミノ上のアルキルカルボニル置換を示す。アルキルチオアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルキルアミノアルキルなどの用語も同様に定義される。

【0053】

「アルキルスルフィニル」の非限定的な例には、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1, 1-ジメチルエチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、2, 2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1, 1-ジメチルプロピルスルフィニル、1, 2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1, 1-ジメチルブチルスルフィニル、1, 2-ジメチルブチルスルフィニル、1, 3-ジメチルブチルスルフィニル、2, 2-ジメチルブチルスルフィニル、2, 3-ジメチルブチルスルフィニル、3, 3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルフィニル、1, 2, 2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニル、及び1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニル、並びに異なる異性体が含まれるが、これらに限定されない。「アリールスルフィニル」という用語は、 Ar—S(O) を含み、式中、Arは、任意のカルボキシル又は複素環であり得る。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばハロアルキルスルフィニルなどの一部としてのアルキルスルフィニルに適用される。

【0054】

「アルキルスルホニル」の非限定的な例には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル、1, 1-ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1, 1-ジメチルプロピルスルホニル、1, 2-ジメチルプロピルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1, 1-ジメチルブチルスルホニル、1, 2-ジメチルブチルスルホニル、1, 3-ジメチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルブチルスルホニル、2, 3-ジメチルブチルスルホニル、3, 3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1, 2, 2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル、及び1-エチル-2-メチルプロピルスルホニル、並びに異なる異性体が含まれるが、これらに限定されない。「アリールスルホニル」という用語は、 Ar—S(O)_2 を含み、式中、Arは、任意のカルボキシル又は複素環であり得る。この定義はまた、別段で定義されていない限り、複合置換基、例えば、アルキルスルホニルアルキルなどの一部としてのアルキルスルホニルに適用される。

【0055】

「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」などは、上記の例と同様に定義される。

【0056】

「炭素環」という用語は、「芳香族炭素環式環系」及び「非芳香族炭素環式環系」、又は環が芳香族若しくは非芳香族であってもよい多環式若しくは二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物を含む（芳香族は、ヒュッケル則を満たしていることを示し、非芳香族は、ヒュッケル則を満たしていないことを示す）。

【0057】

環に関連する「ヘテロ」という用語は、少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、かつ、窒素、酸素、及び硫黄からなる群より独立して選択される1～4個のヘテロ原子を含むことができる環（ただし、各環は、4個以下の窒素、2個以下の酸素、及び2個以下の硫黄を含む）を指す。

【0058】

「芳香族」という用語は、ヒュッケル則を満たしていることを示し、「非芳香族」という用語は、ヒュッケル則を満たしていないことを示す。

【0059】

「複素環」又は「複素環式」又は「複素環式環系」という用語は、「芳香族複素環」又は「ヘテロアリアル二環式環系」及び「非芳香族複素環式環系」、又は環が芳香族若しくは非芳香族であってもよい多環式若しくは二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物を含み、ここで、複素環は、N、O、S(O)_{0~2}から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含み、及び／又は複素環のCの環員は、C(=O)、C(=S)、C(=C R^{*} R^{*})、及びC=N R^{*}によって置き換えられてもよく、^{*}は整数を示す。

【0060】

「非芳香族複素環」又は「非芳香族複素環式」という用語は、以下を意味する：酸素、窒素、及び硫黄の群からの1～4個のヘテロ原子を含む、3～15員、好ましくは3～12員の飽和又は部分不飽和の複素環：炭素環員に加えて、1～3個の窒素原子及び／又は1個の酸素若しくは硫黄原子又は1個若しくは2個の酸素及び／若しくは硫黄原子を含む、単環式、二環式、又は三環式複素環（環に2個以上の酸素原子が含まれている場合、それらは直接隣接していない）；例えば（限定するものではないが）、オキセタニル、オキシラニル、アジリジニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソキサゾリジニル、4-イソキサゾリジニル、5-イソキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-1-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-トリアゾリジン-1-イル、1, 3, 4-トリアゾリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-3-イル、2, 4-ジヒドロフル-2-イル、2, 4-ジヒドロフル-3-イル、2, 3-ジヒドロチエン-2-イル、2, 3-ジヒドロチエン-3-イル、2, 4-ジヒドロチエン-2-イル、2, 4-ジヒドロチエン-3-イル、ピロリニル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソキサゾリン-3-イル、3-イソキサゾリン-3-イル、4-イソキサゾリン-3-イル、2-イソキサゾリン-4-イル、3-イソキサゾリン-4-イル、4-イソキサゾリン-4-イル、2-イソキサゾリン-5-イル、3-イソキサゾリン-5-イル、4-イソキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-

10

20

30

40

50

-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-
 -イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2, 3-ジヒ
 ドロピラゾール-1-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロ
 ピラゾール-3-イル、2, 3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロピラ
 ザール-5-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-1-イル、3, 4-ジヒドロピラゾー
 ル-3-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-4-イル、3, 4-ジヒドロピラゾール-
 5-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-1-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-3-
 イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4, 5-ジヒドロピラゾール-5-イル
 、2, 3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-3-イル
 、2, 3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾール-5-イル
 、3, 4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-3-イル
 、3, 4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-5-イル
 、3, 4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾール-3-イル
 、3, 4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、ピペリジニル、2-ピペリジニル、3-ピ
 ペリジニル、4-ピペリジニル、ピラジニル、モルホリニル、チオモルフリニル、1, 3-
 ジオキサン-5-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-
 テトラヒドロチエニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル
 、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピ
 リミジニル、2-ピペラジニル、1, 3, 5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イル、1,
 2, 4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、シクロセリン、2, 3, 4, 5-テトラヒ
 ドロ [1H] アゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は
 -7-イル、3, 4, 5, 6-テトラ-ヒドロ [2H] アゼピン-2-又は-3-又は-
 4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒドロ [1H] アゼ
 ピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、2,
 3, 6, 7-テトラヒドロ [1H] アゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は
 -5-又は-6-又は-7-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-又は-2-又は-3-又
 は-4-イル、テトラ-、及びヘキサヒドロオキセピニル、例えば、2, 3, 4, 5-テ
 トラヒドロ [1H] オキセピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-
 7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒドロ [1H] オキセピン-2-又は-3-又は-4-
 -又は-5-又は-6-又は-7-イル、2, 3, 6, 7-テトラヒドロ [1H] オキセ
 ピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、ヘキサヒドロア
 ゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-イル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-
 ジアゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル、テトラ-及びヘキ
 サヒドロ-1, 3-オキサゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-オキサゼピ
 ニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-ジオキセピニル、テトラ-並びにヘキサヒド
 ロ-1, 4-ジオキセピニル。この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置
 換基、例えばヘテロシクリルアルキルなどの一部としてのヘテロシクリルに適用される。

【0061】

「ヘテロアリアル」又は「芳香族複素環式」という用語は、以下を意味する：酸素、窒
 素、及び硫黄の群からの1~4個のヘテロ原子を含む、5又は6員の完全に不飽和の単環
 式環系（、環に複数の酸素原子が含まれている場合、それらは直接隣接していない）：1
 ~4個の窒素原子又は1~3個の窒素原子及び1個の硫黄又は酸素原子を含む5員ヘテロ
 アリアル：炭素原子に加えて、環員として1~4個の窒素原子又は1~3個の窒素原子及
 び1つの硫黄又は酸素原子を含んでもよい5員ヘテロアリアル基、例えば（限定するもの
 ではないが）、フリル、チエニル、ピロリル、イソキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾ
 リル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1,
 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、
 1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、テトラゾリル；1~4個の窒
 素原子を含む窒素結合5員ヘテロアリアル、又は1~3個の窒素原子を含むベンゾ縮合窒
 素結合5員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環員として1~4個の窒素原子又は1~

10

20

30

40

50

3個の窒素原子を含んでいてもよい5員ヘテロアリアル基であって、2個の隣接する炭素環員又は1個の窒素及び1個の隣接する炭素環員が、1個又は2個の炭素原子が窒素原子で置き換えられてもよいブター-1, 3-ジエン-1, 4-ジイル基によって架橋されてもよく、これらの環は、窒素環員のうちの1つを介して骨格に結合されている、5員ヘテロアリアル基、例えば（限定するものではないが）、1-ピロリル、1-ピラゾリル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1-イミダゾリル、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、及び1, 3, 4-トリアゾール-1-イル。

【0062】

1～4個の窒素原子を含む6員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、例えば、環員としてそれぞれ1～3個及び1～4個の窒素原子を含んでいてもよい6員ヘテロアリアル基、例えば（限定するものではないが）、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、及び1, 2, 4, 5-テトラジン-3-イル；1～3個の窒素原子又は1個の窒素原子及び1個の酸素又は硫黄原子を含むベンゾ縮合5員ヘテロアリアル：例えば（限定するものではないが）、インドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イル、ベンズイミダゾール-1-イル、ベンズイミダゾール-2-イル、ベンズイミダゾール-4-イル、ベンズイミダゾール-5-イル、インダゾール-1-イル、インダゾール-3-イル、インダゾール-4-イル、インダゾール-5-イル、インダゾール-6-イル、インダゾール-7-イル、インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-4-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-5-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-6-イル、1, 3-ベンゾチアゾール-7-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-2-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-4-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-5-イル、1, 3-ベンゾオキサゾール-6-イル、及び1, 3-ベンゾオキサゾール-7-イル；1～3個の窒素原子を含むベンゾ縮合6員ヘテロアリアル：例えば（限定するものではないが）キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イル、及びイソキノリン-8-イル。

【0063】

この定義はまた、別段で特に定義されていない限り、複合置換基、例えばヘテロアリアルアルキルなどの一部としてのヘテロアリアルに適用される。

【0064】

「トリアルキルシリル」という用語は、トリメチルシリル、トリエチルシリル、及びテ-ブチル-ジメチルシリルなどのシリコン原子に結合し及びこれを介して連結された3つの分枝状及び／又は直鎖状アルキル基を含む。「ハロトリアルキルシリル」は、3つのアルキル基のうちの少なくとも1つが、同じであっても又は異なってもよいハロゲン原子で部分的又は完全に置換されていることを示す。「アルコキシトリアルキルシリル」という用語は、3つのアルキル基のうちの少なくとも1つが、同じであっても又は異なってもよい1つ又は複数のアルコキシ基で置換されていることを示す。「トリアルキルシリルオキシ」という用語は、酸素を介して結合したトリアルキルシリル部分を示す。

【0065】

「アルキルカルボニル」の非限定的な例には、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)CH_2CH_2C$

H₃、及びC(O)CH(CH₃)₂が含まれる。「アルコキシカルボニル」の非限定的な例には、CH₃OC(=O)、CH₃CH₂OC(=O)、CH₃CH₂CH₂OC(=O)、(CH₃)₂CHOC(=O)、及び異なるブトキシ又はペントキシカルボニル異性体が含まれる。「アルキルアミノカルボニル」の非限定的な例には、CH₃NHC(=O)、CH₃CH₂NHC(=O)、CH₃CH₂CH₂NHC(=O)、(CH₃)₂CHNHC(=O)、及び異なるブチルアミノ又はペンチルアミノカルボニル異性体が含まれる。「ジアルキルアミノカルボニル」の非限定的な例には、(CH₃)₂NC(=O)、(CH₃CH₂)₂NC(=O)、CH₃CH₂(CH₃)NC(=O)、CH₃CH₂CH₂(CH₃)NC(=O)、及び(CH₃)₂CHN(CH₃)C(=O)が含まれる。「アルコシアルキルカルボニル」の非限定的な例には、CH₃OCH₂C(=O)、CH₃OCH₂CH₂C(=O)、CH₃CH₂OCH₂C(=O)、CH₃CH₂CH₂OCH₂C(=O)、及びCH₃CH₂OCH₂CH₂C(=O)が含まれる。「アルキルチオアルキルカルボニル」の非限定的な例には、CH₃SCH₂C(=O)、CH₃SCH₂CH₂C(=O)、CH₃CH₂SCH₂C(=O)、CH₃CH₂CH₂CH₂SCH₂C(=O)、及びCH₃CH₂SCH₂CH₂C(=O)が含まれる。ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、アルキルスルホニルアミノカルボニル、アルキルチオアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキルアミノなどの用語は、同様に定義される。

10

【0066】

「アルキルアミノアルキルカルボニル」の非限定的な例には、CH₃NHCH₂C(=O)、CH₃NHCH₂CH₂C(=O)、CH₃CH₂NHCH₂C(=O)、CH₃CH₂CH₂CH₂NHCH₂C(=O)、及びCH₃CH₂NHCH₂CH₂C(=O)が含まれる。

20

【0067】

「アミド」という用語は、A-R'C=ONR''-Bを意味し、式中、R'及びR''は置換基を示し、A及びBは任意の基を示す。

【0068】

「チオアミド」という用語は、A-R'C=SNR''-Bを意味し、R'及びR''は置換基を示し、A及びBは任意の基を示す。

【0069】

置換基中の炭素原子の総数は、「C_i~C_j」の接頭辞で示され、i及びjは1~21の数字である。例えば、C₁~C₃アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからプロピルスルホニルを示し、C₂アルコシアルキルは、CH₃OCH₂を示し、C₃アルコシアルキルは、例えば、CH₃CH(OCH₃)、CH₃OCH₂CH₂、又はCH₃CH₂OCH₂を示し、C₄アルコシアルキルは、合計4つの炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を示し、例には、CH₃CH₂CH₂OCH₂、及びCH₃CH₂OCH₂CH₂が含まれる。上記の記載において、式(I)の化合物が1つ以上の複素環からなる場合、すべての置換基は、上記炭素又は窒素上の水素を置き換えることにより、任意の利用可能な炭素又は窒素を介してこれらの環に結合する。

30

【0070】

化合物が、上記置換基の数が1を超え得ることを示す下付き文字を有する置換基で置換される場合、該置換基（それらが1を超える場合）は、規定された置換基の群から独立して選択される。さらに、(R)_mの下付き文字mが例えば0~4の範囲の整数を示す場合、置換基の数は、0~4の整数から選択され得る。

40

【0071】

基が水素であり得る置換基を含む場合、この置換基を水素とした場合、その基は置換されていないことが認識される。

【0072】

本明細書の実施形態並びにその様々な特徴及び有利な詳細は、本記載における非限定的な実施形態を参照して説明される。本明細書の実施形態を不必要に不明瞭にしないために

50

、周知の構成要素及び処理技術の記載は省略されている。本明細書で使用される実施例は、本明細書の実施形態が実施され得る方法の理解を容易にし、当業者が本明細書の実施形態を実施することをさらに可能にすることを単に意図している。したがって、例は、本明細書の実施形態の範囲を限定するものとして解釈されるべきではない。

【0073】

特定の実施形態の記載は、本明細書における実施形態の一般的な性質を十分に明らかにしているため、他者は、現在の知識を適用することによって、一般的な概念から逸脱することなく、そのような特定の実施形態を様々な用途に容易に修正及び／又は適合させることができ、したがって、そのような適合及び修正は、開示された実施形態の同等物の意味及び範囲内で企図されるべきであり、かつ、企図されることを意図している。本明細書で使用される用語又は専門用語は、説明を目的とするものであり、限定することを目的とするものではないことを理解されたい。したがって、本明細書の実施形態は好ましい実施形態に関して記載しているが、当業者は、本明細書の実施形態が、本明細書に記載の実施形態の真意及び範囲内で修正して実施できることを認識するであろう。

【0074】

本明細書に含まれている任意の文書、行為、資料、デバイス、論文などの任意の議論は、開示のための関連を提供することのみを目的としている。これらの事項のいずれか又はすべてが、本出願の優先日より前に存在していたために、先行技術の基礎の一部を形成すること、又は本開示に関連する分野の一般的な知識であったことを認めるものとみなされるべきではない。

【0075】

本説明及び本説明／特許請求の範囲に記載されている数値は、本発明の重要な部分を形成し得るが、そのような数値からの逸脱は、その逸脱が本発明に開示された本発明の科学的原理と同じ科学的原理に従う場合、依然として本発明の範囲内にあるものとする。本発明の発明化合物は、適切な場合には異なる可能な異性体形態の混合物として、特に立体異性体、例えば、E及びZ、スレオ及びエリスロの混合物として、及び光学異性体の混合物としても存在し得るが、適切な場合には互変異性体の混合物として存在し得る。E及びZ異性体の両方、並びにスレオ及びエリスロ異性体、並びに光学異性体、これらの異性体の任意の所望の混合物、並びに可能な互変異性体が開示され、請求される。

【0076】

本開示の目的のための「害虫」という用語は、真菌、ストラメノパイル（卵菌）、細菌、線虫、ダニ（mite）、ダニ（tick）、昆虫、及び齧歯類を含むが、これらに限定されない。害虫はまた、ヒト又は作物、家畜、及び林業を含むヒトの関心事項に有害な動植物である。

【0077】

「植物」という用語は、本明細書では、所望の及び所望していない野生植物又は作物植物（天然に存在する作物植物を含む）などのすべての植物及び植物集団を意味すると理解される。作物植物は、従来の育種及び最適化方法、若しくは生物工学的及び遺伝子工学的な方法、又はこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であってもよく、トランスジェニック植物並びに植物育種家の権利によって保護可能及び保護不可能な植物栽培品種を含む。

【0078】

本開示の目的のために、「植物」という用語は、典型的には、ある場所で成長し、その根から水及び必要な物質を吸収し、光合成によって葉で栄養素を合成する、樹木、低木、薬草、芝生、シダ類、及びコケ類によって例示される種類の生物を含む。

【0079】

本発明の目的のための「植物」の例には、農作物、例えば、小麦、ライ麦、大麦、ライ小麦、オーツ麦、又はイネ；ビート、例えば、甜菜又は飼料用ビート；果物及び果樹の木、例えば、ナシ状果、核果、又は小軟果、例えば、リンゴ、ナシ、プラム、桃、アーモンド、サクランボ、イチゴ、ラズベリー、ブラックベリー又はグーズベリー；マメ科植物、

例えば、レンズ豆、エンドウ豆、アルファルファ、大豆；油性植物（oil plant）、例えば、菜種、カラシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、カカオ豆、トウゴマ、アブラヤシ、落花生、又は大豆；ウリ科植物（cucurbit）、例えば、カボチャ、キュウリ、又はメロン；繊維植物、例えば、綿、亜麻、ヘンプ、又はジュート；柑橘系の果物及び柑橘類の木、例えば、オレンジ、レモン、グレープフルーツ、又はマンダリン；任意の園芸植物、野菜、例えば、ほうれん草、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、ウリ、又はパプリカ；クスノキ科植物、例えば、アボカド、シナモン、又は樟脳；ウリ科植物（cucurbitaceae）；油含有植物（oleaginous plant）；エネルギー及び原材料植物、例えば、穀物、トウモロコシ、大豆、他のマメ科植物、菜種、サトウキビ、又はアブラヤシ；タバコ；ナッツ；コーヒー；茶；カカオ；バナナ；コショウ；ブドウの木（食用ブドウ及びグレープジュース、ブドウワイン）；ホップ；芝；甘葉（ステビアとも称される）；天然ゴム植物又は観賞用植物及び森林植物、例えば、花、低木、広葉樹、又は常緑樹、例えば、針葉樹；植物繁殖材料、例えば、種子、及びこれらの植物の作物材料が含まれるが、これらに限定されない。

【0080】

好ましくは、本発明の目的のための植物には、穀類、トウモロコシ、米、大豆、及び他のマメ科植物、果実及び果実の木、ブドウ、ナッツ及びナッツの木、柑橘類及び柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科植物、油含有植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、サトウキビ、甜菜、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、コショウ、及び野菜、観賞用植物、任意の草花栽培植物、並びにヒト及び動物の使用のための他の植物が含まれるが、これらに限定されない。

【0081】

「植物部分」という用語は、地上及び地下の植物のすべての部分及び器官を意味すると理解される。本開示の目的のために、植物部分という用語は、挿し木(cutting)、葉、小枝、塊茎、花、種子、枝、直根、側根、根毛、根尖、根冠、根茎を含む根、接ぎ木 (slip)、新芽、果実、果実体、樹皮、茎、芽、腋芽、分裂組織、節及び節間を含むが、これらに限定されない。

【0082】

「その場所」という用語は、土壌、植物又は植物部分の周囲、及び植物又は植物部分を播種／植える前、最中、又は後に使用される機器又は器具を含む。

【0083】

本開示の化合物又は任意選択的に他の適合性化合物を含む組成物中の本開示の化合物の植物若しくは植物材料又はその場所への適用には、噴霧、コーティング、浸漬、燻蒸、含浸、注入、及び散粉（dusting）を含むがこれらに限定されない当業者に既知の技術による適用が含まれる。

【0084】

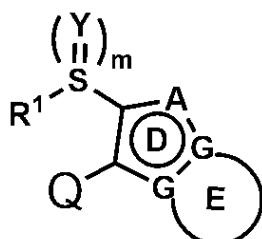
「適用される」という用語は、含浸を含む、植物又は植物部分に物理的又は化学的に付着させることを意味する。

【0085】

一実施形態では、本発明は、式（I）の化合物：

【0086】

【化2】



10

20

30

40

50

【0087】

式 (I)

【0088】

〔式中、

R^1 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、及び $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキルからなる群から選択され、

Y は、独立して、 O 又は NR^Y から選択され、

R^Y は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_2 \sim C_4$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキル、及び $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキルからなる群から選択され、

A は、 N 又は CR^2 を表し、

G は、 N 又は C を表し、ただし、両方の G は、同時に窒素ではなく、

R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $P(=O)(OR')_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ - アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ - ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{2a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^2 の環状基は、1つ又は複数の R^{2b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{2a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ - アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ - ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{2b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $Si(R')_3$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、及び $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ からなる群から選択され、或いは

2つの R^{2a} 又は2つの R^{2b} 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、又は C 、 N 、 O 、 S からなる群から選択される更なる原子と一緒に、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_{0 \sim 2}$ 、及び $Si(R')_2$ からなる群から選択される1～3つの環員を任意選択的に含んで、3～7員環を形成してもよく、該3～7員環は、その部分について1つ又は複数の R^{2ab} 基で置換されていてもよく、

R^{2ab} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、 OR^4 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ - アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ - ヘテロシクリルからなる群から選択され、

Q は、1つ又は複数の R^3 基で任意選択的に置換されていてもよい、部分飽和又は不飽和の5～12員の複素環系を表し、前記複素環系は、非置換ベンゾチアゾリル及び非置換 N -メチルベンズイミダゾリルを表さず、

R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ - シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4 = NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9 = NR^{10}$ 、 $N = S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $P(=O)(OR')_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ - アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ - アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$

10

20

30

40

50

ーヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{3a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^3 の環状基は、1つ又は複数の R^{3b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{3a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アララルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{3b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $C(R')_2-NR^5R^6$ 、 $C(R')_2-OR^4$ 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アララルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

2つの R^{3a} 又は2つの R^{3b} 置換基は、それらが結合している原子と一緒に、又はC、N、O、Sからなる群から選択される更なる原子と一緒に、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 、及び $Si(R')_2$ からなる群から選択される1～3つの環員を任意選択的に含んで、3～7員環を形成してもよく、該3～7員環は、その部分について1つ又は複数の R^{3ab} 基で置換されていてもよく、 R^{3ab} は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ からなる群から選択され、

2つの R^3 は、それらが結合している原子と一緒に、又はC、N、O、Sからなる群から選択される更なる原子と一緒に、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ 、及び $Si(R')_2$ からなる群から選択される1～3つの環員を任意選択的に含んで、3～7員環を形成してもよく、該3～7員環は、その部分についてハロゲン、シアノ、 R^{3c} 、 OR^{3c} 、 SR^{3c} 、 NR^{3c}_2 、 $Si(R^{3c})_3$ 、 $COOR^{3c}$ 、及び $CONR^{3c}_2$ からなる群から選択される1つ又は複数の基で置換されていてもよく、

R^{3c} は、水素、ハロゲン、直鎖又は分枝鎖 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、及び環状 $C_3 \sim 8$ -アルキルからなる群から選択され、 R^{3c} の各基は、1つ又は複数のハロゲンで任意選択的に置換されており、

環Eは、環Dと縮合した5員又は6員の複素環を表し、環Eは、1つ又は複数の R^{11} 基によって任意選択的に置換されており、

R^{11} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $P(=O)(OR')_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アララルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{11a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^{11} の環状基は、1つ又は複数の R^{11b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{11a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アララルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{11b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 $C(R')_2-NR^5R^6$ 、 $C(R')_2-OR^4$ 、 $CR^4=NR^5$ 、 NR^5R^6 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $S(O)_{0 \sim 1}R^9=NR^{10}$ 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$

10

20

30

40

50

－アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^4 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 $S(O)_2R^7$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、任意選択的に R^{4a} で置換されていてもよく、 R^4 の環状基は、1つ又は複数の R^{4b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{4a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{4b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^5 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR^4 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R^7$ 、 $C(=O)R^8$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、 R^{5a} で任意選択的に置換されていてもよく、 R^5 の環状基は、1つ又は複数の R^{5b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{5a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{5b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $Si(R')_3$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ －シクロアルキル、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 NR^5R^6 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{7a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^7 の環状基は、1つ又は複数の R^{7b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{7a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{7b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ －ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ －ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ －シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(\Theta)_2R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ －アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ －アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ －ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^8 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ －アルキル、 $C_2 \sim C_6$ －アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ －アルキニ

ル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR^4 、 NR^5R^6 、 $N=S(O)_{0 \sim 1}(R^9)_2$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数の R^{8a} 基で任意選択的に置換されていてもよく、 R^8 の環状基は、1つ又は複数の R^{8b} 基で任意選択的に置換されていてもよく、

R^{8a} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(O)_{0 \sim 2}R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^{8b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 OR' 、 $NR'R''$ 、 $S(O)_{0 \sim 2}R'$ 、 $C(=O)R'$ 、 $C_6 \sim C_{10}$ -アリール、 $C_7 \sim C_{14}$ -アラルキル、及び $C_3 \sim C_{10}$ -ヘテロシクリルからなる群から選択され、

R^9 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

R^{10} は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $Si(R')_3$ 、 $S(O)_{0 \sim 2}R^7$ 、及び $C(=O)R^8$ からなる群から選択され、

R' は、ハロゲン、シアノ、 R'' 、 OR'' 、 $N(R''S'(O))_{0 \sim 2}R''$ 、 $C(=O)R''$ 、 $C(=O)OR''$ 、及び $C(=O)N(R''R^8)$ からなる群から選択され、

R'' は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、及び $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキルからなる群から選択され、各々は、ハロゲンで任意選択的に置換されていてもよく、

$R^1 \sim R^{11}$ 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2ab} 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3ab} 、 R^{3c} 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{8a} 、及び R^{8b} の各基は、ハロゲン、シアノ、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $N(R'_2)COOR'$ 、及び $CON(R'_2)$ からなる群から選択される1つ又は複数の基で任意選択的に置換されていてもよく、

「m」は、0～2の範囲の整数である]

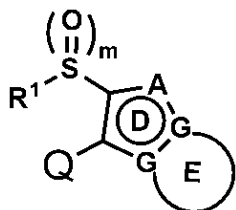
又は農薬的に許容されるその塩、異性体／構造異性体、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、互変異性体、多形体、金属錯体又はそれらのN-オキシドを提供する。

【0089】

別の実施形態では、式(I)の化合物は、式(IA)の化合物：

【0090】

【化3】



【0091】

式(IA)

【0092】

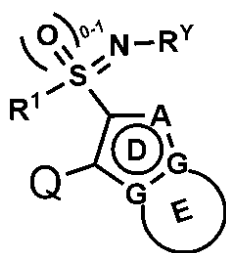
によって表される。

【0093】

さらに別の実施形態では、式(I)の化合物は、式(IB)の化合物：

【0094】

【化4】



10

【0095】

式 (I B)

【0096】

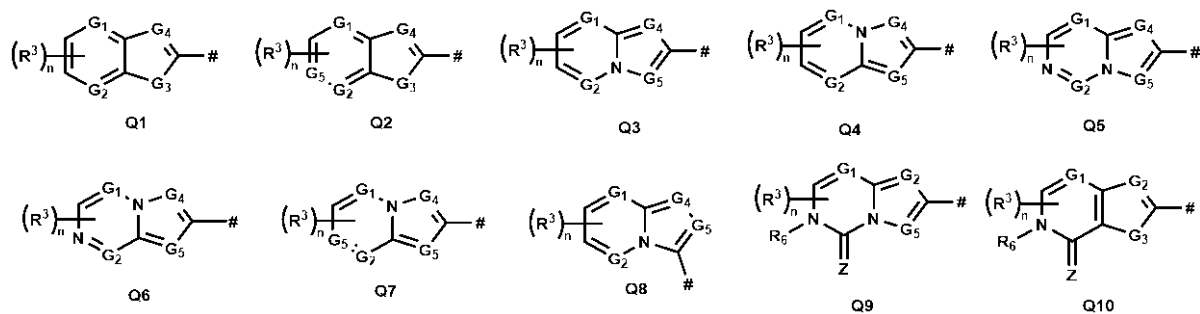
によって表される。

【0097】

一実施形態では、Qは、式Q1～Q10：

【0098】

【化5】



20

【0099】

からなる群から選択され、式中、 G_1 、 G_2 、 G_4 、及び G_5 は、独立してN又は CR^3 を表し、 G_3 は NR^6 であり、O又はSであり、ZはO又はSであり、「n」は0～4の範囲の整数である。

30

【0100】

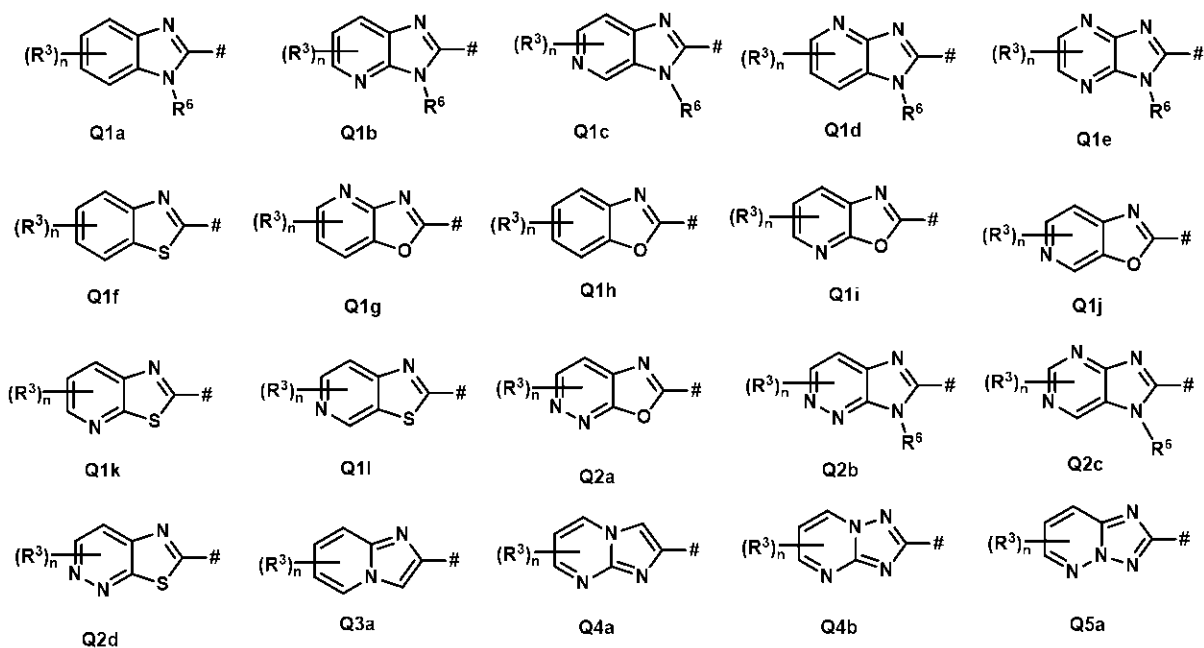
好ましい実施形態では、Qは、Q1a～Q10b：

【0101】

40

50

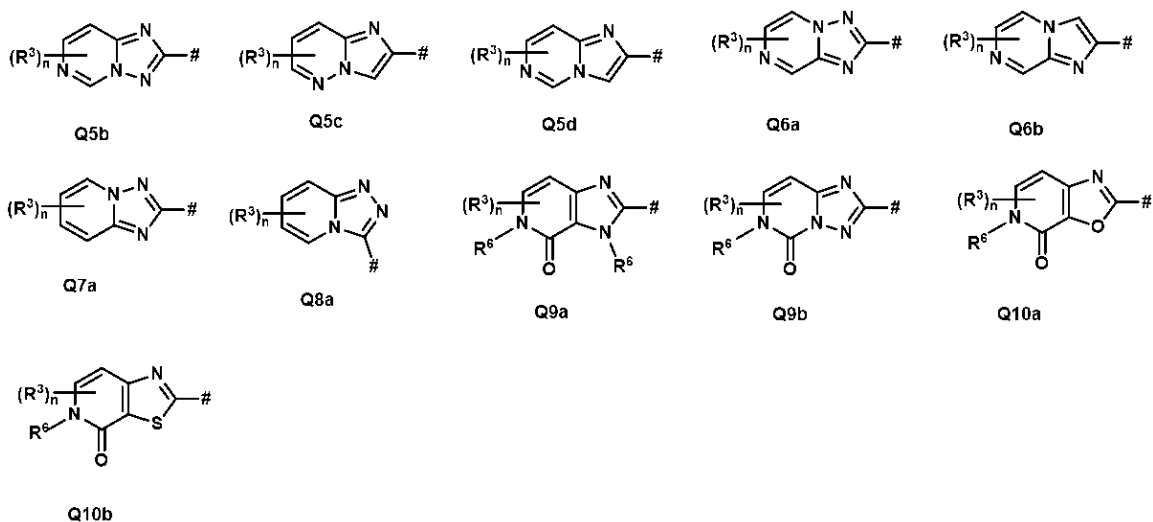
【化 6】



10

【 0 1 0 2】

【化 7】



20

30

【 0 1 0 3】

からなる群から選択され、式中、# は、環 D への結合点を示し、 R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、及び環状 $C_3 \sim C_{10}$ -アルキルからなる群から選択され、各 R^6 基は、1つ又は複数のハロゲンで任意選択的に置換されており、「n」は、0～4の範囲の整数である。

40

【 0 1 0 4】

一実施形態では、本発明は、少なくとも1つの窒素が縮合環系 DE に存在する式 (I) の化合物を提供する。

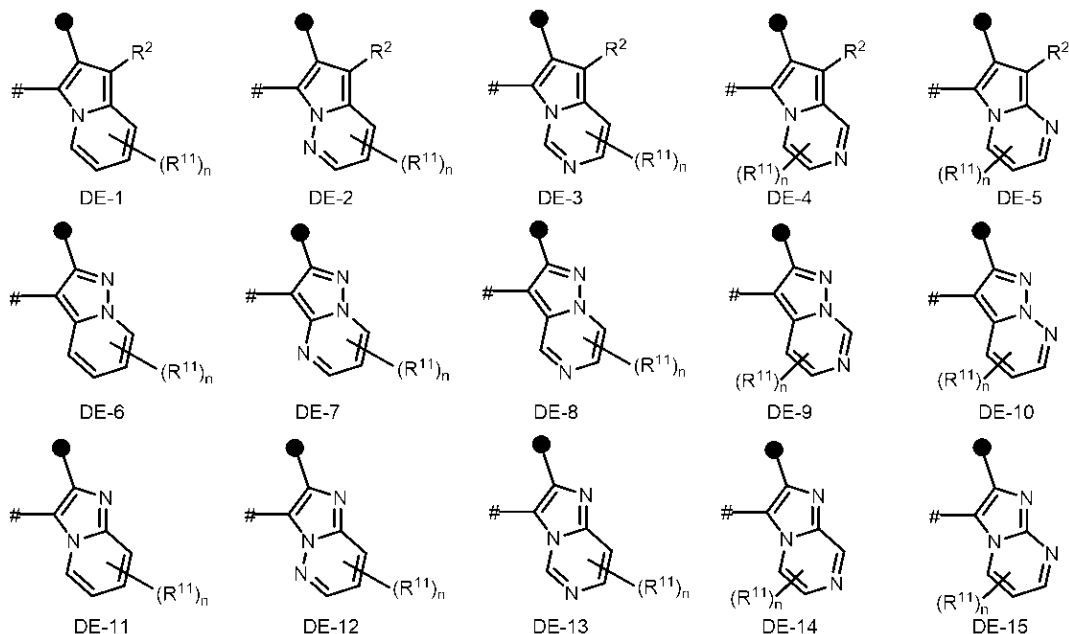
【 0 1 0 5】

別の実施形態では、縮合環系 DE は、DE-1～DE-15：

【 0 1 0 6】

50

【化 8】



10

【0107】

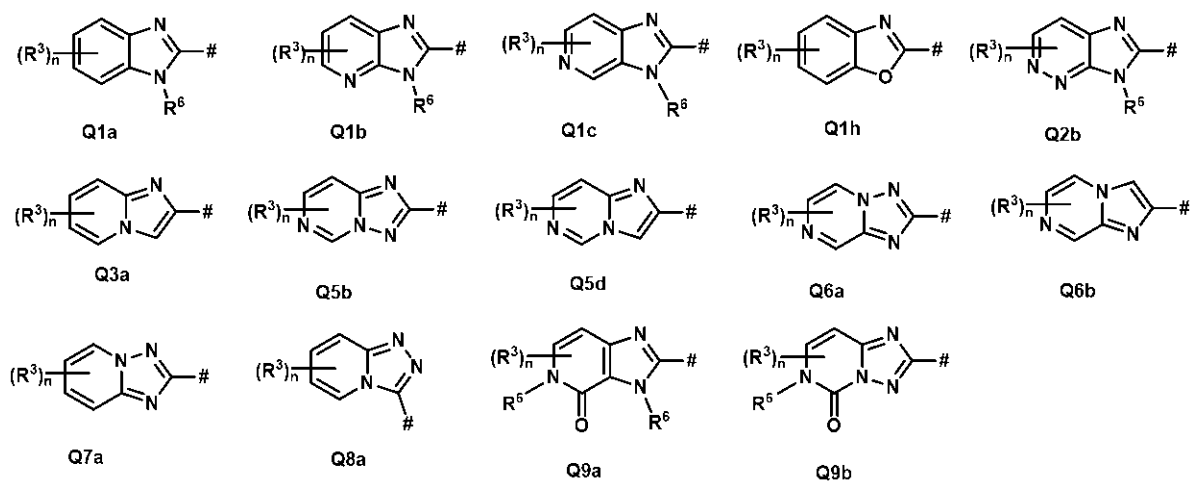
からなる群から選択され、式中、#は、環Qへの結合点を示し、●は、基-S(Y)_mR¹への結合点を示す。

【0108】

好ましい実施形態では、本発明は、QがQ1a、Q1b、Q1c、Q1h、Q2b、Q3a、Q5b、Q5d、Q6a、Q6b、Q9a、Q9b、Q7a、又はQ8a；

【0109】

【化 9】



30

【0110】

から選択される式(I)の化合物を提供し、

【0111】

式中、#は、環Dへの結合点を示し、

R³は、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル、及びS(Y)_{0~2}R⁷からなる群から選択され、

R⁶は、水素、C₁-C₆-アルキル及びC₃~C₁₀-シクロアルキルからなる群から選択され、

R⁷は、C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C

40

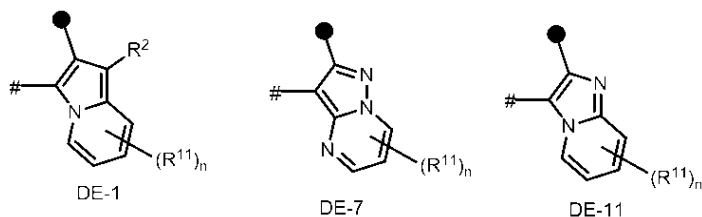
50

1～C₆－ハロアルキル、C₂～C₆－ハロアルケニル、C₃～C₈－シクロアルキルからなる群から選択され、

縮合環DEは、

【0112】

【化10】



10

【0113】

からなる群から選択され、

【0114】

式中、#は、環Qへの結合点を示し、●は、基-S(Y)_mR¹への結合点を示し、

R²は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆－アルキル、C₁～C₆－ハロアルキル、C₃～C₈－シクロアルキル、C₆～C₈－アリール、C₇～C₉－アラルキル及びC₃～C₆－ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数のR^{2a}基で任意選択的に置換されていてもよく、R²の環状基は、1つ又は複数のR^{2b}基で任意選択的に置換されていてもよく、

20

「m」は、0～2の範囲の整数であり、

「n」は、0～4の範囲の整数であり、

R¹¹は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆－アルキル、C₁～C₆－ハロアルキル、C₃～C₈－シクロアルキル、OR⁴、NR⁵R⁶、C₆～C₁₀－アリール、C₇～C₁₄－アラルキル、及びC₃～C₁₀－ヘテロシクリルからなる群から選択され、各脂肪族基は、1つ又は複数のR^{11a}基で任意選択的に置換されていてもよく、R¹¹の環状基は、1つ又は複数のR^{11b}基で任意選択的に置換されていてもよい。

【0115】

別の好ましい実施形態では、式(I)の化合物は、

30

2－(1－(3,5－ジクロロフェニル)－2－(エチルスルホニル)インドリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

2－(2－(エチルスルホニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

6－(1－ブromo－2－(エチルスルホニル)インドリジン－3－イル)－7－メチル－3－(トリフルオロメチル)－7H－イミダゾ[4,5-c]ピリダジン；

2－(2－(エチルスルホニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン－3－イル)－5－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール；

2－(2－(エチルスルホニル)－7－(トリフルオロメチル)インドリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

40

2－(8－(3,5－ジクロロフェニル)－2－(エチルスルホニル)インドリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

2－(1－(3,5－ジクロロフェニル)－2－(エチルスルホニル)－7－(トリフルオロメチル)インドリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

2－(6－(3,5－ジクロロフェニル)－2－(エチルスルホニル)インドリジン－3－イル)－3－メチル－6－(トリフルオロメチル)－3H－イミダゾ[4,5-b]ピリジン；

50

2-(2-(エチルスルホニル)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 -
((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール ;

2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル
- 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン ;

2-(2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

2-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;

2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;

2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ[

50

- 1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
- 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
- 2-(7-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 5-(トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ [d] オキサゾール;
- 2-(2-(エチルチオ)-5-フェニルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(2-(エチルチオ)-5-フェニルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
- 2-(2-(エチルスルホニル)-5-フェニルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-

10

20

30

40

50

50

2-(2-(エチルチオ)-6-フェニルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)
)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
2-(5-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]
ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ
[4,5-b]ピリジン;
2-(2-(エチルスルホニル)-6-フェニルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3
-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピ
リジン;
2-(5-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5
-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミ
ダゾ[4,5-b]ピリジン;
2-(5-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]
ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[
4,5-c]ピリジン;
2-(5-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5
-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミ
ダゾ[4,5-c]ピリジン;
2-(6-ブromo-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)
-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;
2-(6-ブromo-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-
イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリ
ジン;
2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]
ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[
4,5-b]ピリジン;
2-(6-(4-クロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミ
ジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5
-c]ピリジン;
2-(6-(4-クロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]
ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[
4,5-c]ピリジン;
2-(2-(エチルチオ)-5-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フ
ェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフル
オロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5
-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミ
ダゾ[4,5-b]ピリジン;
2-(2-(エチルチオ)-5-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フ
ェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフル
オロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;
2-(2-(エチルスルホニル)-5-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキ
シ)フェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(ト
リフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン;
2-(2-(エチルスルホニル)-5-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキ
シ)フェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(ト
リフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン;
2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]
ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[
4,5-c]ピリジン;
2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5

10

20

30

40

50

- a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミ
 ダゾ [4, 5-c] ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ) - 6-(4-(トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-
 イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル) - 6-(4-(トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラ
 ゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル)
 - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(5-(4-クロロフェニル) - 2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミ
 ジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5
 -b] ピリジン;
 2-(5-(4-クロロフェニル) - 2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミ
 ジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5
 -c] ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ) - 6-(4-(トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-
 イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ) - 7-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フ
 ェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(5-(4-クロロフェニル) - 2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a]
 ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(5-(4-クロロフェニル) - 2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a]
 ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル) - 7-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル) - 7-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
 3-(7-(3, 5-ジクロロフェニル) - 2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a]
 ピリミジン-3-イル) - 7-(トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [4
 , 3-a] ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ) - 7-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フ
 ェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン;
 3-(7-(3, 5-ジクロロフェニル) - 2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5
 -a] ピリミジン-3-イル) - 7-(トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾ
 ロ [4, 3-a] ピリジン;
 2-(2-(エチルチオ) - 6-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フ
 ェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(2-(エチルスルホニル) - 6-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフル
 オロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン;
 2-(7-(3-クロロフェニル) - 2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミ
 ジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5
 -b] ピリジン;

10

20

30

40

50

2 - (7 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] プリジン;

2 - (7 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

2 - (エチルチオ) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

2 - (エチルスルホニル) - 3 - (1 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] プリジン;

3 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - a] プリジン;

3 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - a] プリジン;

2 - (7 - (2, 3 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (7 - (2, 3 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] プリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] プリ

10

20

30

40

50

ミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4,

50

5-c] ピリジン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 7-メチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン；

2- (2- (エチルチオ) - 7- (3- (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン；

(7- (3, 5-ジクロロフェニル) - 3- (3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-2-イル) (エチル) (イミノ) - 6-スルファノン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 7- (3- (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 7- (3-フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン；

2- (2- (エチルチオ) - 7-メチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン；

2- (7- (3-クロロ-4-フルオロフェニル) - 2- (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン；

2- (2- (エチルチオ) - 5, 7-ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 5, 7-ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン；

2- (エチルチオ) - 3- (3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-7 (4H) - オン；

2- (7-プロモ-2- (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン；

2- (エチルスルホニル) - N-メチル-3- (7- (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c]] ピリミジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-7-アミン；

6- (8- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) - 2- (エチルスルホニル) インドリジン-3-イル) - 7-メチル-3- (トリフルオロメチル) - 7H-イミダゾ [4, 5-c]] ピリダジン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 7- (5-メチル-3- (トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b]] ピリジン；

2- (エチルチオ) - N-メチル-3- (3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b]] ピリジン-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-7-アミン；

2- (2- (エチルスルホニル) - 7- (3-フルオロフェノキシ) ピラゾロ [1, 5-a]] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b]] ピリジン；

6- (8- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) - 2- (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2-a]] ピリジン-3-イル) - 7-メチル-3- (トリフルオロメチル) - 7H-イミダゾ [4, 5-c]] ピリダジン；

10

20

30

40

50

2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピラジン;

4 - (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン - 6 - イル) インドリジン - 8 - イル) - 2 - フルオロベンゾニトリル;

2 - (8 - (シクロプロピルメチル) - 2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (7 - (4 - クロロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (7 - シクロプロピル - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピラジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン;

4 - (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - イル) モルホリン;

2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

6 - (1 - ブロモ - 2 - (エチルスルホニル) - 8 - メチルインドリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン;

6 - (8 - ブロモ - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 7 - メチル - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - メトキシピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (メチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン;

2 - (エチルスルホニル) - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 (4

10

20

30

40

50

H) -チオン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン；

2 - (7 - エトキシ - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピラジン；

ジエチル ((2 - (エチルスルホニル) - 3 - (6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピラジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - イル) イミノ) - 16 - スルファノン；

2 - (エチルスルホニル) - N, N - ジメチル - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 8 - アミン；

6 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン；

2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3, 5 - ジメチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3, 5 - ジヒドロ - 4 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 4 - オン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3, 5 - ジメチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3, 5 - ジヒドロ - 4 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 4 - オン；

2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピラジン；

2 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン；

2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 5 (6 H) - オン；

2 - (7 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 5 (6 H) - オン；

2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン；

エチル (3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 2 - イル) (メチルイミノ) - 16 - スルファノンから選択される。

【0116】

本発明の化合物は、1つ又は複数の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体、及び幾何異性体が含まれる。当業者は、1つの立体異性体が、他の立体異性体に対して濃縮された場合又は他の立体異性体から分離された場合には、より活性であり得、及び／又は有益な効果を示し得ることを理解するであろう。さらに、当業者は、上記立体異性体を分離、濃縮、及び

10

20

30

40

50

／又は選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個々の立体異性体として、又は光学的に活性な形態として存在し得る。

【0117】

式（I）の化合物がカチオン性であるか、又はカチオンを形成することができる場合の塩のアニオン部分は、無機又は有機であり得る。或いは、式（I）の化合物がアニオン性であるか、又はアニオンを形成することができる場合の塩のカチオン部分は、無機又は有機であり得る。塩の無機アニオン部分の例には、塩化物、臭化物、ヨウ化物、フッ化物、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩、亜硝酸塩、炭酸水素塩、及び硫酸水素塩が含まれるが、これらに限定されない。塩の有機アニオン部分の例には、ギ酸塩、アルカン酸塩、炭酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、トリクロロ酢酸塩、プロピオン酸塩、グリコール酸塩、チオシアン酸塩、乳酸塩、コハク酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、桂皮酸塩、シュウ酸塩、アルキル硫酸塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルスルホン酸塩、アリールニルスルホン酸塩、アルキルリン酸塩、アリールリン酸塩、アリールニリン酸塩、p-トールエンスルホン酸塩、及びサリチル酸塩が含まれるが、これらに限定されない。塩の無機カチオン部分の例には、アルカリ金属及びアルカリ土類金属が含まれるが、これらに限定されない。塩の有機カチオン部分の例には、ピリジン、メチルアミン、イミダゾール、ベンズイミダゾール、ヒチジン、ホスファゼン、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、コリン、及びトリメチルアミンが含まれるが、これらに限定されない。

10

【0118】

式（I）の化合物の金属錯体中の金属イオンは、特に、第2主族の元素、特にカルシウム及びマグネシウムのイオン、第3及び第4主族の元素、特にアルミニウム、スズ、及び鉛のイオンであり、また、第1～第8遷移族の元素、特にクロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛などのイオンである。第4周期及び第1から第8遷移基族の元素の金属イオンが特に好ましい。ここで、金属は、該金属が取ることができる様々な原子価で存在することができる。

20

【0119】

一実施形態では、本発明は、式（I）の化合物、その農業的に許容される塩、金属錯体、構造異性体、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、キラル異性体、アトロプ異性体、配座異性体、回転異性体、互変異性体、光学異性体、多形体、幾何異性体、又はN-オキシド、及び賦形剤、不活性担体、又は界面活性剤、添加剤、固体希釈剤、液体希釈剤などの他の必須成分を含むその組成物を提供する。

30

【0120】

式（I）の化合物（そのすべての立体異性体、N-オキシド、及び塩を含む）は、通常、2つ以上の形態で存在し、したがって、式（I）は、式（I）が表す化合物のすべての結晶形態及び非晶質形態を含む。非晶質形態には、ワックス及びガムなどの固体である実施形態、並びに溶液及び熔融物などの液体である実施形態が含まれる。結晶形態には、本質的に単結晶型を表す実施形態、及び多形体の混合物（すなわち、異なる結晶型）を表す実施形態が含まれる。「多形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化することができる化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中で分子の異なる配置及び／又はコンフォメーションを有する。多形体は、同じ化学組成を有することができるが、格子中で弱く又は強く結合することができる共結晶化された水又は他の分子の存在又は非存在により、組成において異なることもできる。多形体は、結晶の形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性（suspensibility）、溶解速度、及び生物学的利用可能性などの化学的、物理的、及び生物学的特性において異なることができる。当業者は、式（I）によって表される化合物の多形が、別の多形又は式（I）によって表される同じ化合物の多形の混合物と比較して有益な効果（例えば、有用な製剤の調製のための適合性、改善された生物学的性能）を示すことができることを理解するであろう。式（I）によって表される化合物の特定の多形の調製及び単離は、例えば、選択された溶媒及び温度を使用する結晶化を含む、当業者に既知の方法によって達成することができる。

40

【0121】

50

一実施形態では、本発明は、式（Ⅰ）の化合物又は農業的に許容される塩を調製するためのプロセスを提供する。

【0122】

式（Ⅰ）の化合物は、本明細書に記載のスキーム1～23／実施例に従って調製することができる。

【0123】

式（Ⅰ）の化合物、より具体的には、QがQ1又はQ2である式（Ⅰa）の化合物又は式（Ⅰb）の化合物を調製するためのプロセスは、式（2）の化合物と、MがO、S、N R'である式（3）又は（4）の化合物とを反応させて、式（Ⅰa）及び（Ⅰb）の化合物を得ることを含む。

【0124】

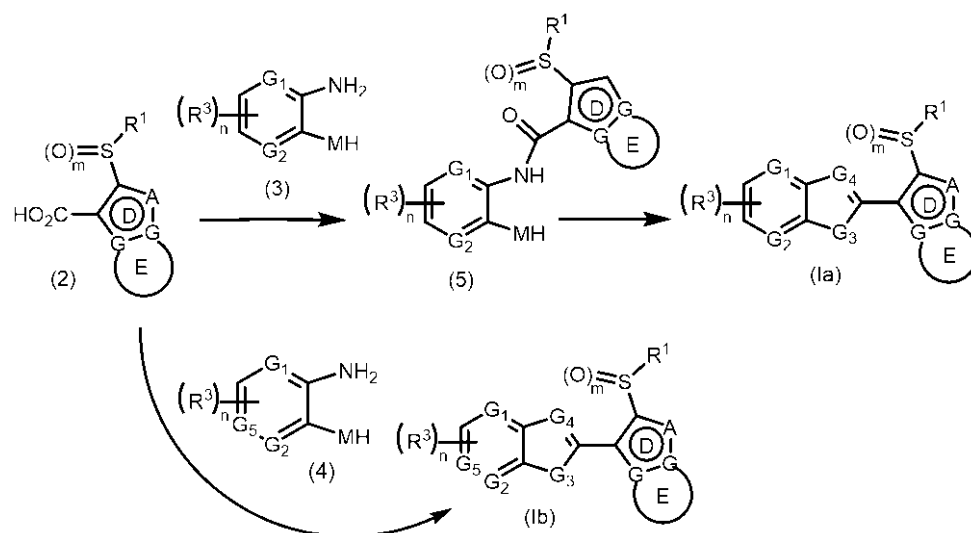
このプロセスをスキーム1に纏める。

【0125】

スキーム：1

【0126】

【化11】



【0127】

式中、R¹、R³、A、G、G₁、G₂、G₃、G₄、G₅、E、m及びnは、上記の意味を有する。

【0128】

式（3）及び式（4）の化合物は、商業的に入手可能であるか、又はUS 2003 69 257、WO 2006 65 703、WO 2009 13 1237、WO 2010 12 598 5、WO 2011 04 3404、WO 2011 04 0629、WO 2012 08 6848、WO 2013 01 8928、及びWO 2015 00 07 15に既知である方法又はそれらにおいて類似して記載されている方法を使用して調製することができる。

【0129】

スキーム1では、式（2）の化合物に存在するカルボン酸基を、ハロゲン化アシル、混合無水物、アシルアジド、N-アシルベンゾトリアゾール、活性エステルなどのより反応性の高い官能基に変換するか、ビス（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）ホスフィン酸クロリド（BOP-Cl）、ジシクロヘキシルカルボジイミド（DCC）、又は1-エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド（EDC）などのペプチドカップリング試薬によりインサイチューで活性化し、続いてジクロロメタン、ジクロロエタン、N,N-ジメチルアセトアミド、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、又はそれらの混合物などの溶媒中で式（3）の化合物とアミド結合を形成することにより、式（5）の化合物を得ることができる。トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジン

、N-メチルピロリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンなどの有機非求核塩基を使用してもよい。反応は、約0℃～約150℃の範囲の温度で行うことができる。

【0130】

式(5)の化合物を、酸触媒、例えば、メタンスルホン酸又はパラトルエンスルホン酸の存在下、N-メチルピロリジンなどの不活性溶媒中で、約25℃～約185℃の範囲の温度で、従来条件に従って又はマイクロ波条件下で脱水することにより、式(Ia)の化合物に変換することができる。このようなプロセスは、WO2009131237、WO2010125985、WO2011043404、WO2011040629、WO2012086848、WO2013018928、WO2015000715、及びWO2015121136で以前に記載されている。

10

【0131】

或いは、式(5)の化合物を、当業者に周知である光延条件下、アゾジカルボン酸ジイソプロピル、トリフェニルホスフィンを使用して、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどの不活性溶媒中で、約25℃～約50℃の範囲の温度で、Mが酸素である式(Ia)の化合物に変換することができる。このプロセスは、WO2009131237で以前に記載されている。

【0132】

式(2)の化合物と式(4)の化合物との反応においてスキーム1の方法を適用することにより、式(Ib)の化合物を得ることができる。

20

【0133】

式(Ic及びId)の化合物によって表される式(I)の化合物の合成のためのプロセスをスキーム2に示す。式(Ic)又は(Id)の化合物は、式(6)の化合物と式(3)又は(4)の化合物とを反応させて式(7)又は(8)の化合物を得ることによって調製することができる。さらに、式(7)及び(8)の化合物(式中、Xはハロゲン、例えば、フッ素、塩素、又は臭素)を、任意選択的に好適な塩基、例えば、アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム、又は水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、或いは水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物の存在下、不活性溶媒中で、約25℃～約110℃の範囲の温度で、式(9)の化合物又はM₁が例えばナトリウム又はカリウムである式(10)の化合物と反応させて、式(Ic)又は(Id)の化合物を得ることができる。

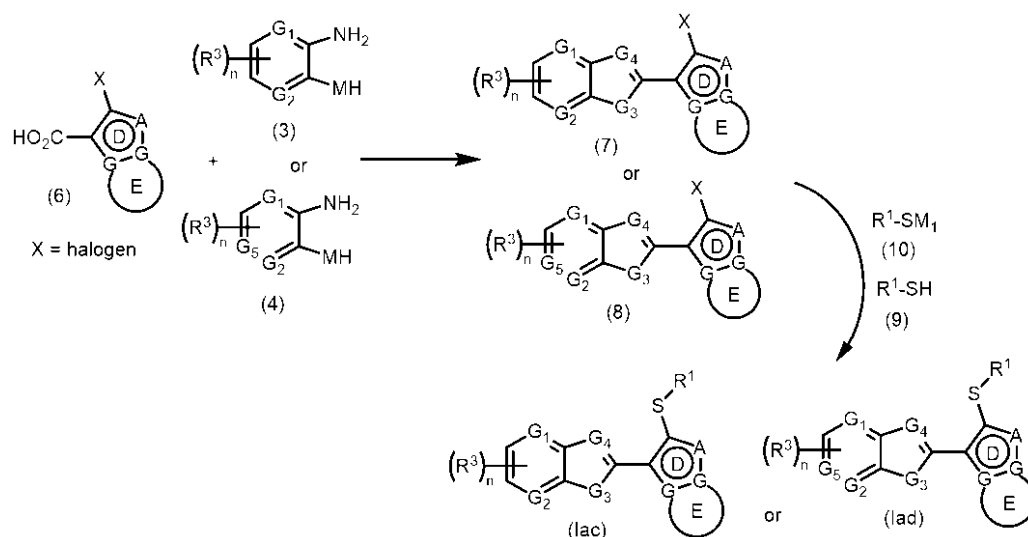
30

【0134】

スキーム：2

【0135】

【化12】



40

50

【0136】

式中、 R^1 、 R^3 、 A 、 G 、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 E 、 m 及び n は、上記の意味を有する。

【0137】

或いは、上記の反応はまた、Tetrahedron, 2005, 61, 5253に記載されるように、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)などのパラジウム触媒の存在下で、キサントホスなどの配位子の存在下、不活性溶媒中、例えば、トルエン、キシレン中で、約100℃～約150℃の範囲の温度で行うことができる。 $Y=O$ であり、 $m=1$ (スルホキシド)であり、及び／又は $m=2$ (スルホン)である式(I)の化合物は、当業者に周知の好適な酸化剤及び条件を適用しながら、式(Ic)及び(I d)の対応する硫化物化合物を酸化することによって得ることができる。酸化剤、例えば、 m -クロロペルオキシ安息香酸(mCPBA)、過酸化水素／氷酢酸、過酸化水素／トリフルオロ酢酸、過酸化水素／過マンガン酸カリウム、過酸化水素／ p -トルエンスルホンイミダゾール、尿素過酸化水素／トリフルオロ酢酸、オキシソ、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム、及び他の有機過酸などをこのために使用することができる。この反応で使用される溶媒の例には、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素、メタノール及びエタノールなどのアルコール、及びそれらの混合物が含まれる。

10

【0138】

$m=1$ 又は2であり、 $Y=NR^Y$ であり、及び／又は $Y=O$ である式(I)の化合物は、Chem. Commun., 2017, 53, 2064-2067; Tetrahedron Lett. 2005, 46, 8007-8008及びWO2015071180 A1に記載される類似の手順を使用して、式(Ic)及び(I d)の対応する硫化物化合物のスルホキシム化(sulfoximination)／スルフィリム化(sulfilimination)によって得ることができる。

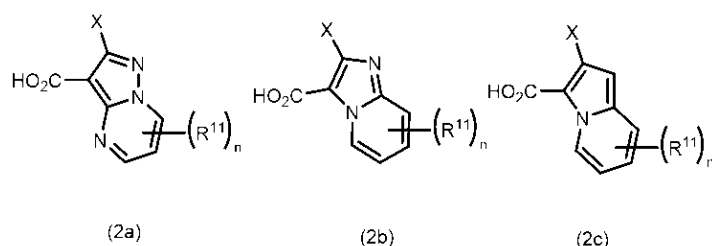
20

【0139】

式(2)の化合物は、式(2a)、(2b)、及び(2c)からなる群から選択される。

【0140】

【化13】



30

$X = \text{Halogen, } -S(O)_mR_1$
 $n = 0-2$

【0141】

式中、 R^1 及び R^{11} は、上記と同じ意味を有する。

40

【0142】

式(2a)、(2b)、及び(2c)の化合物の合成をスキーム3～スキーム9に記載する。

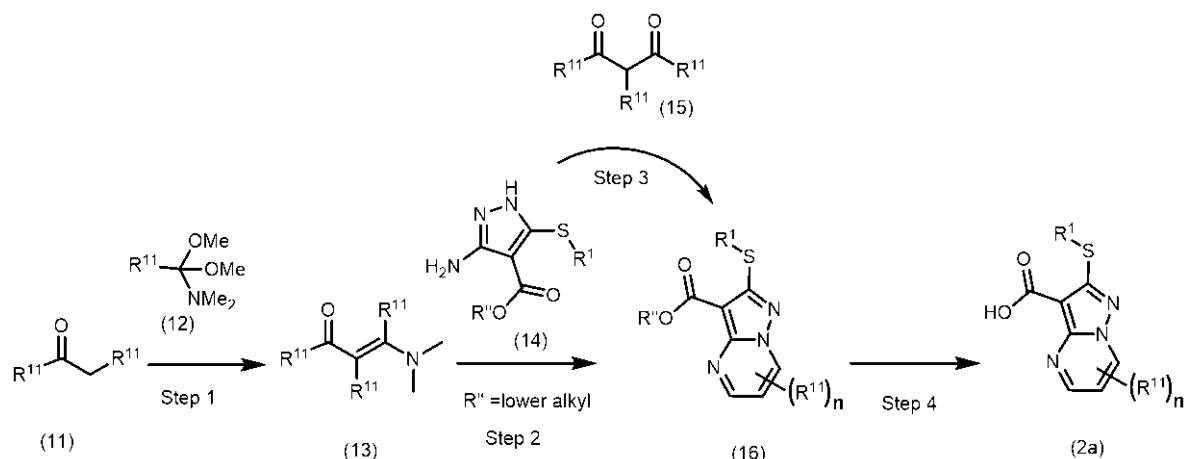
【0143】

スキーム：3

【0144】

50

【化 1 4】



10

【0 1 4 5】

式中、 R^1 、 R^{11} 、及び n は、上記の意味を有する。

【0 1 4 6】

式 (11) の化合物と式 (12) の化合物との反応を好適な溶媒中で $50 \sim 200^\circ\text{C}$ の範囲の温度で行って、式 (13) の二求電子性 (dielectrophilic) 化合物を得ることができる。溶媒の例には、 N,N -ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、1,4-ジオキサン、1,2-ジクロロメタン、トルエン、キシレンなどが含まれるが、これらに限定されない。

20

【0 1 4 7】

ピリジン形成工程である工程 2 において、式 (14) のピラゾール誘導体化合物は、塩基の存在下又は非存在下で式 (13) の二求電子性 (dielectrophilic) 化合物又は式 (15) の 1,3-ジケトン化合物 (例えば、1,3-ジアルデヒド又は 3-(ジアルキルアミノ)-プロパー-2-エナール) で処理すると環化縮合反応を行って、式 (16) の二環式化合物を得ることができる。式 (14) の化合物の調製は、文献に記載されている (*Acta Chimica Sinica* 2003, 63, 855; *Organic & Biomolecular Chemistry* 2010, 8, 3394)。塩基の例には、ピペリジン、モルホリン、 N -メチルピペラジン、ジエチルアミン、トリエチルアミンなどが含まれるが、これらに限定されない。溶媒の例には、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコールなどが含まれるが、これらに限定されない。反応は、約 $50^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ の範囲の温度で行うことができる。

30

【0 1 4 8】

式 (13) 及び (15) の化合物に存在する求電子中心の一方又は両方が保護/マスクされている場合 (例えば、アルデヒドがケタールとしてマスクされている)、酸の存在下、溶媒中で縮合を行うことができる。酸の例には、反応性官能基を放出させる酢酸、スルホン酸 (例えば、PTSA)、硫酸、塩酸が含まれる。溶媒の例には、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコールなどが含まれるが、これらに限定されない。反応は、約 $0^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ の範囲の温度で行うことができる。式 (16) の化合物の加水分解を、テトラヒドロフラン、水、メタノール、エタノール又はそれらの混合物などの溶媒中で、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、ビス(トリブチルスズ)オキシドなどの塩基を使用することによって達成して、式 (2a) の化合物を得ることができる。反応は、約 $50^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ の範囲の温度で行うことができる。

40

【0 1 4 9】

或いは、式 (2a) の化合物は、以下のスキーム 4 によって調製することもできる。

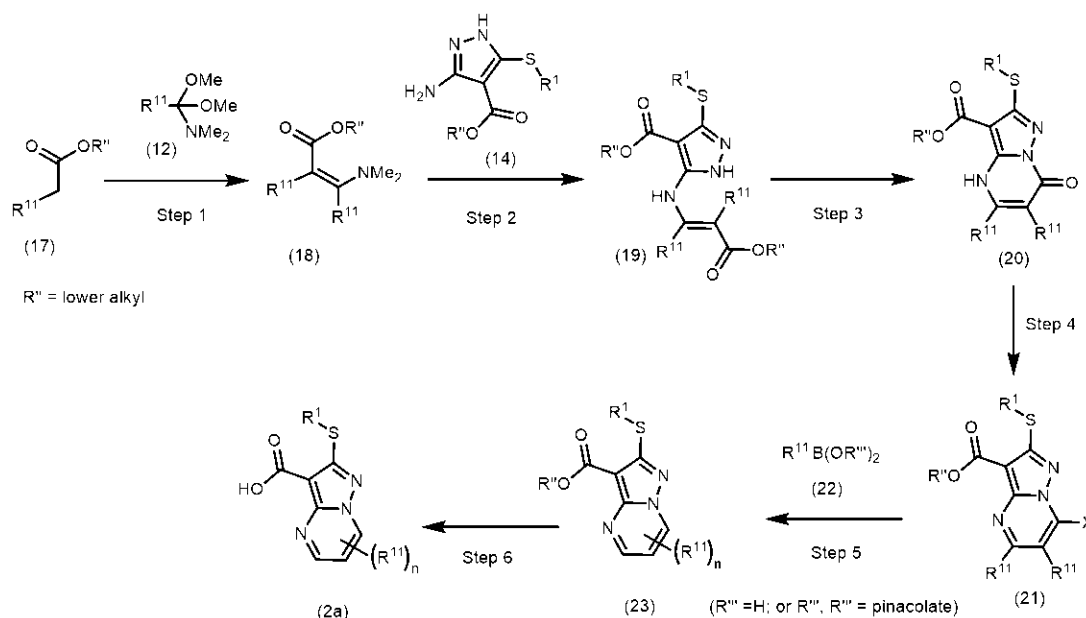
【0 1 5 0】

スキーム：4

【0 1 5 1】

50

【化 1 5】



10

【0 1 5 2】

式中、X はハロゲンであり、 R^1 及び R^{11} は上記の意味を有する。

20

【0 1 5 3】

式 (19) の化合物を、式 (18) の化合物から出発して、スキーム 3 の工程 1 に記載されているのと同じ方法で得ることができる。式 (18) の化合物の反応は、スキーム 3 の工程 2 に記載されているのと同じ方法で行うことができる。さらに、工程 3 を行わずに、酢酸の存在下で工程 2 を行った場合に式 (20) の化合物を得ることができる。

【0 1 5 4】

式 (20) の化合物の式 (21) の化合物への変換は、ハロゲン化剤の存在下及び塩基の存在下又は非存在下で溶媒中で行うことができる。溶媒の例には、アセトニトリル、クロロホルム、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、トルエン、N, N-ジメチルホルムアミドなどが含まれるが、これらに限定されない。ハロゲン化剤の例には、オキシ塩化リン、塩化チオニル、五塩化リン、塩化オキサリルなどが含まれるが、これらに限定されない。塩基の例には、N, N-ジメチルアニリン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリンなどが含まれるが、これらに限定されない。反応は 50 ~ 200 °C の範囲の温度で行うことができる。

30

【0 1 5 5】

式 (21) の化合物を、標準的なスズキクロスカップリング条件下でボロン酸又は式 (22) のボロン酸エステル化合物と好都合にカップリングして、式 (23) の化合物を得ることができる。スズキクロスカップリング反応は、1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィン)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を含むがこれらに限定されないパラジウム系触媒によって、好適な溶媒中、例えば、テトラヒドロフラン(THF)、N, N'-ジメチルホルムアミド(DMF)、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン、又はテトラヒドロフラン(THF)/水、1, 2-ジメトキシエタン/水、1, 4-ジオキサン/水などの混合物の溶媒系中で触媒することができる。反応は通常、塩基、例えば、炭酸カリウム、炭酸セシウム、又はリン酸カリウムの存在下で行われる。反応温度は、文献で先例があるように(例えば、Chem. Soc. Rev. 2014, 43, 412-443又はWO2014070978を参照のこと)、優先的には、周囲温度(20 °C)から反応混合物の沸点までの範囲とすることができる。式 (23) の化合物の加水分解を、テトラヒドロフラン、水、メタノール、エタノール、トルエン又はそれらの混合物などの溶媒中で水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、ビス(トリブチルスズ)オキシドなどの塩基を使用す

40

50

ることによって達成し、式(2a)の化合物を得ることができる。反応は、約50℃～150℃の範囲の温度で行うことができる。

【0156】

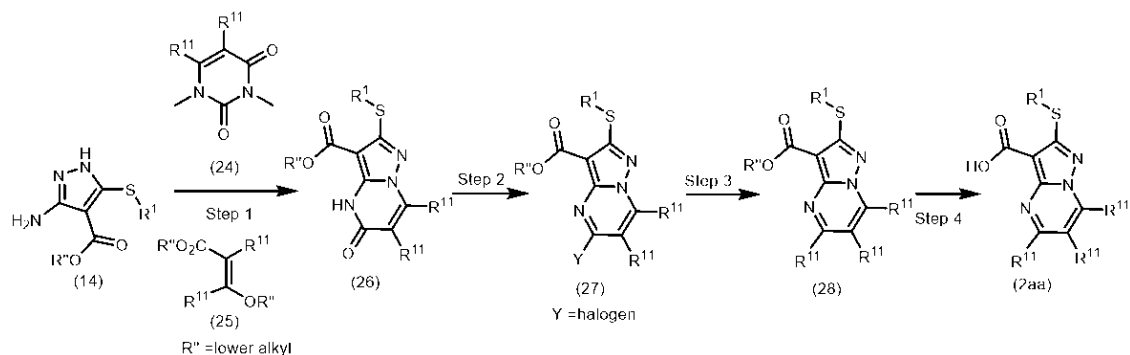
式(2aa)の化合物は、以下のスキーム5に従って調製することができる。

【0157】

スキーム：5

【0158】

【化16】



10

【0159】

式中、 R^1 及び R^{11} は、上記の意味を有する。

20

【0160】

式(14)のピラゾール誘導体化合物は、塩基の存在下で式(24)の1,3-ジメチルウラシル化合物又は式(25)のアルコキシアクリレート誘導体と環化縮合して、式(26)のピリミジン-5-オン誘導体を得ることができる。塩基の例には、ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド、カリウムtert-ブトキシド、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸セシウム、リン酸カリウムなどが含まれる。溶媒の例には、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミドなどが含まれる。反応は、約50℃～約150℃の範囲の温度で行うことができる。このような反応は文献で周知であり、代替反応も文献で十分に記載されている(例えば、J. Org. Chem 2007, 72, 1046; WO 2018081417)。式(26)の化合物をオキシ塩化リン又はオキシ臭化リンでハロゲン化することにより、例えばWO 201108689に記載される式(28)の化合物を得ることができる。式(27)の化合物を、標準的なスズキクロスカップリング条件下で好都合にカップリングして、スキーム4の工程5に記載の式(28)の化合物を得ることができる。スキーム4の工程6に記載のように式(28)の化合物をその後にアルカリ加水分解することにより、式(2aa)の化合物を得ることができる。

30

【0161】

式(2ab)の化合物を合成するためのプロセスをスキーム6に示す：

【0162】

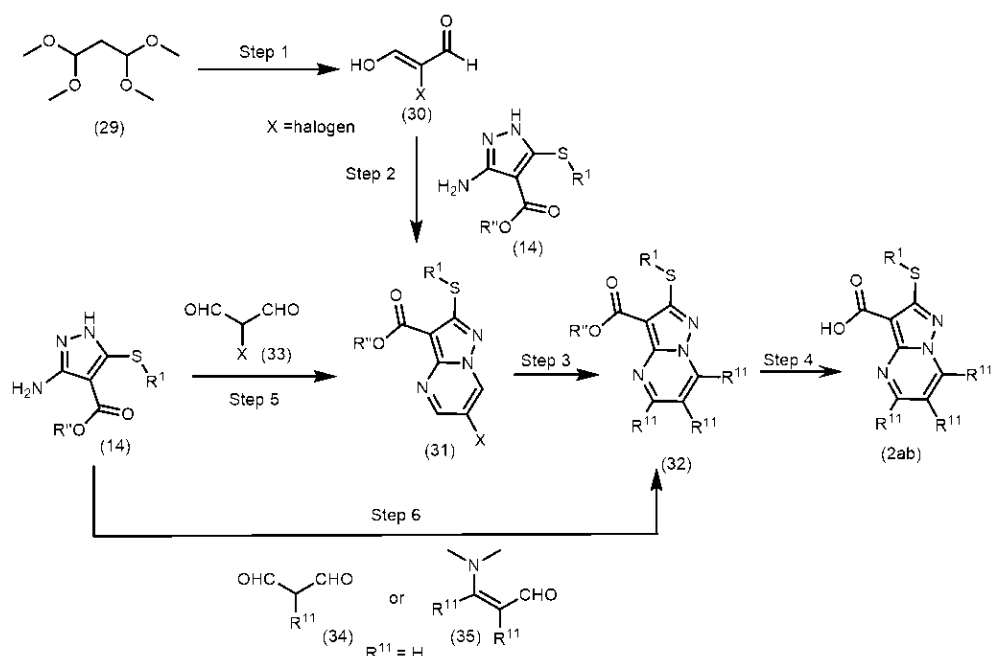
スキーム：6

【0163】

40

50

【化 17】



【0164】

式中、 R^1 及び R^{11} は、上記の意味を有する。

【0165】

式 (29) のビスアセタール保護マロンアルデヒド化合物を、臭素、ヨウ素、若しくは塩素、又は N -ブロモスクシンイミド、 N -ヨードスクシンイミド、若しくは N -クロロスクシンイミドなどのハロゲン化剤を用いて、塩酸、硫酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、テトラフルオロボウ酸、又は p -トルエンスルホン酸から独立して選択される酸を利用することによって生成し得る酸性条件下、好適な溶媒中、例えば、水中で、ハロゲン化することによって活性化して、式 (30) のクロロマロンアルデヒド、ヨードマロンアルデヒド、又はブロモマロンアルデヒドなどのハロゲン化アルデヒドを得ることができる。工程 2 の後に、式 (30) の化合物を好適な縮合条件下で式 (14) のピラゾール誘導体と反応させて、式 (31) の化合物を得ることができる。溶媒の例には、ジメチルスルホキシド、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、 N 、 N -ジメチルホルムアミド、及びそれらの混合物が含まれるが、これらに限定されない。反応は、約 50°C ~ 約 150°C の範囲の温度で行うことができる。式 (31) の化合物を、標準的なスズキクロスカップリング条件下でさらに好都合にカップリングして、スキーム 4 の工程 5 に記載の式 (32) の化合物を得ることができる。スキーム 4 の工程 6 に記載のように式 (32) の化合物をその後アルカリ加水分解することにより、式 (2ab) の化合物を得ることができる。

【0166】

或いは、式 (31) の化合物は、酸触媒条件下で式 (14) のピラゾール誘導体を商業的に入手可能な式 (33) の 2-ハロマロンアルデヒドで環化することによって調製することもできる。酸の例には、酢酸、スルホン酸 (例えば、PTSA)、硫酸、塩酸が含まれるが、これらに限定されない。溶媒の例には、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコールなどが含まれるが、これらに限定されない。反応は、約 0°C ~ 約 150°C の範囲の温度で行うことができる。式 (32) のピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン誘導体はまた、商業的に入手可能なマロンアルデヒド (34) 又はその同等物 (35) のいずれかを用いた式 (14) のピラゾール誘導体の環化縮合後に調製することができる。誘導体 (35) は、J. Het. Chem. 1974, 44, 51 で記載される方法によって調製してもよい。

【0167】

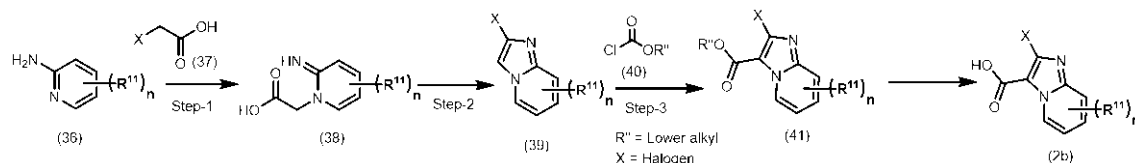
式 (2b) の化合物を合成するためのプロセスをスキーム 7 に示す：

【0168】

スキーム：7

【0169】

【化18】



【0170】

式中、 R^{11} 及び n は、上記の意味を有する。

【0171】

式(38)の化合物は、式(36)の2-アミノピリジン誘導体から2工程の手順で調製することができ、第1の工程は、塩基性条件下、好適な溶媒中での式(36)の2-アミノピリジン誘導体とハロ酢酸(37)との縮合反応を含む。好適な塩基の例には、トリメチルアミン及びジイソプロピルエチルアミンなどの第三級アミンが含まれるが、これらに限定されない。好適な溶媒の例には、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、及びそれらの混合物が含まれるが、これらに限定されない。反応は、約50℃～約150℃の範囲の温度で行うことができる。

【0172】

オキシ塩化リン又はオキシ臭化リンの存在下、好適な溶媒(例えば、トルエン)中で、高温で式(38)の化合物を分子内環化することにより、式(39)の2-ハロイミダゾール[1,2-a]ピリジン類似体を得ることができる。式(40)のクロロカーボネートアルキルを1つの炭素源として使用した式(38)の化合物のアルコキシカルボニル化を、 n -ブチルリチウムなどの有機金属試薬を使用して、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテルなどのエーテル溶媒中で行い、式(41)の化合物を得ることができる。反応は、約-78℃～約25℃の範囲の温度で行うことができる(WO2011163355)。スキーム4の工程6に記載のように式(41)の化合物をその後にアルカリ加水分解することにより、式(2b)の化合物を得ることができる。

【0173】

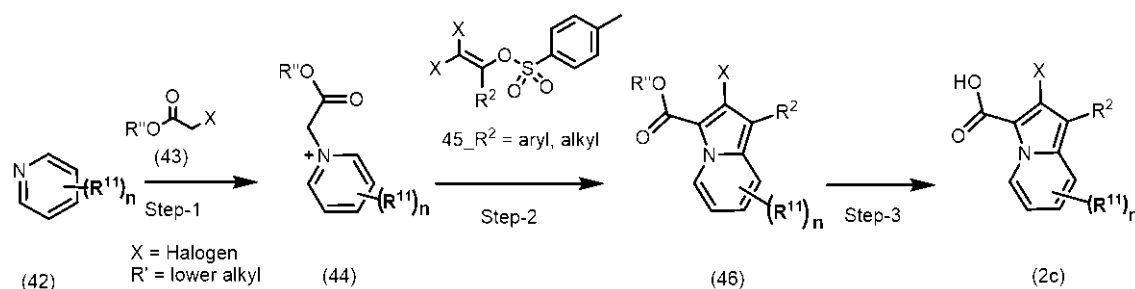
式(2c)の化合物を合成するためのプロセスをスキーム8に示す：

【0174】

スキーム：8

【0175】

【化19】



【0176】

式中、 R^2 、 R^{11} 、及び n は、上記の意味を有する。

【0177】

式(44)の化合物は、酢酸エチル、アセトン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、ジクロロホルム、クロロホルム、

N, N-ジメチルホルムアミド、トルエン、キシレン、メタノール、エタノール、それらの混合物などを含むがこれらに限定されない不活性溶媒中で、式(42)の置換ピリジン化合物と式(43)のアルキル2-ハロアセテートとを反応させることによって調製することができる。トリメチルアミン、ピリジン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、2, 6-ルチジンなどの塩基を反応に使用することができる。反応は0℃から還流温度までの範囲の温度で行うことができ、反応時間は通常30分～48時間の範囲であり、出発物質、使用する溶媒、及び反応温度などに応じて変動する。

【0178】

式(46)のインドリジン誘導体は、式(44)の化合物と式(45)のハロアルケニルトシレートとを反応させることによって調製することができる。式(45)の化合物の調製は、文献に記載されている(Tetrahedron 2018, 74, 5295; Organic Letters 2010, 12, 5518)。不活性溶媒として、酢酸エチル、アセトン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタン、ジクロロホルム、クロロホルム、N, N-ジメチルホルムアミド、トルエン、キシレン、メタノール、エタノール、それらの混合物を反応に使用することができる。塩基として、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム、フッ化カリウム、水酸化リチウム、トリメチルアミン、ピリジン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、2, 6-ルチジンを反応に使用することができる。反応は、0℃から還流温度までの範囲の温度で行うことができる。反応時間は通常1時間～48時間であり、出発物質、使用する溶媒、反応温度などに応じて変動する。このような反応は文献で既知であり、例えばTetrahedron 2004, 60, 5487などで十分に説明されている。

【0179】

スキーム4の工程6に記載のように式(46)の化合物をその後にアルカリ加水分解することにより、式(2c)の化合物を得ることができる。

【0180】

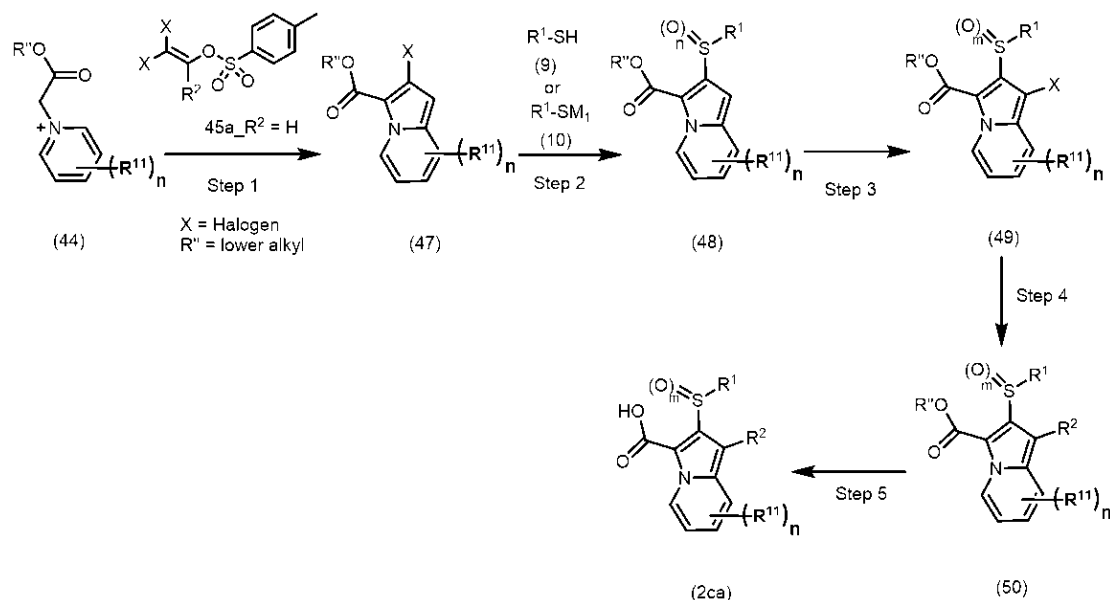
式(2ca)の化合物を合成するためのプロセスをスキーム9に示す：

【0181】

スキーム：9

【0182】

【化20】



【0183】

式中、 R^1 、 R^2 、 R^{11} 、及び n は、上記の意味を有する。

【0184】

式(47)のインドリジン誘導体は、スキーム8に記載される工程2の後に、(44)の化合物と式(45a)のハロアルケニルトシレートとを反応させることによって調製することができる。式(47)の化合物を式(9)の化合物又は式(10)の化合物と反応させ、続いて酸化して、式(48)の化合物を得ることができる。式(49)の化合物は、式(48)の化合物から、N-ブロモスクシンイミド、N-クロロスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミドなどのハロゲン化剤を用いたハロゲン化によって調製することができる。反応は、ジクロロメタン、2-ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、酢酸、アセトニトリル、メタノール、N,N-ジメチルホルムアミドなど、又はそれらの混合物から選択される不活性溶媒中で行うことができる。反応は、0℃から還流温度までの範囲の温度で行うことができる。反応時間は通常30分～48時間であり、出発物質、使用する溶媒、及び反応温度に応じて変動する。

10

【0185】

式(49)の化合物を標準的なスズキクロスカップリング条件下で好都合にカップリングして、スキーム4の工程5に記載の式(50)の化合物を得ることができる。スキーム4の工程6に記載のように式(50)の化合物をその後にアルカリ加水分解することより、式(2ca)の化合物を得ることができる。

【0186】

QがQ₃であり、G₅がCR³であり、R=Hである式(I)の化合物のサブグループは、式(52)の化合物によって表すことができ、式(6b)の化合物と式(51)の化合物とを反応させて、G₅がCR³であり、R³=Hである式(52)の化合物を得ることによって調製することができる。

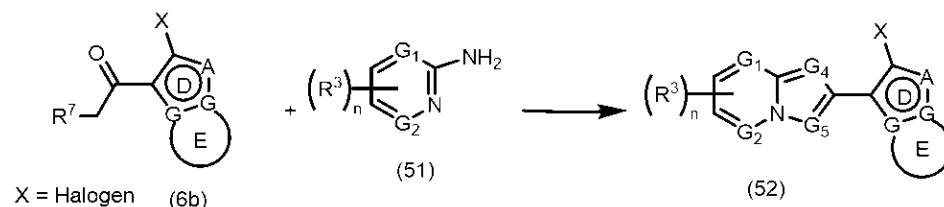
20

【0187】

スキーム：10

【0188】

【化21】



30

【0189】

式中、R³、R⁷、A、G、G₁、G₂、G₄、G₅、E、及びnは、上記の意味を有する。

【0190】

式(52)の化合物を得るための環化は、インジウム(III)トリフラート又はヨウ化亜鉛(II)などのルイス酸の存在下、1,2-ジクロロベンゼン、クロロベンゼンなどの溶媒中、酢酸銅(II)などの触媒銅(II)塩の存在下で、酸素又は空気雰囲気下で行うことができる。反応は、約100℃～約180℃の範囲の温度で行うことができる。このような反応は、文献に先例がある(例えば、Adv. Synth. Catalysis, 2013, 355, 1741; J. Org. Chem., 2013, 78, 12494を参照のこと)。式(51)の化合物の合成は、WO2015000715に記載されている。

40

【0191】

式(52)の化合物を式(9)の化合物又は式(10)の化合物と反応させて、式(53)の化合物を得ることができる。

【0192】

式(53A)の化合物は、Chem. Commun., 2017, 53, 2064-2067; Tetrahedron Lett., 2005, 46, 8007-8008及び

50

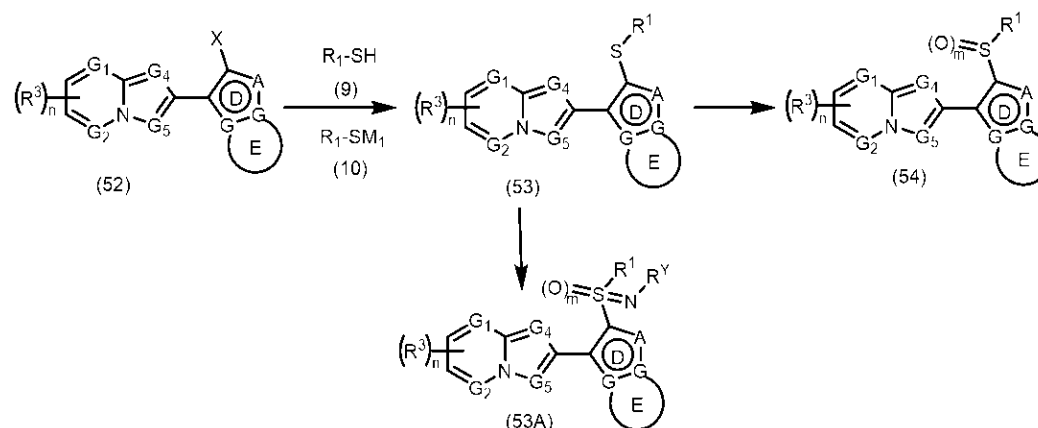
WO 2015071180 A1に記載される合成プロセスに従って調製することができる。

【0193】

スキーム：11

【0194】

【化22】



10

【0195】

式中、 R^1 、 R^3 、A、G、 G_1 、 G_2 、 G_4 、 G_5 、E、m及びnは、上記の意味を有する。

20

【0196】

m=1（スルホキシド）であり、及び／又はm=2（スルホン）である式（54）で表される化合物は、当業者に周知の適切な酸化剤及び条件を適用しながら、式（53）の対応する硫化物化合物を酸化することによって得ることができる。m-クロロ過安息香酸（mCPBA）、過酸化水素／氷酢酸、過酸化水素／トリフルオロ酢酸、過酸化水素／過マンガン酸カリウム、過酸化水素／p-トルエンスルホンイミダゾール、尿素過酸化水素／トリフルオロ酢酸、オキシソ、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム、及び他の有機過酸などの酸化剤を酸化に使用することができる。この反応で使用される溶媒の例には、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素、メタノール及びエタノールなどのアルコール、並びにそれらの混合物が含まれる。

30

【0197】

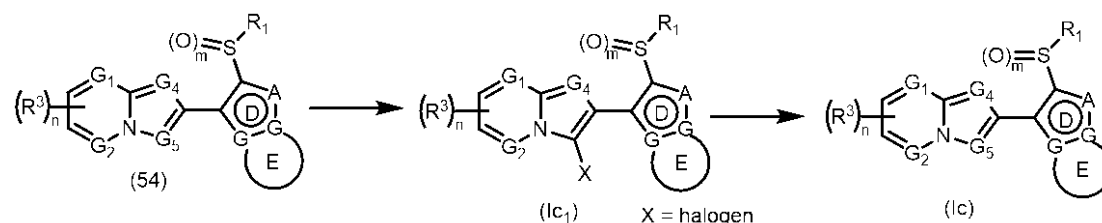
アセトニトリル又はN，N-ジメチルホルムアミドなどの極性非プロトン性溶媒中、周囲温度で、N-クロロスクシンアミド、N-ブロモスクシンアミド、N-ヨードスクシンアミドなどのハロゲン化剤によって、 $G_5 = CR^3$ であり、 $R^3 = H$ である式（54）の化合物をハロゲン化することにより、式（Ic₁）の化合物を得ることができる。

【0198】

スキーム：12

【0199】

【化23】



40

【0200】

式中、 R^1 、 R^3 、A、G、 G_1 、 G_2 、 G_4 、 G_5 、E、m及びnは、上記の意味を有する。

【0201】

50

式 (I c₁) の化合物を、パラジウム触媒の存在下で化合物 $R^3-B(OR', R'')^2$ ($R', R'' = H$ 又は $R', R'' =$ ピナコレート) と反応させ、 CGR^3 であり、 $R^3 =$ アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールである式 (I c) の化合物を得ることができる。このようなスズキ反応は、文献に十分な先例がある (例えば、WO 2012133607 を参照のこと)。

【0202】

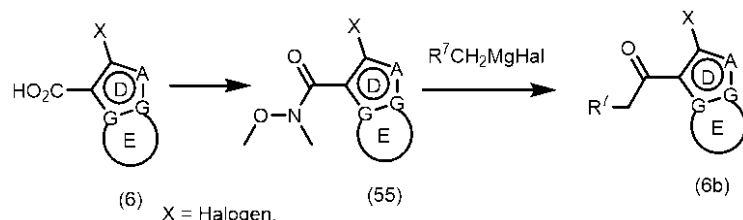
式 (6b) の化合物を合成するためのプロセスをスキーム 12a に示す：

【0203】

スキーム：12a

【0204】

【化24】



【0205】

式中、G、E、及びAは、上記の意味を有する。

【0206】

式 (6) のカルボン酸を、WO 201175643 及び EP 2671582 に記載の手順と同様に、当業者に既知の方法によってN、O-ジメチルヒドロキシルアミンと反応させることにより、式 (55) のワインレブアミドに変換することができる。その後、Tetrahedron Letters 1981, 22, 3815 に記載される方法に従って、式 (55) のワインレブアミドを式 (R^7CH_2MgHal) のグリニャール試薬で処理することにより、式 (6b) の化合物を得ることができる。

【0207】

QがQ₄であり、G₅が窒素であり、G₄が CR^3 である式 (1d) の化合物を合成するためのプロセスをスキーム 13 に示し、次いで、式 (1d) の化合物は、式 (56) の化合物と式 (57) の化合物とを任意選択的に好適な塩基の存在下で不活性溶媒中で反応させることによって調製することができる。或いは、G₄が窒素である場合、式 (1d) の化合物は、X⁻がハロゲン化物イオン又はスルホン酸メシチルである式 (58) の化合物と式 (59) の化合物とを任意選択的に好適な塩基の存在下で不活性溶媒中で反応させることによって調製することができる。

【0208】

スキーム：13

【0209】

10

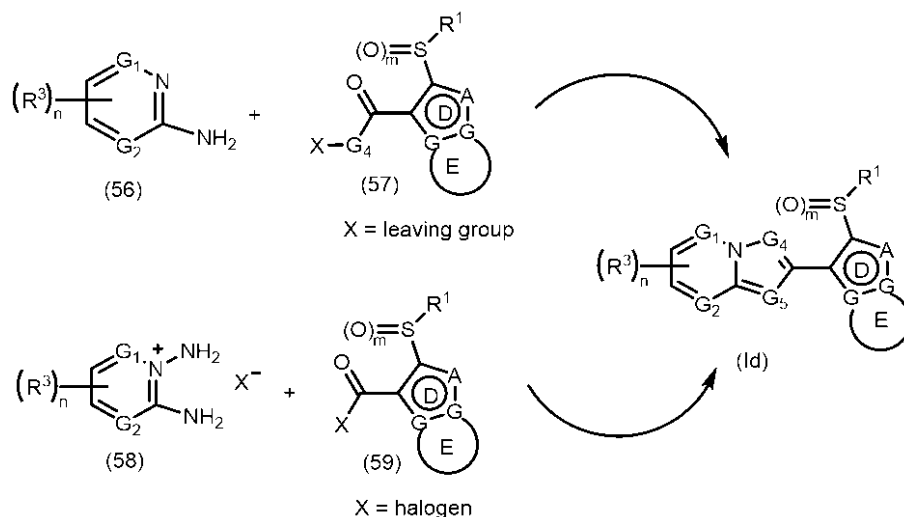
20

30

40

50

【化 2 5】



10

【0 2 1 0】

式中、 R^1 、 R^3 、A、G、 G_1 、 G_2 、 G_4 、 G_5 、E、m及びnは、上記の意味を有する。

【0 2 1 1】

式(56)の化合物の合成は、文献WO2015000715に記載されている。式(57)の化合物の合成は、例えばEP1371638と同様に達成することができる。式(58)の化合物は、例えばJ. Heterocyclic Chem. 1975, 12, 107及びSynthesis 1977, 1, 17に記載されるように、式(56)の化合物とアミノ化試薬としてのO-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン(MSH)又はその同等物の1つとを反応させることによって、N-アミノ化により調製することができる。

20

【0 2 1 2】

Qが Q_5 であり、 G_5 が CR^3 である式(I)の化合物のサブグループは、式(Ie)の化合物によって表すことができる。式(Ie)の化合物は、式(Ic)の化合物の調製と同様に、式(60)の化合物と式(6b)の化合物とを反応させることによって合成することができる。

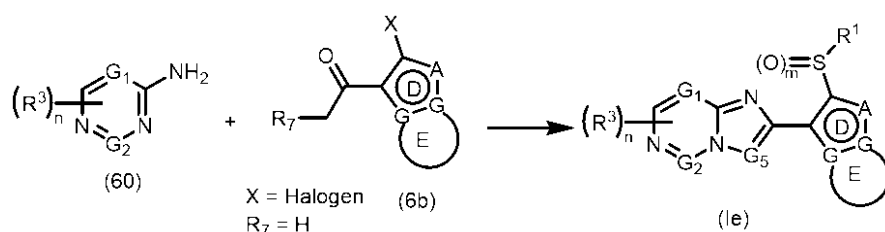
30

【0 2 1 3】

スキーム：14

【0 2 1 4】

【化 2 6】



40

【0 2 1 5】

式中、 R^1 、 R^3 、A、G、 G_1 、 G_2 、 G_5 、E、m及びnは、上記の意味を有する。

【0 2 1 6】

当業者は、Qが Q_6 であり、 G_5 が CR^3 である式(I f)の化合物が、式(61)の化合物と式(57a)又は(6a)の化合物とを反応させることによって同様に調製できることを認識するであろう。

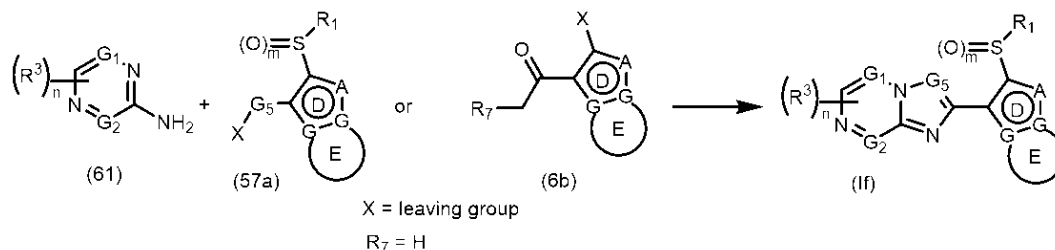
【0 2 1 7】

50

スキーム：15

【0218】

【化27】



10

【0219】

式中、 R^1 、 R^3 、 A 、 G 、 G_1 、 G_2 、 G_5 、 E 、 m 及び n は、上記の意味を有する。

【0220】

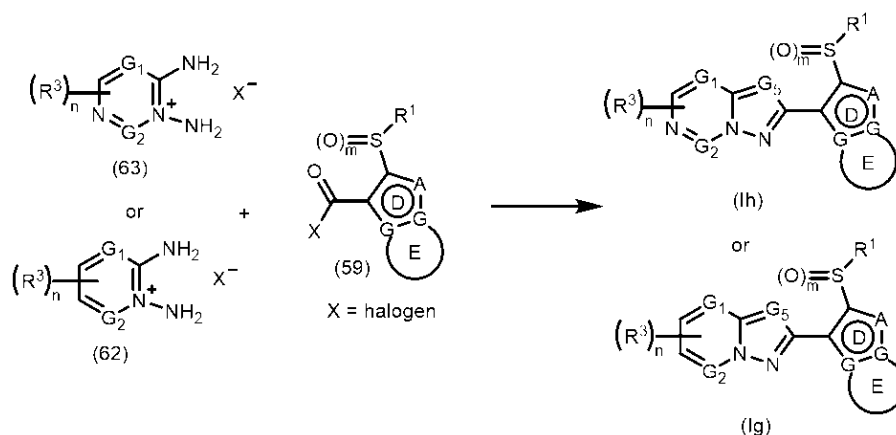
Q が Q_3 であり、 G_5 が窒素である式(I)の化合物のサブグループは、式(Ig)の化合物によって表すことができ、式(62)の化合物と式(59)の化合物とを任意選択的に好適な塩基の存在下で不活性溶媒中で反応させることによって調製することができる。

【0221】

スキーム：16

【0222】

【化28】



20

30

【0223】

式中、 R^1 、 R^3 、 A 、 G 、 G_1 、 G_2 、 G_5 、 E 、 m 及び n は、上記の意味を有する。

【0224】

式(62)の化合物は、例えばJ. Heterocyclic Chem. 1975, 12, 107及びSynthesis 1977, 1, 17に記載されるように、式(51)の化合物とアミノ化試薬としてのO-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン(MSH)又はその同等物の1つと反応させることによって、N-アミノ化により調製することができる。 Q が Q_5 であり、 G_5 が窒素である式(I)の化合物のサブグループは、式(Ih)の化合物によって表すことができ、式(63)の化合物と式(59)の化合物とを任意選択的に好適な塩基の存在下で不活性溶媒中で反応させることによって調製することができる。

40

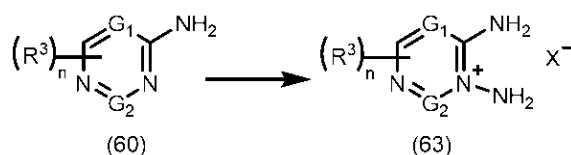
【0225】

式(63)の化合物は、式(60)の化合物とアミノ化試薬としてのO-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン(MSH)とを反応させることによって、N-アミノ化により調製することができる。このプロセスは、J. Heterocyclic Chem. 1975, 12, 107及びSynthesis 1977, 1, 17に記載されている。式(60)の化合物の合成は、文献WO2007113558に記載されている。

50

【0226】

【化29】



【0227】

式中、 R^3 、 G_1 、及び G_2 は、上記の意味を有する。

【0228】

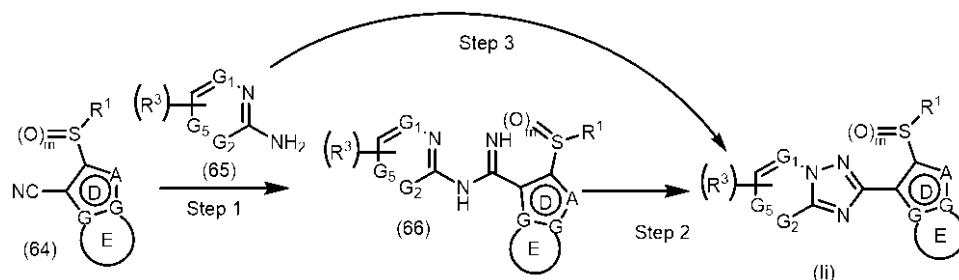
更なる実施形態では、 Q が Q_7 であり、式(64)の化合物と式(65)の化合物とを反応させて、 G_5 が CR^3 又は N である式(Ii)の化合物を得ることを含む。式(Ii)の化合物のためのプロセスをスキーム17に纏める。

【0229】

スキーム：17

【0230】

【化30】



【0231】

式中、 R^1 、 R^3 、 G 、 A 、 G_1 、 G_2 、 G_5 、 G_6 、 E 、 m 及び n は、上記の意味を有する。

【0232】

式(65)の化合物は、商業的に入手可能であるか、又はWO2017113558及びWO2011090122においてそれ自体で既知である方法により、若しくはそれらに記載されているのと同様にして調製することができる。

【0233】

スキーム17において、式(66)のN置換アミジンは、式(64)の化合物と式(65)の化合物とを好適な塩基の存在下で反応させることによって調製することができる。好適な塩基の例は、水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、ヘキサメチルジシラザンナトリウムなどのヘキサメチルジシラザンのアルカリ金属塩、カリウム若しくはナトリウムtert-ブトキシドなどのアルコール酸塩、又はリチウムジイソプロピルアミドである。反応は、溶媒中、好ましくは一般的な反応条件下で不活性であるような溶媒中、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジイソプロピルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテルなどのエーテル溶媒；アセトニトリル又はプロピオニトリルなどのニトリル；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジン、又はジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒中で行うことができる。反応は、約0℃～約150℃の範囲の温度で行うことができる。このような反応は、文献に先例がある（例えば、J. Am. Chem. Soc. 2009, 131, 15080を参照のこと）。

【0234】

好適な塩基の存在下又は非存在下での式(66)のN置換アミジンの分子内酸化的環化は、J. Org. Chem. 2015, 80, 7219；J. Org. Chem. 2014, 79, 4687に記載されているものと同様に行うことができる。酸化剤の例には、次

亜塩素酸ナトリウム、酢酸鉛（Ⅳ）、二酸化マンガン、ヨウ素、フェニルヨウ素（ⅠⅠⅠ）ジアセテート（PIDA）及びフェニルヨウ素（ⅠⅠⅠ）ビス（トリフルオロアセテート）（PIFA）などの超原子価ヨウ素（ⅠⅠⅠ）試薬が含まれる。反応は、溶媒中、好ましくは一般的な反応条件下で不活性である溶媒中、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリルなどのニトリル；トルエン又はキシレンなどの芳香族炭化水素；N，N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、若しくはジメチルスルホキシド、又は酢酸エチルなどの非プロトン性極性溶媒；ジクロロメタン又はジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素；ヘキサフルオロイソプロパノール、メタノール、エタノール、トリフルオロエタノール、イソプロパノールなどのアルコール溶媒中で行うことができる。好適な塩基には、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、及び炭酸セシウムが含まれる。反応は、約25℃～約180℃の範囲の温度で行うことができる。

10

【0235】

或いは、式（1i）の化合物は、WO201341472及びJ. Am. Chem. Soc. 2009, 131, 15080に記載されているものと同様に、工程3の後に、式（65）の化合物と式（64）の化合物とを遷移金属触媒で酸化カップリングすることを含む単一の工程で合成することができる。遷移金属触媒には、臭化銅（Ⅰ）、塩化銅（Ⅰ）、ヨウ化銅（Ⅰ）、酢酸銅（ⅠⅠ）、塩化亜鉛、臭化亜鉛（ⅠⅠ）、ヨウ化亜鉛などの亜鉛又は銅の塩が含まれる。好適な塩基には、例えば、1，10-フェナントリン、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムが含まれる。反応は、溶媒中、好ましくは一般的な反応条件下で不活性である溶媒中、例えば、1，2-ジクロロベンゼン、トルエン、又はキシレンなどの芳香族炭化水素中で行うことができる。反応は、50℃～150℃の範囲の温度で行うことができる。

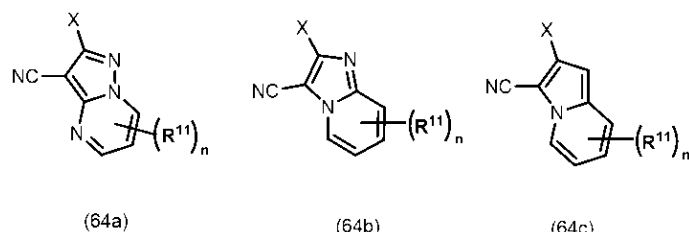
20

【0236】

式（64）の化合物は、式（64a）、（64b）、及び（64c）からなる群から選択される。

【0237】

【化31】



30

X = Halogen, -S(O)_nR₁
n = 0-2

【0238】

式中、R¹¹及びnは、上記の意味を有する。

【0239】

式（64a）、（64b）、及び（64c）の化合物の合成をスキーム18及びスキーム19に記載する。

40

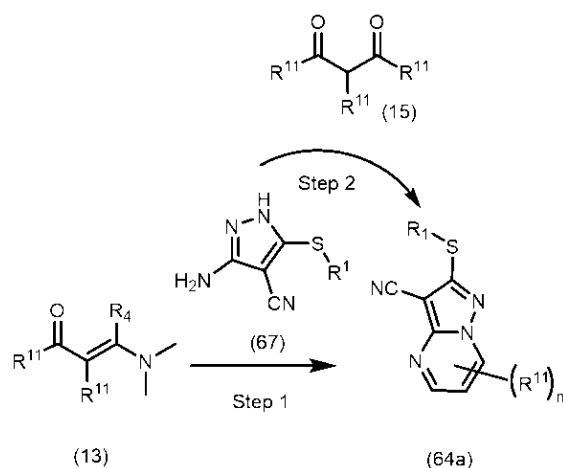
【0240】

スキーム：18

【0241】

50

【化 3 2】



10

【0 2 4 2】

式中、 R^1 、 R^{11} 、及び m は、上記の意味を有する。

【0 2 4 3】

ピリジン形成工程において、スキーム 3 に記載されていると同様の手順に従って、式 (67) のピラゾール誘導体は、式 (13) の二求電子性 (dielectrophilic) 化合物又は式 (15) の 1,3-ジケトン (例えば、1,3-ジアルデヒド又は 3-(ジアルキルアミノ)プロパン-2-エナール) で処理すると環化縮合反応を行って、式 (64a) の化合物を得ることができる。式 (67) の化合物の調製は、文献に記載されている (Journal of Heterocyclic Chemistry 2016, 53, 1231)。

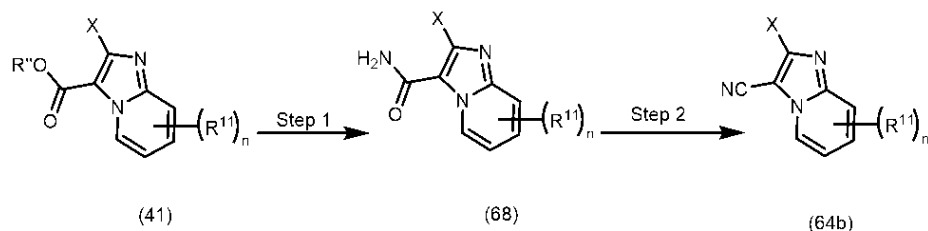
20

【0 2 4 4】

スキーム：19

【0 2 4 5】

【化 3 3】



30

R'' = Lower alkyl

X = Halogen

【0 2 4 6】

式中、 R^{11} 及び n は、上記の意味を有する。

【0 2 4 7】

式 (68) の化合物は、WO 201065760 及び WO 2016133838 に記載された方法と同様に、アンモニア源を使用して、式 (41) の化合物から調製することができる。通常、水酸化アンモニウム又はメタノール性アンモニア溶液をアンモニア源として使用する。式 (41) の化合物の合成は、スキーム 7 に記載されている。反応は、1,4-ジオキサン若しくはテトラヒドロフランなどのエーテル溶媒又はメタノール、エタノールなどのアルコール溶媒を使用する一般的な反応条件下で、約 25℃～約 100℃の範囲の温度で行うことができる。式 (64b) の化合物は、WO 201065760 及び EP 2740730 に記載の方法と同様に、式 (68) の化合物と、塩化ホスホリル又は無水トリフルオロ酢酸などであるがこれらに限定されない脱水試薬と、を反応させることにより調製することができる。反応は、1,4-ジオキサン又はテトラヒドロフランなどの

40

50

エーテル溶媒を使用する一般的な反応条件下で、約 25℃～約 120℃の範囲の温度で行うことができる。

【0248】

式(64c)の化合物は、式(46)の化合物から出発して、スキーム19に記載の式(64b)の化合物の調製について記載したのと同様の反応順序及び条件に従って調製することができる。式(46)の化合物の一般的合成はスキーム8に記載されている。

【0249】

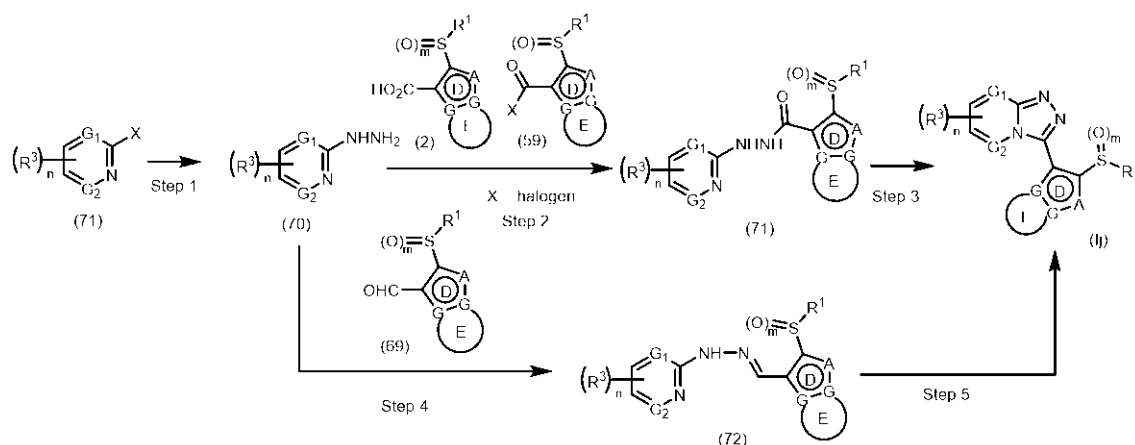
一実施形態では、QがQ₈であり、式(2)又は式(59)又は式(69)の化合物と式(70)の化合物とを反応させて、G₄及びG₅がNである式(1j)の化合物を得ることを含む。スキーム20は、式(1j)の化合物を調製する方法を記載している。

【0250】

スキーム：20

【0251】

【化34】



【0252】

式中、R¹、R³、A、Z、G、G₁、G₂、E、m、及びnは、上記の意味を有する。

【0253】

式(71)の化合物のハロゲン誘導体は、商業的に入手することができ、又は文献で既知の方法によって若しくは当業者に既知の他の方法によって調製することができる。式(71)の化合物とヒドラジンとの反応は、当業者に既知の反応条件を使用して行うことができる(例えば、Larock, R. C. "Comprehensive Organic Transformations: A Guide to functional Group Preparations, 2nd Ed.", 1999, Wiley-VCH)。工程2の式(70)の中間化合物を、N-メチルモルホリン/イソブチルクロロホルメート、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド/ヒドロキシベンゾトリアゾール又は"The Practice of Peptide Synthesis, 2nd Ed., Springer-Verlag, Bodanszky, Miklos (1993)"に記載されている他の試薬などの適切なアミドカップリング試薬セットを使用して、式(2)の化合物の酸と反応させることができ、式(71)の中間ヒドラジドを提供することができる。更に、式(71)のアシルヒドラジドは、N,N-ジイソプロピルエチルアミン又はトリエチルアミンなどの好適な塩基の存在下で、式(70)の化合物と式(59)の酸塩化物とを反応させた後に調製することができる。式(1j)のトリアゾロ化合物の形成は、オキシ塩化リン/五塩化リン、ローソン試薬、酢酸、又はポリリン酸を使用して、高温で、従来の手順下又はマイクロ波照射下で式(71)の化合物を環化脱水した後に達成することができる。或いは、変換は、式(71)の化合物とトリフェニルホスフィンクロリド又はP(アルキル)₃/四塩化炭素とをトリエチルアミン又はN,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下で反応させるか、又は当業者に既知の

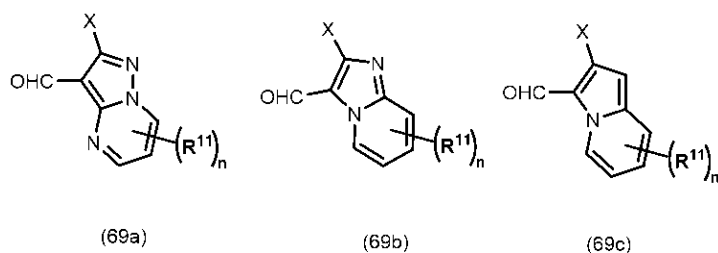
他の方法に従って達成することもできる。別の手法として、式(72)のヒドラゾン、工程4の後に、式(70)の化合物と式(69)のアルデヒド化合物とを反応させることによって、又は当業者に既知の他の方法若しくは文献で既知の方法によって調製することができる(例えば、Larock, R. C. "Comprehensive Organic Transformations: A Guide to functional Group Preparations, 2nd Ed.", 1999, Wiley-VCH)。更に、工程5の後に、式(Ij)の化合物は、ジアセトキシドベンゼン、N-ブロモスクシンイミド、クロラミンT、硝酸セリウムアンモニウム、トリクロロイソシアヌル酸、及び塩化銅(II)などの酸化剤を使用した式(72)のヒドラゾンの酸化的環化によって調製することもできる。

【0254】

式(69)の化合物は、式(69a)、(69b)、及び(69c)からなる群から選択される。

【0255】

【化35】



$n = 0-2$; $X = \text{Halogen}, -\text{S}(\text{O})_n\text{R}_1$

【0256】

式中、 R^1 、 R^{11} 、及び n は、上記の意味を有する。

【0257】

式(69a~c)の化合物は、文献で既知の方法(例えば、Larock, R. C. "Comprehensive Organic Transformations: A Guide to functional Group Preparations, 2nd edition", 1999, Wiley-VCH)による式(23)、(41)、及び(46)の化合物の部分還元によって調製することができる。

【0258】

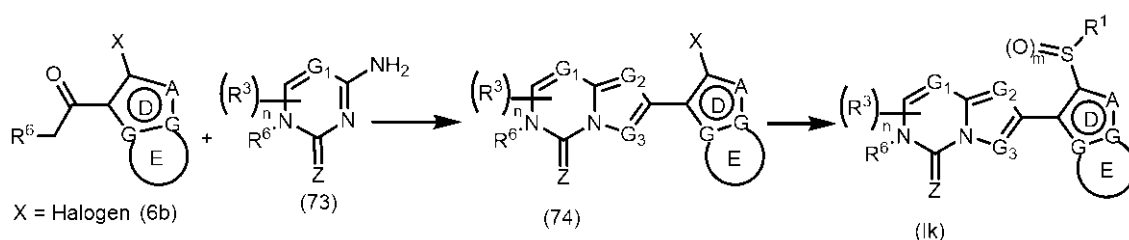
Qが Q_9 である式(I)の化合物を調製するためのプロセスは、式(6b)の化合物と式(73)の化合物とを反応させて、 $G_3 = \text{CR}^3$ であり、 $R^3 = \text{H}$ である式(74)の化合物を得ることを含む。その後、式(1k)の化合物は、式(74)の化合物から、スキーム1の化合物(1c)の合成について記載された一連の一般的な反応に従って得ることができる。式(73)の化合物の合成は、WO2018206479に記載されている。

【0259】

スキーム：21

【0260】

【化36】



【0261】

式中、 R^1 、 R^3 、 R^6 、 A 、 G 、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 Z 、 E 、 m 、及び n は、上記の意味を有する。

【0262】

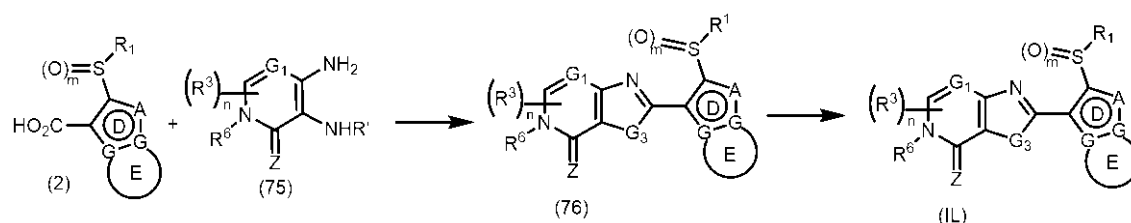
Q が Q_{10} である式(I)の化合物を調製するためのプロセスは、式(2)の化合物を式(75)の化合物と反応させて、 $G_3 = NR^6$ である式(76)の化合物を得ることを含む。その後、式(IL)の化合物は、式(76)の化合物から、スキーム1に記載される一連の一般的な反応に従って得ることができる。式(75)の化合物の合成は、WO2017084879に記載されている。

【0263】

スキーム：22

【0264】

【化37】



【0265】

式中、 X はハロゲンであり、 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R' 、 A 、 Z 、 G 、 G_3 、 E 、 m 、及び n は、上記の意味を有する。

【0266】

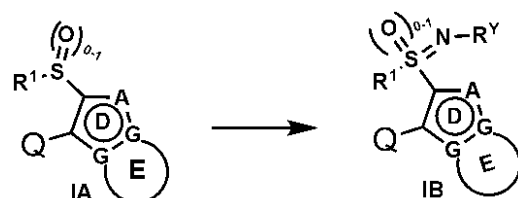
式(IB)の化合物によって表される式(I)の化合物を調製するためのプロセスは、Chem. Commun., 2017, 53, 2064-2067; Tetrahedron Lett. 2005, 46, 8007-8008及びWO2015071180A1に記載されるように、 $n=0$ である化学式(IA)の化合物のスルフィリム化/スルホキシム化による。

【0267】

スキーム：23

【0268】

【化38】



【0269】

式中、 Q 、 R^1 、 R^Y 、 A 、 G 、 E 、及び n は、上記の意味を有する。

【0270】

一実施形態では、本発明は、無脊椎動物害虫を防除又は予防するための組成物を提供する。組成物は、生物学的に有効な量の式(I)の化合物並びに界面活性剤及び助剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加の成分を含む。

【0271】

更に別の実施形態では、本発明は、式(I)の化合物又はそのN-オキシド及び塩を、慣習的な種類の農業組成物、例えば、溶液、乳剤、懸濁液、粉剤、粉末、ペースト、顆粒、プレス、カプセル、及びそれらの混合物に提供する。組成物の種類の例としては、懸濁液(SC、OD、FSなど)、乳化性濃縮物(ECなど)、乳剤(EW、EO、ES、MEなど)、カプセル(CS、ZCなど)、ペースト、トローチ、水和剤、粉剤(例えば、

10

20

30

40

50

WP、SP、WS、DP、DS)、プレス(例えば、BR、TB、DT)、顆粒(例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫剤(例えば、LN)、及び種子などの植物繁殖材料の処理のためのゲル製剤(例えばGF)などである。これら及び他の組成物の種類は、"Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife Internationalで規定されている。

【0272】

組成物は、Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001;又はKnowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T and F Informa, London, 2005によって記載されているような既知の方法で調製される。

10

【0273】

好適な助剤の例は、溶媒、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、アジュバント、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、接着剤、増粘剤、吸湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激剤、相溶化剤、殺細菌剤、凍結防止剤、発泡防止剤、着色剤、粘着付与剤、又は結合剤である。

【0274】

好適な溶媒及び液体担体は、水及び有機溶媒、例えば、中沸点から高沸点の鉱油留分、例えば、灯油、ディーゼル油;植物又は動物由来の油;脂肪族炭化水素、環状炭化水素、及び芳香族炭化水素、例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン;アルコール、例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール;グリコール;DMSO;ケトン、例えばシクロヘキサノン;エステル、例えば、乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、 γ -ブチロラクトン;脂肪酸;ホスホネート;アミン;アミド、例えば、N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド;及びそれらの混合物である。

20

【0275】

好適な固体担体又は充填剤は、鉱物土類、例えば、シリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰岩、石灰、チョーク、粘土、ドロマイト、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム;多糖類粉末、例えば、セルロース、でんぷん;肥料、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素;野菜由来の製品、例えば、穀物粉、樹皮粉、木粉、ナッツシエル粉、及びそれらの混合物である。

30

【0276】

好適な界面活性剤は、界面活性化合物、例えば、アニオン性、カチオン性、非イオン性、及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、及びそれらの混合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又はアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol. 1: Emulsifiers and Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008(国際版又は北米版)に列挙されている。

40

【0277】

好適なアニオン性界面活性剤は、スルホン酸、硫酸、リン酸、カルボン酸のアルカリ塩、アルカリ土類塩、又はアンモニウム塩、及びそれらの混合物である。スルホン酸塩の例は、アルキルアリールスルホン酸塩、ジフェニルスルホン酸塩、アルファオレフィンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、脂肪酸及び油のスルホン酸塩、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸塩、アルコキシ化アリールフェノールのスルホン酸塩、縮合ナフタレンのスルホン酸塩、ドデシラントトリデシルベンゼンのスルホン酸塩、ナフタレン

50

及びアルキルナフタレンのスルホン酸塩、スルホコハク酸塩、又はスルホスクシンアミド酸塩である。硫酸塩の例は、脂肪酸及び油の硫酸塩、エトキシ化アルキルフェノールの硫酸塩、アルコールの硫酸塩、エトキシ化アルコールの硫酸塩、又は脂肪酸エステル硫酸塩である。リン酸塩の例は、リン酸塩エステルである。カルボン酸塩の例は、アルキルカルボン酸塩、及びカルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

【0278】

好適な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、高分子界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリー

10

【0279】

好適なカチオン性界面活性剤は、第四級界面活性剤、例えば、1つ又は2つの疎水性基を有する第四級アンモニウム化合物、又は長鎖第一級アミンの塩である。好適な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。好適なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B型若しくはA-B-A型ブロックポリマー、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド、及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-C型ブロックポリマーである。好適な高分子電解質は、ポリ酸(polyacid)又はポリ塩基(polybase)である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸のアルカリ塩又はポリ酸型ポリマーである。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

20

【0280】

好適なアジュバントは、それ自体が無視できる殺虫活性を有するか又は更には殺虫活性を有さず、かつ、標的に対する化合物Iの生物学的性能を改善する化合物である。例としては、界面活性剤、鉱物油又は植物油、及び他の助剤である。更なる例は、Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports D S 256, TandF Informa UK, 2006, chapter 5に列挙されている。

30

【0281】

好適な増粘剤は、多糖類（例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース）、無機粘土（有機改変又は非改変）、ポリカルボキシレート、及びシリケート(silicate)である。好適な殺細菌剤は、プロノポール並びにアルキルイソチアゾリノン及びベンズイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。好適な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素、及びグリセリンである。好適な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。好適な着色剤（例えば、赤、青、又は緑）は、水溶性の低い顔料及び水溶性染料である。例は、無機着色剤（例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄）及び有機着色剤（例えば、アリザリン、アゾ、及びフタロシアニン着色剤）である。好適な粘着付与剤又は結合剤は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物学的又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

40

【0282】

組成物の種類及びその調製の例は以下の通りである：

【0283】

50

i) 水溶性濃縮物 (SL、LS)

10～60重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩及び5～15重量%の湿潤剤（例えば、アルコールアルコキシレート）を、最大100重量%に、水及び／又は水溶性溶媒（例えば、アルコール）に溶解する。活性物質は水で希釈した際に溶解する。

【0284】

ii) 分散性濃縮物 (DC)

【0285】

5～25重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩及び1～10重量%の分散剤（例えば、ポリビニルピロリドン）を、最大100重量%で、有機溶媒（例えば、シクロヘキサノン）に溶解する。水で希釈することにより、分散液が得られる。

【0286】

iii) 乳化性濃縮物 (EC)

【0287】

15～70重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩及び5～10重量%の乳化剤（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート）を、最大100重量%で、水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解する。水で希釈することにより、乳剤が得られる。

【0288】

iv) 乳剤 (EW、EO、ES)

【0289】

5～40重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩及び1～10重量%の乳化剤（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート）を20～40重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解する。この混合物は、最大100重量%で、乳化機器によって水に導入され、均一な乳剤になる。水で希釈することにより、乳剤が得られる。

【0290】

v) 懸濁液 (SC、OD、FS)

【0291】

攪拌ボールミルで、20～60重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を、2～10重量%の分散剤及び湿潤剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート）、0.1～2重量%の増粘剤（キサンタンガムなど）、並びに最大100重量%の水の添加によって粉碎し、微細な活性物質懸濁液を生成する。水で希釈することにより、活性物質の安定した懸濁液が得られる。FS型の組成物の場合、最大40重量%の結合剤（例えば、ポリビニルアルコール）を添加する。

【0292】

vi) 水分散性顆粒及び水溶性顆粒 (WG、SG)

【0293】

50～80重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を、最大100重量%の分散剤及び湿潤剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート）の添加によって細かく粉碎し、技術機器（例えば、押出し、スプレー塔、流動床）によって水分散性又は水溶性顆粒として調製する。水で希釈することにより、活性物質の安定した分散液又は溶液が得られる。

【0294】

vii) 水分散性粉末及び水溶性粉末 (WP、SP、WS)

【0295】

50～80重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を、1～5重量%の分散剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム）、1～3重量%の湿潤剤（例えば、アルコールエトキシレート）、及び最大100重量%の固体担体、例えばシリカゲルを添加して、ローターステーターミルで粉碎する。水で希釈することにより、活性物質の安定した分散液又は溶液が得られる。

10

20

30

40

50

【0296】

v i i i) ゲル (GW、GF)

【0297】

攪拌ボールミルで、5～25重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を、3～10重量%の分散剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム）、1～5重量%の増粘剤（例えば、カルボキシメチルセルロース）、及び最大100重量%の水を添加して粉碎して、活性物質の微細な懸濁液を得る。水で希釈することにより、活性物質の安定した懸濁液が得られる。

【0298】

i v) マイクロエマルジョン (ME)

10

【0299】

5～20重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を、5～30重量%の有機溶媒ブレンド（例えば、脂肪酸ジメチルアミド及びシクロヘキサノン）、10～25重量%の界面活性剤ブレンド（例えば、アルコールエトキシレート及びアリールフェノールエトキシレート）、及び最大100%の水に添加する。この混合物を1時間攪拌して、熱力学的に安定なマイクロエマルジョンを自発的に生成する。

【0300】

i v) マイクロカプセル (CS)

【0301】

5～50重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩、0～40重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）、2～15重量%のアクリルモノマー（例えば、メタクリル酸メチル、メタクリル酸、及びジオールトリアクリレート）を含む油相を保護コロイド（例えば、ポリビニルアルコール）の水溶液に分散させる。ラジカル開始剤によって開始されるラジカル重合により、ポリ（アクリル酸メチル）マイクロカプセルが形成される。或いは、5～50重量%の本発明による化合物I、0～40重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）、及びイソシアナートモノマー（例えば、ジフェニルメテン-4,4'-ジイソシアナート）を含む油相を保護コロイド（例えば、ポリビニルアルコール）の水溶液に分散させる。ポリアミン（例えば、ヘキサメチレンジアミン）の添加によって、ポリ尿素マイクロカプセルが形成される。モノマーの量は1～10重量%である。重量%は、CS組成物の合計に関する。

20

【0302】

i x) 散粉性 (dustable) 粉末 (DP、DS)

【0303】

1～10重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を細かく粉碎し、最大100重量%の固体担体、例えば、微細化されたカオリンと緊密に混合する。

【0304】

x) 顆粒 (GR、FG)

【0305】

0.5～30重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を細かく粉碎し、最大100重量%までの固体担体（例えば、シリケート）と会合させる。顆粒形成は、押出成形、スプレー乾燥、又は流動床によって行われる。

40

【0306】

x i) 超少量液体 (UL)

【0307】

1～50重量%の化合物I又はそのN-オキシド若しくは塩を最大100重量%までの有機溶媒、例えば、芳香族炭化水素に溶解する。

【0308】

i) ～x i) の組成物の種類は、任意選択的に、更なる助剤、例えば、0.1～1重量%の殺細菌剤、5～15重量%の凍結防止剤、0.1～1重量%の消泡剤、及び0.1～1重量%の着色剤などを含み得る。

50

【0309】

別の一実施形態では、本発明は式（I）の農薬組成物化合物を提供し、これは、0.01～95重量%、好ましくは0.1～90%、より好ましくは1～70%、特に10～60重量%の活性物質を含む。活性物質は、90%～100%、好ましくは95%～100%の純度で使用される（NMRスペクトルによる）。

【0310】

水溶性濃縮物（LS）、サスポエマルジョン（suspoemulsion）（SE）、流動性濃縮物（FS）、乾燥処理用粉末（DS）、スラリー処理用水分散性粉末（WS）、水溶性粉末（SS）、乳剤（ES）、乳化可能濃縮物（EC）、及びゲル（GF）は、通常、植物繁殖材料、特に種子の処理の目的で使用される。問題にしている組成物は、2～10倍希釈後、すぐに使用できる状態の調製物において0.01～60重量%、好ましくは0.1～40重量%の活性物質濃度を与える。適用は播種前又は播種中に行うことができる。

【0311】

化合物I及びその組成物をそれぞれ植物繁殖材料、特に種子に適用又は処理するための方法には、繁殖材料を粉衣（dressing）、コーティング、ペレット化、散粉、浸漬、及び畝内（in-furrow）適用する方法が含まれる。好ましくは、化合物I又はその組成物はそれぞれ、発芽が誘導されないような方法、例えば、種子粉衣、ペレット化、コーティング、及び散粉によって植物繁殖材料に適用される。

【0312】

植物保護に使用される場合、適用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、1ヘクタールあたり0.001～2kg、好ましくは1ヘクタールあたり0.005～2kg、より好ましくは1ヘクタールあたり0.05～0.9kg、特に1ヘクタールあたり0.1～0.75kgである。

【0313】

例えば種子を散粉、コーティング、又は水浸しすることによる種子などの植物繁殖材料の処理において、植物繁殖材料（好ましくは種子）100キログラムあたり、0.1～1000g、好ましくは1～500g、より好ましくは1～100g、最も好ましくは5～100gの活性物質の量が一般的に必要である。

【0314】

材料又は保存製品の保護に使用する場合、適用される活性物質の量は、適用領域の種類及び所望の効果に応じて変動する。材料の保護に通常適用される量は、処理材料1立方メートルあたり、0.001g～2kg、好ましくは0.005g～1kgの活性物質である。

【0315】

様々な種類の油、湿潤剤、アジュバント、肥料、又は微量栄養素、及び他の防除剤（例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、薬害軽減剤（safeners））を、活性物質又は該活性物質を含む組成物にプレミックスとして添加するか、又は適切な場合は使用直前までではなくて添加することができる（タンクミックス）。これらの剤は、本発明による組成物と1：100～100：1、好ましくは1：10～10：1の重量比で混合することができる。

【0316】

使用者は、通常、本発明による組成物を前投与装置、ナップザックスプレー器、スプレータンク、スプレー散布機（spray plane）、又は灌漑システムから適用することができる。通常、農薬組成物は、所望の適用濃度までの水、緩衝液、及び／又は更なる助剤で構成され、したがって、すぐに使用できる状態の本発明によるスプレー液又は農薬組成物が得られる。通常、農業用有用面積1ヘクタールあたり、20～6000リットル、好ましくは35～1000リットル、より好ましくは50～500リットルのすぐに使用できる状態のスプレー液が適用される。

【0317】

一実施形態によれば、キットの一部又は二元若しくは三元混合物の一部などの本発明に

よる組成物の個々の成分は、スプレータンク内で使用者自身によって混合してもよく、必要に応じて更に助剤を加えてもよい。

【0318】

したがって、本発明の化合物及び組成物は、畑作物を植食性無脊椎動物害虫から保護するために農学的に有用であり、他の園芸作物及び植物を植食性無脊椎動物害虫から保護するために非農学的にも有用である。この有用性には、有利な形質を提供するために遺伝子工学によって導入された（すなわち、トランスジェニック）又は突然変異誘発によって改変された遺伝物質を含む作物及び他の植物（すなわち、農学的及び非農学的の両方）の保護が含まれる。

【0319】

本発明の化合物は、好ましい代謝及び／又は土壌残留パターンによって特徴付けられ、一連の農学的及び非農学的無脊椎動物害虫を防除する活性を示す。本発明の化合物は、低い適用量であっても、害虫駆除の分野において予防的及び／又は治療的に価値のある活性成分であり、該活性成分は、昆虫及びダニなどの防除剤耐性害虫に対して使用することができ、温血種、魚類、及び植物によって十分に許容される。

【0320】

本発明の文脈において、「無脊椎動物害虫の駆除」とは、害虫によって引き起こされる食餌又は他の傷害若しくは損害の有意な減少を引き起こす無脊椎動物害虫の発生（死亡率を含む）の阻害を意味する。（関連する表現は同様に規定される。）本発明において言及されるように、「無脊椎動物害虫」という用語は、害虫として経済的に重要な節足動物、腹足類、及び線虫を含む。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ダンゴムシ、及びコムカデが含まれる。

【0321】

「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジ、及び他の柄眼類が含まれる。「蠕虫」という用語には、回虫、犬糸状虫、植食性線虫（線虫綱（Nematoda））、吸虫（吸虫綱（Tematoda））、鉤頭虫、条虫（条虫綱（Cestoda））などのすべての蠕虫が含まれる。当業者は、すべての化合物がすべての害虫に対して等しく有効であるとは限らないことを認識するであろう。

【0322】

本発明の化合物は、森林、温室、苗、観賞用植物、草、食品及び繊維、公衆及び動物衛生、家庭用及び商業用構造物、家庭用及び貯蔵製品の害虫における経済的に重要な農学的害虫に対して活性を示す。これらには、アワヨトウ幼虫、ヨトウムシ、シャクトリムシ、及びヘリオチン（*heliothine*）などの鱗翅目の幼虫が含まれる

【0323】

（例えば、ツマジロクサヨトウ（*fall armyworm*）（*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith）、シロイチモンジヨトウ（*beet armyworm*）（*Spodoptera exigua* Hubner）、タマナヤガ（*black cutworm*）（*Agrotis ipsilon* Hufnagel）、イラクサギンウワバ（*cabbage looper*）（*Trichoplusia ni* Hubner）、ニセアメリカタバコガ（*tobacco budworm*）（*Heliothis virescens* Fabricius））；

【0324】

メイガ科の穿孔虫、ケースベアラー（*case bearer*）、ウェブワーム、及びコーンワーム（*coneworm*）、アオムシ、及びスケルトナイザー（*skeletonizer*）（例えば、ヨーロッパアワノメイガ（*European corn borer*）（*Ostrinia nubilalis* Hubner）、ネーベルオレンジワーム（*navel orangeworm*）（*Amyelois transitella* Walker）、コーンルートウェブワーム（*corn root webworm*）（*Crambus caliginosellus* Clemens）、及びソッドウェブワーム（*sod webworm*）（*Herpetogramma licarsisalis* W

10

20

30

40

50

alker)) ;

【0325】

ハマキガ科のリーフリハー (leaf roller)、青虫、及びシードワーム (seed worm)、及びフルーツワーム (fruit worm) (例えば、コドリング (codling moth) (*Cydia pomonella* Linnaeus)、グレープベリーガ (grape berry moth) (*Endopiza viteana* Clemens)、ナシヒメシンクイ (oriental fruit moth) (*Grapholita molesta* Busck)) ;

【0326】

並びに他の多くの経済的に重要な鱗翅目 (例えば、コナガ (diamondback moth) (*Plutella xylostella* Linnaeus)、ワタアカミムシ (pink bollworm) (*Pectinophora gossypiella* Saunders)、マイマイガ (gypsy moth) (*Lymantria dispar* Linnaeus)) ;

【0327】

チャバネゴキブリ科及びゴキブリ科のゴキブリを含むゴキブリ目の若虫及び成虫 (例えば、オリエンタルゴキブリ (oriental cockroach) (*Blatta orientalis* Linnaeus)、アジアゴキブリ (Asian cockroach) (*Blattella asahinai* Mizukubo)、チャバネゴキブリ (German cockroach) (*Blattella germanica* Linnaeus)、チャオビゴキブリ (brownbanded cockroach) (*Supella longipalpa* Fabricius)、ワモンゴキブリ (American cockroach) (*Periplaneta americana* Linnaeus)、ブラウンコックローチ (brown cockroach) (*Periplaneta brunnea* Burmeister)、マデイラゴキブリ (Madeira cockroach) (*Leucophaea maderae* Fabricius)) ;

【0328】

ヒゲナガゾウムシ科、マメゾウムシ科、及びゾウムシ科のゾウムシを含む、鞘翅目の葉の摂食幼虫及び成虫 (例えば、ワタミハナゾウムシ (boll weevil) (*Anthonomus grandis* Boheman)、イネミズゾウムシ (rice water weevil) (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、グラナリアコクゾウムシ (granary weevil) (*Sitophilus granarius* Linnaeus)、コクゾウムシ (rice weevil) (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)) ;

【0329】

ハムシ科のノミハムシ、キューカンバービートル (cucumber beetle)、ルートワーム、ハムシ、ポテトビートル (potato beetle)、及び潜葉虫 (例えば、コロラドハムシ (Colorado potato beetle) (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、ウェスタンコーンルートワーム (western corn rootworm) (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)) ;

【0330】

コガネムシ科のコガネムシ及び他の甲虫 (例えば、マメコガネ (Japanese beetle) (*Popillia japonica* Newman) 及びヨーロッパコガネムシ (European chafer) (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)) ;

【0331】

カツオブシムシ科 (Dermestidae) のカツオブシムシ (carpet beetle) ;

10

20

30

40

50

【0332】

キクイムシ科 (Elateridae) のコメツキムシ幼虫 (wireworm) ;

【0333】

キクイムシ科 (Scolytidae) のキクイムシ (bark beetle)、及びコミムシダマシ科 (Tenebrionidae) のコクヌストモドキ (flour beetle))。更に、これには、クギヌキハサミムシ科 (Forficulidae) のハサミムシ (earwig) を含む、ハサミムシ目の成虫及び幼虫 (例えば、ヨーロッパハサミムシ (European earwig) (Forficula auricularia Linnaeus)、ブラックイアーウィグ (black earwig) (Chelisoches mono Fabricius)) ;

10

【0334】

半翅目の成虫及び若虫、例えば、メクラカメムシ科 (Miridae) のカスミカメムシ (plant bug)、セミ科 (Cicadidae) のセミ (cicada)、ヒメヨコバイ科 (Cicadellidae) のヨコバイ (leafhopper) (例えば、Empoasca spp.)、ビワハゴロモ上科 (Fulgoroidea) 及びウンカ科 (Delphacidae) のウンカ (planthopper)、ツノゼミ科 (Membracidae) のツノゼミ (treehopper)、キジラミ科 (Psyllidae) のキジラミ (psyllid)、コナジラミ科 (Aleyrodidae) のコナジラミ (whitefly)、アブラムシ科 (Aphididae) のアブラムシ (aphid)、フィロキセラ科 (Phylloxeridae) のフィロキセラ (phylloxera)、コナカイガラムシ科 (Pseudococcidae) のコナカイガラムシ (mealybug)、カタカイガラムシ科 (Coccidae)、マルカイガラムシ科 (Diaspididae)、及びワタフキカイガラムシ科 (Margarodidae) のカイガラムシ (scale)、及びグンバイムシ科 (Tingidae) のグンバイムシ (lace bug)、カメムシ科のカメムシ (stink bug)、ナガカメムシ科 (Lygaeidae) のコバネナガカメムシ (cinch bug) (例えば、Blissus spp.)、及び他のマメゾウムシ (seed bug)、アワフキムシ科 (Cercopidae) のアワフキムシ (spittlebug)、ヘリカメムシ科 (Coreidae) のヘリカメムシ (squash bug)、及びホシカメムシ科 (Pyrrhocoridae) のアカホシカメムシ (red bug)、及びコッ

トンストレイナー (cotton stainer) が含まれる。アラカイ目の成虫及び幼虫、例えば、ハダニ科 (Tetranychidae) のハダニ (spider mite) 及びアカダニ (red mite) (例えば、リンゴハダニ (European red mite) (Panonychus ulmi Koch)、ナミハダニ (two spotted spider mite) (Tetranychus urticae Koch)、マクダニエルダニ (McDaniel mite) (Tetranychus mcdanieli McGregor)、ヒメハダニ科 (Tenuipalpidae) のフラットマイト (flat mite) (例えば、シトラスフラットマイト (citrus flat mite) (Brevipalpus lewisi McGregor))、及びフシダニ科 (Eriophyidae) のサビダニ (rust mite) 及びブッドマイト (bud mite)、並びに他の葉摂食ダニ及びヒト及び動物の健康に重要なダニ、すなわち、ヒョウヒダニ科 (Epidermoptidae) のイエダニ (dust mite)、ニキビダニ科 (Demodicidae) のニキビダニ (follicle mite)、ニクダニ科 (Glycyphagidae) のコナダニ (grain mite)、マダニ目 (Ixodidae) のダニ (例えば、シカダニ (deer tick) (Ixodes scapularis Say)、オーストラリアンパラリシスチック (Australian paralysis tick) (Ixodes holocyclus Neumann)、アメリカイヌダニ (American dog tick) (Dermacentor variabilis Say)、マダニローンスターマダニ (lone star tick) (Amblyomma americ

20

30

40

50

anum Linnaeus)、並びにヒゼンダニ科 (Psoroptidae)、シラミダニ科 (Pyemotidae)、及びヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) のヒゼンダニ (scab mite) 及びヒゼンダニ (itch mite) ;

【0335】

バッタ (grasshopper)、イナゴ (locust)、及びコオロギ (cricket) (例えば、移動性バッタ (例えば、*Melanoplus sanguinipes* Fabricius、*M. differentialis* Thomas)、アメリカバッタ (American grasshopper) (例えば、*Schistocerca americana* Drury)、サバクバッタ (desert locust) (*Schistocerca gregaria* Forskal)、トノサマバッタ (migratory locust) (*Locusta migratoria* Linnaeus)、イエコオロギ (house cricket) (*Acheta domestica* Linnaeus)、ケラ (mole cricket) (*Gryllotalpa* spp.)) を含む、直翅目の成虫及び幼虫 ;

【0336】

リーフマイナー (leafminer)、ブヨ (midge)、ミバエ (fruit fly) (ミバエ科 (Tephritidae))、フリットフライ (frit fly) (例えば、*Oscinella frit* Linnaeus)、土壌ウジ虫 (soil maggot)、イエバエ (house fly) (例えば、*Musca domestica* Linnaeus)、小イエバエ (lesser house fly) (例えば、*Fannia canicularis* Linnaeus、*F. femoralis* Stein)、サシバエ (stable fly) (例えば、*Stomoxys calcitrans* Linnaeus)、イエバエ (face fly)、ツノサシバエ (horn fly)、クロバエ (blow fly) (例えば、*Chiysomya* spp.、*Phonnia* spp.)、及び他のキンバエ (muscoid fly) 害虫、アブ (horse fly) (例えば、*Tabanus* spp.)、ウマバエ (botfly) (例えば、*Gastrophilus* spp.、*Oestrus* spp.)、ウシバエ (cattle grub) (例えば、*Hypoderma* spp.)、メクラアブ (deer fly) (例えば、*Chrysops* spp.)、ヒツジシラミバエ (ked) (例えば、*Melophagus ovinus* Linnaeus)、及び他のハエ亜目 (Brachycera)、蚊 (例えば、*Aedes* spp.、*Anopheles* spp.、*Culex* spp.)、ブユ (例えば、*Prosimulium* spp.、*Simulium* spp.)、ヌカカ (biting midge)、サシチョウバエ (sand fly)、クロバネキノコバエ (sciarid)、並びに他のカ亜目 (Nematocera) を含む、双翅目の成虫及び幼虫 ;

【0337】

ネギアザミウマ (onion thrip) (*Thrips tabaci* Lindeman)、並びに他の葉摂食アザミウマを含む、アザミウマ目の成虫及び幼虫 ;

【0338】

アリ (例えば、red carpenter ant (*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、クロオオアリ (black carpenter ant) (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer)、イエヒメアリ (Pharaoh ant) (*Monomorium pharaonis* Linnaeus)、チビヒアリ (little fire ant) (*Wasmannia auropunctata* Roger)、ヒアリ (fire ant) (*Solenopsis geminata* Fabricius)、アカヒアリ (red imported fire ant) (*Solenopsis invicta* Buren)、アルゼンチンアリ (Argentine ant) (*Iridomyrmex humilis* Mayr)、アシナガキアリ (crazy ant) (*Paratrechina longicornis* Latreille)、トビイロシワアリ (pavement ant

10

20

30

40

50

) (*Tetramorium caespitum* Linnaeus)、ヒメトビイロケアリ (*cornfield ant*) (*Lasius alienus* Förster)、コヌカアリ (*odorous house ant*) (*Tapinoma sessile* Say)、ハチ (クマバチ (*carpenter bee*) を含む)、スズメバチ (*hornet*)、スズメバチ (*yellow jacket*)、並びにカリバチ (*was p*) を含む、膜翅目の昆虫害虫；

【0339】

東洋地下シロアリ (*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西洋地下シロアリ (*western subterranean termite*) (*Reticulitermes hesperus* Banks)、台湾地下シロアリ (*Formosan subterranean termite*) (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西インドカンザイシロアリ (*West Indian drywood termite*) (*Incisitermes immigrans* Snyder)、並びに経済的に重要な他のシロアリを含む、等翅目の昆虫害虫；

【0340】

例えば、セイヨウシミ (*silverfish*) (*Lepisma saccharina* Linnaeus) 及びマダラシミ (*firebrat*) (*Thermobia domestica* Packard) を含む、シミ目 (*Thysanura*) の昆虫害虫、；

【0341】

アタマジラミ (*head louse*) (*Pediculus humanus capitis* De Geer)、コロモジラミ (*body louse*) (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus)、ニワトリハジラミ (*chicken body louse*) (*Menacanthus stramineus* Nitzsch)、イヌハジラミ (*dog biting louse*) (*Trichodectes canis* De Geer)、フラッフロウス (*fluff louse*) (*Goniocotes gallinae* De Geer)、コロモジラミ (*sheep body louse*) (*Bovicola ovis* Schrank)、ウシジラミ (*short-nosed cattle louse*) (*Haematopinus eurystemus* Nitzsch)、ウシホソジラミ (*long-nosed cattle louse*) (*Linognathus vituli* Linnaeus)、並びにヒト及び動物を攻撃する他の吸啜及び刺突寄生シラミを含む、ハジラミ目の昆虫害虫；

【0342】

ケオプスネズミノミ (*oriental rat flea*) (*Xenopsylla cheopis* Rothschild)、ネコノミ (*cat flea*) (*Ctenocephalides felis* Bouche)、イヌノミ (*dog flea*) (*Ctenocephalides canis* Curtis)、ニワトリノミ (*hen flea*) (*Ceratophyllus gallinae* Schrank)、ニワトリフトノミ (*sticktight flea*) (*Echidnophaga gallinacea* Westwood)、ヒトノミ (*human flea*) (*Pulex irritans* Linnaeus) 及び哺乳動物及び鳥類を攻撃する他のノミを含むノミ目 (*Siphonoptera*) の昆虫害虫が含まれる。包含される追加の節足動物害虫には、クモ目のクモ、例えば、ドクイトグモ (*brown recluse spider*) (*Loxosceles reclusa* Gertsch and Mulaik)、及びクロゴケグモ (*black widow spider*) (*Latrodectus mactans* Fabricius)、並びにゲジ目のムカデ、例えば、ゲジ (*house centipede*) (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus) が含まれる。活性には、円虫目、回虫目、蟯虫目、かん線虫目、旋尾線虫目、及びエノブルス目の経済的に重要なメンバーを含む、線虫綱、条虫綱、吸虫綱、及び鉤頭虫綱のメンバー、例えば、限定されないが、経済的に重要な農業害虫 (すなわち、ネコブ線虫属 (

10

20

30

40

50

Meloidogyne) のネコブ線虫 (root knot nematode)、ネグサレ線虫属 (Pratylenchus) の斑線虫 (lesion nematode)、ユミハリ線虫 (Trichodorus) のユミハリ線虫 (stubby root nematode) など)、並びに動物及びヒトの健康害虫 (すなわち、すべての経済的に重要な吸虫、条虫、及び回虫、例えば、ウマにおける普通円虫 (Strongylus vulgaris)、イヌにおける犬回虫 (Toxocara canis)、ヒツジにおける捻転胃虫 (Haemonchus contortus)、イヌにおける犬糸状虫 (Dirofilaria immitis Leidy)、ウマにおける葉状条虫 (Anoplocephala peifoliata)、反芻動物における蛭状吸虫 (Fasciola hepatica Linnaeus) など) も含まれる。

10

【0343】

本発明の化合物は、鱗翅目の害虫 (例えば、Alabama argillacea Hubner (コットンリーフワーム (cotton leaf worm))、Archips argyrospila Walker (フルーツツリーハマキガ (fruit tree leaf roller))、A. rosana Linnaeus (ヨーロピアンリーフローラー (European leaf roller))、及び他の Archips spp.、Chilo suppressalis Walker (ニカメイガ (rice stem borer))、Cnaphalocrosis medinalis Guenee (ハマキガ (rice leaf roller))、Crambus caliginosellus Clemens (コーンルートウェブワーム (corn root webworm))、Crambus teterrellus Zincken (ブルーグラスウェブワーム (bluegrass webworm))、Cydia pomonella Linnaeus (コドリリング (codling moth))、Earias insulana Boisduval (スピニーボールワーム (spiny bollworm))、Earias vittella Fabricius (スポッティッドブルーワーム (spotted bollworm))、Helicoverpa armigera Hubner (アメリカンブルーワーム (American bollworm))、Helicoverpa zea Boddie (アメリカタバコガ幼虫 (corn earworm))、Heliothis virescens Fabricius (ニセアメリカタバコガ (tobacco budworm))、Herpetogramma licarsialis Walker (ソッドウェブワーム (sod webworm))、Lobesia botrana Denis 及び Schiffenuller (グレープベリーモス (grape berry moth))、Pectinophora gossypiella Saunders (ワタアカミムシ (pink bollworm))、Phyllocnistis citrella Stainton (ミカンハモグリガ (citrus leafminer))、Pieris brassicae Linnaeus (ラージホワイタバタフライ (large white butterfly))、Pieris rapae Linnaeus (スモールホワイタバタフライ (small white butterfly))、Plutella xylostella Linnaeus (コナガ (diamondback moth))、Spodoptera exigua Hubner (シロイチモンジヨトウ (beet armyworm))、Spodoptera litura Fabricius (ハスモンヨトウ (tobacco cutworm))、ハスモンヨトウ (cluster caterpillar))、Spodoptera frugiperda J. E. Smith (ツマジロクサヨトウ (fall armyworm))、Trichoplusia ni Hubner (イラクサギンウワバ (cabbage looper))、並びに Tuta absoluta Meyrick (トマトキバガ (tomato leafminer)) に対して特に高い活性を示す。

20

30

40

【0344】

本発明の化合物はまた、以下を含む、同翅目のメンバーに対して商業的に有意な活性を

50

有する：*Acyrtthisiplionpisum* Harris (エンドウヒゲナガア
 ブラムシ (pea aphid))、*Aphis craccivora* Koch (マメ
 アブラムシ (cowpea aphid))、*Aphis fabae* Scopoli (マ
 メクロアブラムシ (black bean aphid))、*Aphis gossypii*
Glover (ワタアブラムシ (cotton aphid))、メロンアブラムシ (m
 elon aphid))、*Aphis pomi* De Geer (リンゴアブラムシ (a
 pple aphid))、*Aphis spiraeicola* Patch (シモツケア
 ブラムシ (spirea aphid))、*Aulacorthum solani* Ka
 ltenbach (ジャガイモヒゲナガアブラムシ (foxglove aphid))
 、*Chaetosiphonfragaefolii* Cockerell (イチゴアブ
 ラムシ (strawberry aphid))、*Diuraphis noxia* Ku
 rdjumov/Mordvilko (ロシアコムギアブラムシ (Russian wh
 eat aphid))、*Dysaphis plantaginea* Paaserin
 i (オオバコアブラムシ (rosy apple aphid))、*Eriosoma l*
anigerum Hausmann (リンゴアブラムシ (woolly apple a
 phid))、*Hyalopterus pruni* Geoffroy (モモコフキアブ
 ラムシ (mealy plum aphid))、*Lipaphis erysimi* K
 altenbach (ニセダイコンアブラムシ (tarnip aphid))、*Met*
opolophium dirrhodum Walker (穀類アブラムシ (cerea
 l aphid))、*Macrosipum euphorbiae* Thomas (ジャ
 ガイモヒゲナガアブラムシ (pqtato aphid))、*Myzus persicae*
Sulzer (ピーチポテトアブラムシ (peach-potato aphid))、モ
 モアカアブラムシ (green peach aphid))、*Nasonovia ri*
bisnigri Mosley (レタスヒゲナガアブラムシ (lettuce aphid))、*Pemphigus* spp. (ルーツアフィッド (root aphid) 及び
 ガルアフィッド (gall aphid))、*Rhopalosiphum maidis*
Fitch (トウモロコシアブラムシ (corn leaf aphid))、*Rhopa*
losiphumpadi Linnaeus (バードチェリー-オートアートアフィッ
 ド (bird cherry-oat aphid))、*Schizaphis gram*
inum Rondani (ムギミドリアブラムシ (greenbug))、*Sitob*
ion avenae Fabricius (イングリッシュグレインアフィッド (Eng
 lish grain aphid))、*Therioaphis maculata* B
 uckton (マダラアルファルファアブラムシ (spotted alfalfa ap
 hid))、*Toxoptera aurantii*、*Boyer de Fonscol*
ombe (コミカンアブラムシ (black citrus aphid))、及び *Tox*
optera citiicida Kirkaldy (ミカンクロアブラムシ (brow
 n citrus aphid))；*Adelges* spp. (カサアブラムシ (ade
 lgid))；*Phylloxera devastatrix* Pergande (ペカ
 ンフィロキセラ (pecan phylloxera))；*Bemisia tabaci*
Gennadius (タバコホワイトフライ (tobacco whitefly))、ワ
 タコナジラミ (sweetpotato whitefly))、*Bemisia arg*
entifolii Bellows 及び *Perring* (シルバーリーフコナジラミ (s
 ilver leaf whitefly))、*Dialeurodes citri*
Ashmead (ミカンコナジラミ (citrus whitefly)) 及び *Tria*
leurodes vaporariorum Westwood (オンシツコナジラミ (g
 reenhouse whitefly))；*Empoasca fabae* Harr
 is、(ポテトリーフホッパー (potato leafhopper))、*Laode*
lphax striatellus Fallen (メトビウンカ (smaller b
 rown planthopper))、*Macrolestes quadriline*
atus Forbes (アスターリーフホッパー (aster leafhopper))

10

20

30

40

50

)、*Nephotettix cincticeps* Uhler (グリーンリーフホッパー (green leafhopper))、*Nephotettix nigropictus* Stal (ライスリーフホッパー (rice leafhopper))、*Nilaparvata lugens* Stal (ブラウンプラントホッパー (brown planthopper))、*Peregrinus maidis* Ashmead (コーンプラントホッパー (corn planthopper))、*Sogatella furcifera* Horvath (セジロウンカ (white-backed planthopper))、*Sogatodes orizicola* Muir (ライスデルファシッド (rice delphacid))、*Typhlocyba pomaria* McAfee ホワイトアップルリーフホッパー (white apple leafhopper)、*Erythroneura* spp. (グレープリーフホッパー (grape leafhopper))；*Magicicada septendecim* Linnaeus (ピリオディカルシケイダ (periodical cicada))；*Icerya purchasi* Maskell (ワタフキカイガラムシ (cottony cushion scale))、*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (サンホセカイガラムシ (San Jose scale))；*Planococcus citri* Risso (ミカンコナカイガラムシ (citrus mealybug))；*Pseudococcus* spp. (アザメアリーバグコンプレックス (other mealybug complex))；*Cacopsylla pyricola* Foerster (フタホシナシキジラミ (pear psylla))、*Trioza diospyri* Ashmead (パーシモンスイラ (persimmon psylla))。

【0345】

これらの化合物は、以下を含む半翅目のメンバーにも活性を有する：*Acrostemum hilare* Say (グリーンスティンクバグ (green stink bug))、*Anasa tristis* De Geer (スクワッシュバグ (squash bug))、*Blissus leucopterus leucopterus* Say (チンチバグ (chinch bug))、*Corythuca gossypii* Fabricius (コットンレースバグ (cotton lace bug))、*Cyrtopeltis modesta* Distant (トマトバグ (tomato bug))、*Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (コットンステイナー (cotton stainer))、*Euchistus servus* Say (ブラウンスティンクバグ (brown stink bug))、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (ワンスポティッドスティンクバグ (one-spotted stink bug))、*Graptosthetus* spp. (コンプレックスオブシードバグ (complex of seed bug))、*Leptoglossus corculus* Say (リーフフットドパインシードバグ (leaf-footed pine seed bug))、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (ターニッシュトプラントバグ (tarnished plant bug))、*Nezara viridula* Linnaeus (サザングリーンスティンクバグ (southern green stink bug))、*Oebalus pugnax* Fabricius (ライススティンクバグ (rice stink bug))、*Oncopeltus fasciatus* DaEas (ラージミルクウィードバグ (large milkweed bug))、*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (ワタノミハムシ (cotton fleahopper))。

【0346】

本発明の式 (I) の化合物によって防除される他の昆虫には、以下が含まれる：アザミウマ目 (例えば、*Frankliniella occidentalis* Pergande (ミカンキイロアザミウマ (western flower thrip))、*Sci*

10

20

30

40

50

rthothrips citri Moulton (シトラススリップス (*citrus thrip*)), *Sericothrips variabilis* Beach (ダイズアザミウマ (*soybean thrip*)), 及び *Thrips tabaci* Lindeman (ネギアザミウマ (*onion thrip*)); 及び他の鞘翅目 (例えば、*Leptinotarsa decemlineata* Say (コロラドハムシ (*Colorado potato beetle*)), *Epilachna varivestis* Mulsant (インゲンテントウ (*Mexican bean beetle*)) 及びアグリオテス属、アトウス (*Athous*) 属、又はリモニウス属のコメツキムシ幼虫)。

【0347】

特に、式 (I) の化合物、その N-オキシド、その異性体、その多形体、及びその塩は、以下の害虫を効果的に防除するのに特に適している：

【0348】

鱗翅目の昆虫 (鱗翅目)、例えば、*Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo infuscatellus*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholita funebrana*, *Grapholita molesta*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa virescens*, *Helicoverpa zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hypomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Leucinodes orbonalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scirpophaga incertulas*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Thaumtopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* 及び *Zeiraphera canadensis*; 及び

【0349】

甲虫（甲虫目）、例えば *Agrius sinuatus*、*Agriotes lineatus*、*Agriotes obscurus*、*Amphimallus solstitialis*、*Anisandrus dispar*、*Anthonomus grandis*、*Anthonomus pomorum*、*Aphthona euphoridae*、*Athous haemorrhoidalis*、*Atomaria linearis*、*Blastophagus piniperda*、*Blitophaga undata*、*Bruchus rufimanus*、*Bruchus pisorum*、*Bruchus lentis*、*Byctiscus betulae*、*Cassida nebulosa*、*Cerotoma trifurcata*、*Cetonia aurata*、*Ceuthorrhynchus assimilis*、*Ceuthorrhynchus napi*、*Chaetocnema tibialis*、*Conoderus vesperinus*、*Crioceris asparagi*、*Ctenicera ssp.*、*Diabrotica longicornis*、*Diabrotica semipunctata*、*Diabrotica undecimpunctata* *Diabrotica speciosa*、*Diabrotica virgifera*、*Epilachna varivestis*、*Epitrix hirtipennis*、*Eutinobothrus brasiliensis*、*Hylobius abietis*、*Hypera brunneipennis*、*Hypera postica*、*Ips typographus*、*Lema bilineata*、*Lema melanopus*、*Leptinotarsa decemlineata*、*Limonius californicus*、*Lissorhoptrus oryzophilus*、*Melanotus communis*、*Meligethes aeneus*、*Melolontha hippocastani*、*Melolontha melolontha*、*Oulema oryzae*、*Otiorrhynchus sulcatus*、*Otiorrhynchus ovatus*、*Phaedon cochleariae*、*Phyllobius pyri*、*Phyllotreta chrysocephala*、*Phyllophaga sp.*、*Phyllopertha horticola*、*Phyllotreta nemorum*、*Phyllotreta striolata*、*Popillia japonica*、*Sitona lineatus*及び*Sitophilus granaria*;

【0350】

ハエ、蚊（双翅目）、例えば、*Aedes aegypti*、*Aedes albopictus*、*Aedes vexans*、*Anastrepha ludens*、*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*、*Anopheles gambiae*、*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*、*Anopheles minimus*、*Anopheles quadrimaculatus*、*Calliphora vicina*、*Ceratitis capitata*、*Chrysomya bezziana*、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、*Chrysops discalis*、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomyia hominivorax*、*Contarinia sorghicola*、*Cordylobia anthropophaga*、*Culicoides furens*、*Culex pipiens*、*Culex nigripalpus*、*Culex quinquefasciatus*、*Culex tarsalis*、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dacus cucurbitae*、*Dacus oleae*、*Dasineura brassicae*、*Delia antiqua*、*Delia coarctata*、*Delia platura*、*Delia radicum*、*Dermatobia hominis*、*Fannia canicularis*、*Geomyza tripunctata*、*Gasterophilus intestinalis*、*Glossina morsitans*、*Glossina palpalis*

、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates* spp.、*Hylemyia platura*、*Hypoderma lineata*、*Leptoconops torrens*、*Liriomyza sativae*、*Liriomyza trifolii*、*Lucilia caprina*、*Lucilia cuprina*、*Lucilia sericata*、*Lycoria pectoralis*、*Mansonina titillans*、*Mayetiola destructor*、*Musca autumnalis*、*Musca domestica*、*Muscina stabulans*、*Oestrus ovis*、*Opomyza florum*、*Oscinella frit*、*Pegomya hysocyami*、*Phorbia antiqua*、*Phorbia brassicae*、*Phorbia coarctata*、*Phlebotomus argentipes*、*Psorophora columbiae*、*Psila rosae*、*Psorophora discolor*、*Prosimulium mixtum*、*Rhagoletis cerasi*、*Rhagoletis pomonella*、*Sarcophaga haemorrhoidalis*、*Sarcophaga* spp.、*Simulium vittatum*、*Stomoxys calcitrans*、*Tabanus bovinus*、*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、及び *Tabanus similis*、*Tipula oleracea*、及び *Tipula paludosa*；
【0351】

10

20

シロアリ（等翅目）、例えば、*Calotermes flavicollis*、*Leucotermes flavipes*、*Heterotermes aureus*、*Reticulitermes flavipes*、*Reticulitermes virginicus*、*Reticulitermes lucifugus*、*Reticulitermes santonensis*、*Reticulitermes grassei*、*Termes natalensis*、及び *Coptotermes formosanus*；

【0352】

ゴキブリ（網翅目）、例えば、*Blattella germanica*、*Blattella asahinae*、*Periplaneta americana*、*Periplaneta japonica*、*Periplaneta brunnea*、*Periplaneta fuliginosa*、*Periplaneta australasiae*、及び *Blatta orientalis*；

30

【0353】

アリ、ハチ（bee）、ハチ（wasp）、ハバチ（膜翅目）、例えば、*Athalia rosae*、*Atta cephalotes*、*Atta capiguara*、*Atta cephalotes*、*Atta laevigata*、*Atta robusta*、*Atta sexdens*、*Atta texana*、*Crematogaster* spp.、*Hoplocampa minuta*、*Hoplocampa testudinea*、*Lasius niger*、*Monomorium pharaonis*、*Solenopsis geminata*、*Solenopsis invicta*、*Solenopsis richteri*、*Solenopsis xyloni*、*Pogonomyrmex barbatus*、*Pogonomyrmex californicus*、*Phaidole megacephala*、*Dasymutilla occidentalis*、*Bombus* spp.、*Vespula squamosa*、*Paravespula vulgaris*、*Paravespula pennsylvanica*、*Paravespula germanica*、*Dolichovespula maculata*、*Vespa crabro*、*Polistes rubiginosa*、*Camponotus floridanus*、及び *Linepithema humile*；

40

【0354】

50

コオロギ、バッタ、イナゴ（直翅目）、例えば、*Acheta domestica*、*Gryllotalpa gryllotalpa*、*Locusta migratoria*、*Melanoplus bivittatus*、*Melanoplus femurrubrum*、*Melanoplus mexicanus*、*Melanoplus sanguinipes*、*Melanoplus spretus*、*Nomadacris septemfasciata*、*Schistocerca americana*、*Schistocerca gregaria*、*Dociostaurus maroccanus*、*Tachycines asynamorus*、*Oedaleus senegalensis*、*Zonozelus variegatus*、*Hieroglyphus daganensis*、*Kraussaria angulifera*、*Calliptamus italicus*、*Chortoicetes terminifera*、及び *Locustana pardalina*；

コガネグモ科、例えば、*Latrodectus mactans*、及び *Loxosceles reclusa*；

【0355】

ノミ（ノミ目）、例えば、*Ctenocephalides felis*、*Ctenocephalides canis*、*Xenopsylla cheopis*、*Pulex irritans*、*Tunga penetrans*、及び *Nosopsyllus fasciatus*、セイヨウシミ、マダラシミ（シミ目）、例えば、*Lepisma saccharina* 及び *Thermobia domestica*、ムカデ（ムカデ目）、例えば、*Scutigera oleoptrata*、ヤスデ類（ヤスデ目）、例えば、*Narceus* spp.、ハサミムシ（ハサミムシ目）、例えば、*forficula auricularia*、シラミ（シラミ目）、例えば、*Pediculus humanus capitis*、*Pediculus humanus corporis*、*Pthirus pubis*、*Haematopinus eurytetrus*、*Haematopinus suis*、*Linognathus vituli*、*Bovicola bovis*、*Menopon allinae*、*Menacanthus stramineus*、及び *Solenopotes capillatus*、トビムシ目（トビムシ）、例えば、*Onychiurus* spp.。

【0356】

本発明の式（I）の化合物は、線虫：植物寄生線虫（plant parasitic nematode）、例えば、ネコブ線虫（root knot nematode）、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne javanica*、及び他の *Meloidogyne* 種；シストフォーミングネマトード（cyst-forming nematode）、*Globodera rostochiensis*、及び他の *Globodera* 種；*Heterodera avenae*、*Heterodera glycines*、*Heterodera schachtii*、*Heterodera trifolii*、及び他の *Heterodera* 種；Seed gall nematodes、*Anguina* 種；茎及び葉の線虫（Stem and foliar nematode）、*Aphelenchoides* 種；*Sting* nematodes、*Belonolaimus longicaudatus* 及び他の *Belonolaimus* 種；パインネマトード（Pine nematode）、*Bursaphelenchus xylophilus* 及び他の *Bursaphelenchus* 種；リングネマトード（Ring nematode）、及び *Criconeema* 種、*Criconemella* 種、*Criconemoides* 種、*Mesocriconeema* 種；茎及び球根の線虫（Stem及びbulb nematode）、*Ditylenchus destructor*、*Ditylenchus dipsaci*、及び他の *Ditylenchus* 種；突錐線虫（Awl nematode）、*Dolichodorus* 種；スパイラルネマトード（Spiral nematode）、*Helicotylenchus multicinctus*、及び他の *He*

10

20

30

40

50

licotylenchus 種；鞘及び鞘様線虫 (*Sheath and sheathoid nematode*)、*Hemicycliophora* 種、及び *Hemicriconemoides* 種；*Hirshmanniella* 種；槍形線虫 (*Lance nematode*)、*Hoploaimus* 種；ニセネコブ線虫 (*false root knot nematode*)、*Nacobbus* 種；ハリ線虫 (*Needle nematode*)、*Longidorus elongatus*、及び他の *Longidorus* 種；リージョンネマトード (*Lesion nematode*)、*Pratylenchus neglectus*、*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus curvatus*、*Pratylenchus goodeyi*、及び他の *Pratylenchus* 種；バローイングネマトード (*Burrowing nematode*)、*Radopholus similis*、及び他の *Radopholus* 種；、レインフォームネマトード (*Reniform nematode*)、*Rotylenchus robustus*、及び他の *Rotylenchus* 種；*Scutellonema* 種；スタビールートネマトード (*Stubby root nematode*)、*Trichodorus primitivus* 及び他の *Trichodorus* 種、*Paratrachodorus* 種；スタントネマトード (*Stunt nematode*)、*Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus dubius*、及び他の *Tylenchorhynchus* 種；シトラスネマトード (*Citrus nematode*)、*Tylenchulus* 種；ダガーネマトード (*Dagger nematode*)、*Xiphinema* 種；並びに他の植物寄生線虫種を防除するのにも適している。

10

20

【0357】

式 (I) の化合物及びその塩は、クモ (*arachnid*) (クモ科 (*Arachnoidea*)、例えば、ヒメダニ科、マダニ科、ヒメダニ科などのクモ、例えば、*Amblyomma americanum*、*Amblyomma variegatum*、*Argas persicus*、*Boophilus annulatus*、*Boophilus decoloratus*、*Boophilus microplus*、*Dermacentor silvarum*、*Hyalomma truncatum*、*Ixodes ricinus*、*Ixodes rubicundus*、*Ornithodoros moubata*、*Otobius megnini*、*Dermanyssus gallinae*、*Psoroptes ovis*、*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*、*Sarcoptes scabiei*、及び *Eriophyidae* spp.、例えば、*Aculus schlechtendali*、*Phyllocoptera oleivora* 及び *Eriophyes sheldoni*；*Tarsonemidae* spp.、例えば、*Phytonemus pallidus* 及び *Polyphagotarsonemus latus*；*Tenuipalpidae* spp.、例えば、*Brevipalpus phoenicis*；*Tetranychidae* spp.、例えば、*Tetranychus cinnabarinus*、*Tetranychus kanzawai*、*Tetranychus pacificus*、*Tetranychus telarius* 及び *Tetranychus urticae*、*Panonychus ulmi*、*Panonychus citri*、並びに *Oligonychus pratensis* の防除にも有用である。

30

40

【0358】

本発明の一実施形態では、アザミウマ属、双翅目、及び半翅目、特に以下の種からの昆虫などの吸啜又は刺突昆虫から選択される昆虫を防除するのに有用である本発明は、式 (I) の化合物を提供する：

【0359】

アザミウマ属：*Frankliniella fusca*、*Frankliniella occidentalis*、*Frankliniella tritici*、*Scirtothrips citri*、*Thrips oryzae*、*Thrips palmi*、

50

及び *Thrips tabaci*、

【0360】

双翅目：*Aedes aegypti*、*Aedes albopictus*、*Aedes vexans*、*Anastrepha ludens*、*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*、*Anopheles gambiae*、*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*、*Anopheles minimus*、*Anopheles quadrimaculatus*、*Calliphora vicina*、*Ceratitis capitata*、*Chrysomya bezziana*、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、*Chrysops discalis*、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomyia hominivorax*、*Contarinia sorghicola*、*Cordylobia anthropophaga*、*Culicoides furens*、*Culex pipiens*、*Culex nigripalpus*、*Culex quinquefasciatus*、*Culex tarsalis*、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dacus cucurbitae*、*Dacus oleae*、*Dasi-neura brassicae*、*Delia antique*、*Delia coarctata*、*Delia platura*、*Delia radicum*、*Dermatobia hominis*、*Fannia canicularis*、*Geomyza Tri-punctata*、*Gasterophilus intestinalis*、*Glossina morsitans*、*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates* spp.、*Hylemyia platura*、*Hypoderma lineata*、*Leptoconops torrens*、*Liriomyza sativae*、*Liriomyza trifolii*、*Lucilia caprina*、*Lucilia cuprina*、*Lucilia sericata*、*Lycoria pectoralis*、*Mansonella titillans*、*Mayetiola destructor*、*Musca autumnalis*、*Musca domestica*、*Muscina stabulans*、*Oestrus ovis*、*Opomyza florum*、*Oscinella frit*、*Pegomya hysocyami*、*Phorbia antiqua*、*Phorbia brassicae*、*Phorbia coarctata*、*Phlebotomus argentipes*、*Psorophora columbiae*、*Psila rosae*、*Psorophora discolor*、*Prosimulium mixtum*、*Rhagoletis cerasi*、*Rhagoletis pomonella*、*Sarcophaga haemorrhoidalis*、*Sarcophaga* spp.、*Simulium vittatum*、*Stomoxys calcitrans*、*Tabanus bovinus*、*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、及び *Tabanus similis*、*Tipula oleracea*、並びに *Tipula paludosa*；

【0361】

半翅目、特に、アブラムシ：*Acyrtosiphon onobrychis*、*Adelges laricis*、*Aphidula nasturtii*、*Aphis fabae*、*Aphis forbesi*、*Aphis pomi*、*Aphis gossypii*、*Aphis grossulariae*、*Aphis schneideri*、*Aphis spiraecola*、*Aphis sambuci*、*Acyrtosiphon pisum*、*Aulacorthum solani*、*Brachycaudus cardui*、*Brachycaudus helichrysi*、*Brachycaudus persicae*、*Brachycaudus prunicola*、*Brevi*

10

20

30

40

50

coryne brassicae、Capitophorus horni、Cerosiphia gossypii、Chaetosiphon fragaefolii、Cryptomyzus ribis、Dreyfusia nordmanniana、Dreyfusia piceae、Dysaphis radicola、Dysaula corthum pseudosolani、Dysaphis plantaginea、Dysaphis pyri、Empoasca fabae、Hyalopterus pruni、Hyperomyzus lactucae、Macrosiphum avenae、Macrosiphum euphorbiae、Macrosiphon rosae、Megoura viciae、Melanaphis pyraeius、Metopolophium dirhodum、Myzodes persicae、Myzus ascalonicus、Myzus cerasi、Myzus varians、Nasonovia ribis-nigri、Nilaparvata lugens、Pemphigus bursarius、Perkinsiella saccharicida、Phorodon humuli、Psylla mali、Psylla piri、Rhopalomyzus ascalonicus、Rhopalosiphum maidis、Rhopalosiphum padi、Rhopalosiphum insertum、Sappaphis mala、Sappaphis mali、Schizaphis graminum、Schizoneura lanuginosa、Sitobion avenae、Trialeurodes vaporariorum、Toxoptera aurantii and、及びViteus vitifolii。

10

20

【0362】

一実施形態では、本発明は、生物学的に有効量の式（I）の化合物、及び殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、及び栄養素から選択される少なくとも1つの追加の生物学的に活性で適合性がある化合物を含む組成物を提供する。組成物において使用され、式（I）の化合物と組み合わせて使用される化合物は、活性で適合性がある化合物とも称する。

【0363】

既知及び報告されている殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、及び栄養素は、本開示の式（I）の少なくとも1つの化合物と組み合わせることができる。例えば、WO2016156129及び／又はWO2017153200で開示及び報告されている殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、及び栄養素は、少なくとも1つの本開示の式（I）の化合物と組み合わせることができる。

30

【0364】

WO2016156129及び／又はWO2017153200で報告されている殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤、生物農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、及び栄養素は、少なくとも1つの本開示の式（I）の化合物と組み合わせるための非限定的な例として参照として本明細書に組み込まれる。

【0365】

特に、本発明の化合物は、多成分防除剤を形成し、更に幅広い農業的有用性をもたらすために、殺虫剤、殺菌剤（fungicide）、殺線虫剤、殺細菌剤（bactericide）、殺ダニ剤、発根刺激剤などの成長調節剤、化学滅菌剤、情報化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物学的活性化合物、又は昆虫病原細菌、ウイルス、若しくは真菌を含むがこれらに限定されない、少なくとも1つの追加の生物学的に活性で適合性がある化合物（混合パートナー）と混合することができる。

40

【0366】

本発明の式（I）の化合物を組み合わせる／製剤化することができるそのような生物学的に活性な化合物又は剤／混合パートナーの例は、WO2019072906A1（第27～37頁）に開示されている。

50

【0367】

一実施形態では、本発明の化合物と混合するための生物学的薬剤には、*Bacillus thuringiensis*、*Bacillus thuringiensis* デルタ内毒素、並びにバキュロウイルス科のメンバー及び虫食性真菌を含む天然に存在する遺伝子改変ウイルス殺虫剤が含まれる。

【0368】

特定の例では、同様の防除スペクトルを有するが異なる作用機序を有する他の無脊椎動物害虫駆除化合物又は剤との組み合わせは、耐性の管理に特に有益である。したがって、本発明の組成物は、生物学的に有効な量の、同様の駆除スペクトルを有するが異なる作用機序を有する少なくとも1つの追加の無脊椎動物害虫駆除化合物又は剤を更に含むことができる。植物保護化合物（例えば、タンパク質）又は植物の遺伝子座を発現するように遺伝子改変された植物を生物学的に有効な量の本発明の化合物と接触させることも、より広いスペクトルの植物保護を提供し、耐性の管理に有益である。

【0369】

本発明の一実施形態では、組成物中の式（I）の化合物の生物学的に有効な量は、組成物の総重量に対して0.1重量%～99重量%、好ましくは組成物の総重量に対して5重量%～50重量%の範囲である。

【0370】

本発明は更に、無脊椎動物害虫を駆除する方法であって、無脊椎動物害虫、無脊椎動物害虫が成長する若しくは成長し得るその生息地、繁殖地、食物供給物、植物、種子、土壌、領域、材料、若しくは環境、又は害虫の攻撃若しくは侵入から保護される前記材料、植物、種子、土壌、表面、若しくは空間を生物学的に有効な量の本発明の化合物又は組成物と接触させることを含む、方法を提供する。

【0371】

無脊椎動物害虫は防除され、農業、園芸、及び／又は特殊作物、動物及び人間の健康の保護は、有効量の本発明の化合物のうちの1つ以上を農業的及び／又は非農業的な侵入場所を含む害虫の環境、保護される領域、又は駆除される害虫に直接に適用することによって達成される。したがって、本発明は、葉及び土壌に生息する無脊椎動物の防除並びに農業及び／又は非農業作物の保護のための方法であって、無脊椎動物又はその環境を、生物学的に有効な量の本発明の化合物のうちの1つ以上、若しくは少なくとも1つのそのような化合物を含む組成物、又は少なくとも1つのそのような化合物及び有効量の少なくとも1つの追加の生物学的に活性な化合物又は剤を含む組成物と接触させることを含む、方法を更に含む。接触の好ましい方法は、スプレーによるものである。或いは、本発明の化合物を含む粒状組成物を植物の葉又は土壌に適用することができる。本発明の化合物は、植物を、液体製剤の土壌浸漬、土壌への粒状製剤、育苗箱の処理、又は移植物の浸漬として適用される本発明の化合物を含む組成物と接触させることにより、植物の取り込みを介した送達において有効である。他の接触方法には、直接及び残留スプレー、空中スプレー、種子コーティング、マイクロカプセル化、全体的取り込み（systemic uptake）、餌、耳標、ボラス、噴霧器、燻蒸剤、エアロゾル、散粉（dust）、並びにその他多数のものによる、本発明の化合物又は組成物の適用が含まれる。

【0372】

本発明の化合物は、無脊椎動物によって消費される餌に、又はトラップなどの装置内に組み込むことができる。0.01～5%の活性成分、0.05～10%の保湿剤、及び40～99%の植物性小麦粉を含む顆粒又は餌は、非常に低い適用量で、特に、直接的な接触によらずに摂取による致死的な活性成分の用量で土壌昆虫を駆除するのに効果的である。本発明の化合物は、それらの純粋な状態で適用することができるが、ほとんどの場合、適用は、1つ以上の化合物を好適な担体、希釈剤、及び界面活性剤とともに含み、場合によっては、企図される最終用途に応じて食品と組み合わせた製剤の適用である。好ましい適用方法は、化合物の水分散液又は精製油溶液をスプレーすることを含む。スプレーオイル、スプレーオイル濃度、スプレッダー（spreader）、スティッカー（sticker）、アジュ

バント、他の溶媒、及びピペロニルブトキシドなどの相乗剤との組み合わせは、しばしば化合物の効力を高める。

【0373】

効果的な駆除に必要な適用量（すなわち「生物学的に有効な量」）は、防除される無脊椎動物の種、害虫のライフサイクル、ライフステージ、そのサイズ、場所、時期、宿主作物又は動物、摂食行動、配偶行動、周囲の水分、温度などの要因に応じて変動する。通常の下況下では、農業生態系における害虫を駆除するのに1ヘクタールあたり約0.01～2kgの活性成分の適用量で十分であるが、0.0001kg/ヘクタールで十分な場合もあり、又は8kg/ヘクタールが必要な場合もある。非農業用途の場合、有効な使用量は約1.0～50mg/平方メートルの範囲であるが、0.1mg/平方メートルで十分な場合もあれば、150mg/平方メートルが必要な場合もある。当業者は、所望のレベルの無脊椎動物害虫の駆除に必要な生物学的に有効な量を容易に決定することができる。

10

【0374】

動物害虫、すなわち、昆虫、クモ類、及び線虫、植物、植物が成長している土壌又は水を、当該技術分野で既知の適用方法によって、式(I)の化合物、そのN-オキシド及び塩、又はそれらを含む組成物と接触させることができる。したがって、「接触」には、直接的な接触（化合物/組成物を動物害虫又は植物に、典型的には植物の葉、茎、又は根に、直接的に適用する）及び間接的な接触（化合物/組成物を動物害虫又は植物の場所に適用する）の両方が含まれる。

【0375】

20

本発明の化合物又はこれを含む防除組成物は、植物/作物を寄生虫駆除的に有効な量の少なくとも1つの本発明の化合物と接触させることにより、成長中の植物及び作物を動物害虫、特に、昆虫、コナダニ、又はクモ類による攻撃又は侵入から保護するために使用され得る。「作物」という用語は、成長中の作物及び収穫された作物の両方を指す。

【0376】

一実施形態では、本発明は、無脊椎動物害虫による攻撃又は侵入から作物を保護するための方法であって、作物を生物学的に有効な量の本発明の化合物又は組成物、その異性体、多形体、N-オキシド、又は塩と接触させることを含む、方法を提供する。

【0377】

本発明の化合物は、昆虫又は植物、殺虫攻撃から保護される種子、土壌、表面、材料、若しくは部屋などの植物繁殖材料を殺虫に(insecticidally)有効な量の活性化合物で処理することによって、それ自体又は組成物の形態で使用される。適用は、植物、種子、土壌、表面、材料、又は部屋などの植物繁殖材料の昆虫による感染前及び感染後の両方で行うことができる。

30

【0378】

一実施形態では、本発明は、土壌昆虫からの種子の保護並びに土壌及び葉面昆虫からの実生の根及び芽の保護のための方法であって、播種前及び/又は予備発芽(pre-germination)後に種子を本発明の化合物又は組成物、そのN-オキシド、又は塩と接触させることを含む、方法を提供する。

【0379】

40

更に、本発明は、寄生虫による侵入又は感染に対して動物を治療又は保護するための方法であって、動物に生物学的に有効な量の本発明の化合物又は組成物、その異性体、多形体、N-オキシド、又は獣医学的に許容される塩を経口的、局所的、又は非経口的に投与又は適用することを含む、方法を提供する。

【0380】

作物植物の処理に使用する場合、本発明の化合物の適用量(適用有効投与量)は、農作物又は園芸作物1ヘクタールあたり1gai～5000gaiの範囲、好ましくは1ヘクタールあたり25g～600g、より好ましくは1ヘクタールあたり50g～500gの範囲であり得る。

【0381】

50

本発明の化合物及び組成物は、様々な栽培植物、例えば、穀物、根菜作物、油料作物、野菜、香辛料、観賞用植物、例えば、デュラム小麦及び他の小麦、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ（飼料用トウモロコシ（fodder maize）及び砂糖トウモロコシ／スイートコーン及び飼料用トウモロコシ（field corn））、大豆、油料作物、アブラナ、綿、ヒマワリ、バナナ、米、菜種、カブ、甜菜、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、草、芝生（lawn）、芝生（turf）、飼料草、トマト、ネギ、カボチャ（pumpkin）／カボチャ（squash）、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、カラシナ科種（Brassica species）、メロン、豆、エンドウ豆、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えば、ジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／ペラルゴニウム、パンジー、及びインパチェンス上の多数の昆虫の防除に特に有用である。

10

【0382】

特に、本発明の化合物又は組成物は、農作物、例えば、穀物、トウモロコシ、米、大豆及び他のマメ科植物、果実及び果実の木、ブドウ、ナッツ及びナッツの木、柑橘類及び柑橘類の木、任意の園芸植物、ウリ科植物、油含有植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、甜菜、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、コショウ、及び他の野菜、並びに観賞用植物を保護するのに有用である。

【0383】

本発明の化合物は、接触（土壌、ガラス、壁、ベッドネット、カーペット、植物部分、又は動物部分を介して）及び摂取（餌又は植物部分を介して）の両方を介して有効である。

【0384】

本発明の化合物はまた、アリ、シロアリ、ハチ、ハエ、蚊、コオロギ、又はゴキブリなどの非作物無脊椎動物害虫に対して適用され得る。上記非作物害虫に対して使用する場合、本発明の化合物は、好ましくは、餌組成物で使用される。

20

【0385】

餌は、液体、固体、又は半固体の調製物（例えば、ゲル）であり得る。固体餌は、それぞれの用途に好適な様々な形状及び形態、例えば、顆粒、ブロック、スティック、ディスクに形成することができる。液体餌は、適切な適用を確保するために様々なデバイス、例えば、蓋なし容器、スプレーデバイス、液滴源、又は蒸発源に充填することができる。を開く。ゲルは、水性又は油性のマトリックスに基づくことができ、粘着性、保湿性、又は経年劣化特性の観点から特定の必要性に合わせて製剤化することができる。

30

【0386】

組成物中で使用される餌は、アリ、シロアリ、ハチ、ハエ、蚊、コオロギなどの昆虫又はゴキブリがこれを食べるように刺激するのに十分に魅力的な製品である。魅力は、摂食刺激剤又は性フェロモンを使用して操作することができる。食品刺激剤は、例えば、限定されないが、動物及び／若しくは植物タンパク質（肉血粉、魚血粉、昆虫部分、卵黄）、動物及び／若しくは植物由来の油脂、或いは、特にスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、スターチ、ペクチン、又は更には糖蜜若しくは蜂蜜由来の単糖、オリゴ糖、又はポリ有機糖から選択される。果物、作物、植物、動物、昆虫、又はそれらの特定の部分の新鮮な部分又は腐敗部分も、摂食刺激剤として機能することができる。性フェロモンはより昆虫特異的であることが既知である。特定のフェロモンは文献に記載されており、当業者に既知である。

40

【0387】

餌組成物で使用する場合、活性成分の典型的な含有量は、0.001重量％～15重量％、望ましくは0.001重量％～5重量％の活性化合物である。

【0388】

エアロゾル（例えば、スプレー缶中）、オイルスプレー、又はポンプスプレーとしての本発明の化合物の製剤は、ハエ、ノミ、ダニ、蚊、又はゴキブリなどの害虫を防除するための非専門家の使用者に非常に好適である。エアロゾルのレシピは、好ましくは、活性化合物、溶媒、例えば、低級アルコール（例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール）、ケトン（例えば、アセトン、メチルエチルケトン）、約50～250℃

50

の沸点範囲を有するパラフィン炭化水素（例えば、ケロセン）、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素、例えば、トルエン、キシレン、水、更なる助剤、例えば、乳化剤、例えば、ソルビトールモノオレエート、3〜7molのエチレンオキシドを有するオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレート、香油、例えば、エーテル油、中鎖脂肪酸と低級アルコールとのエステル、芳香族カルボニル化合物、好適な場合、安定剤、例えば、安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル、並びに必要に応じて、推進剤、例えば、プロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、又はこれらの気体の混合物からなる。

【0389】

オイルスプレー製剤は、推進剤が使用されていないという点でエアロゾルのレシピと異なる。スプレー組成物で使用する場合、活性成分の含有量は、0.001〜80重量%、好ましくは0.01〜50重量%、最も好ましくは0.01〜15重量%である。

【0390】

本発明の化合物及びそのそれぞれの組成物はまた、蚊取り線香及び燻し線香、煙カートリッジ、気化器プレート又は長期気化器で 사용할 ことができ、蛾取り紙（moth paper）、蛾取りパッド（moth pad）、又は他の熱に依存しない気化器システムにおいても使用することができる。

【0391】

式（I）の化合物及びそのそれぞれの組成物を用いて昆虫によって伝染する感染症（例えば、マラリア、デング熱及び黄熱病、リンパ系フィラリア症、及びリーシュマニア症）を防除する方法はまた、小屋及び家屋の表面の処理、カーテン、テント、衣類、蚊帳、ツェツェバエ取り器などの空気スプレー及び含浸も含む。繊維、布地、ニット製品、不織布、網材料、又はホイル、及び防水布に適用するための殺虫剤組成物は、好ましくは、殺虫剤、任意選択的に忌避剤及び少なくとも1つの結合剤を含む混合物を含む。好適な忌避剤は、例えば、N，N-ジエチル-メタートルアミド（DEET）、N，N-ジエチルフェニルアセトアミド（DEPA）、1-（3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル）-2-メチルピペリン、（2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル）酢酸ラクトン、2-エチル-1，3-ヘキサジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド（MNDA）、昆虫防除には使用されないピレスロイド、例えば、{（+/-）-3-アリル-2-メチル4-オキソシクロペンタ-2-（+）-エニル-（+）-トランス-クリサンテメート（エスピオトリン（Esbiothrin））、リモネン、オイゲノール、（+）-ユーカマロール（1）、（-）-l-エピーユーカマロールなどの植物抽出物若しくはEucalyptus maculata、Vitex rotundifolia、Cymbopogon martinii、Cymbopogon citratus（レモングラス）、Cymbopogon nardus（シトロネラ）などの植物由来の粗植物抽出物に由来するか又はそれらと同一の忌避剤である。好適な結合剤は、例えば、脂肪酸のビニルエステル（酢酸ビニル及びベルサチン酸ビニルなど）、アルコールのアクリル酸及びメタクリル酸エステル、例えば、アクリル酸ブチル、アクリル酸2-エチルヘキシル、及びアクリル酸メチル、モノ及びジエチレン性不飽和炭化水素、例えば、スチレン、並びに脂肪族ジエン、例えば、ブタジエンのポリマー及びコポリマーから選択される。

【0392】

カーテン及び蚊帳の含浸は、一般に、繊維材料を殺虫剤の乳剤若しくは分散液に浸すか、又はそれらをネットにスプレーすることによって行われる。

【0393】

本発明の化合物及びその組成物は、樹木、板塀、枕木などの木製材料、及び住宅、納屋、工場などの建物だけでなく、建築材料、家具、皮革、繊維、ビニール製品、電線、及びケーブルをアリ及び／又はシロアリから保護するため、並びに、アリ及びシロアリが作物又はヒトに害を及ぼすことを防除するため（例えば、害虫が家屋及び公共施設に侵入した場合）に使用することができる。本発明の化合物は、木製材料を保護するために周囲の土

10

20

30

40

50

壤表面又は床下の土壤に適用されるだけでなく、床下コンクリートの表面、床柱、梁、合板、家具などの材木製品、パーティクルボード、ハーフボードなどの木製品、及び被覆電線、ビニールシートなどのビニール製品、スチレンフォームなどの断熱材にも適用することができる。

【0394】

作物又はヒトに害を及ぼすアリに対する適用の場合、本発明の化合物は、作物又は周囲の土壤に適用されるか、又はアリの巣などに直接適用される。

【0395】

種子の処理

本発明は更に、特に処理前の種子の約0.0001重量%～約1重量%の範囲の量の本発明の化合物を含む処理された種子を提供する。

【0396】

本発明の化合物はまた、昆虫害虫、特に土壤に生息する昆虫害虫及びダニ害虫から種子を保護し、並びに、生じた植物の根及び芽を土壤害虫及び葉面昆虫から保護するために、種子の処理に好適である。

【0397】

本発明の化合物は、土壤害虫からの種子の保護、並びに土壤害虫及び葉面昆虫に対する生じた植物の根（コガネムシ科幼虫、シロアリ、コメツキムシ幼虫）及び芽の保護に特に有用である。生じた植物の根及び芽の保護が好ましい。より好ましいのは、生じた植物の芽を吸汁昆虫から保護することであり、アブラムシ、ヨコバイ、アザミウマ、及びコナジラミからの保護が最も好ましい。

【0398】

したがって、本発明は、昆虫、特に土壤昆虫からの種子の保護、並びに昆虫、特に土壤及び葉面昆虫からの実生の根及び芽の保護のための方法であって、播種前及び／又は予備発芽後に種子を本発明の化合物と接触させることを含む、方法を提供する。特に好ましいのは、植物の根及び芽が保護される方法であり、より好ましくは、植物の芽が吸汁昆虫から保護される方法であり、最も好ましくは、植物の芽がアブラムシから保護される方法である。

【0399】

種子という用語は、真生種子、種子部分、吸根、球茎、球根、果実、塊茎、穀物、挿し木、挿し芽（cut shoot）などを含むがこれらに限定されないすべての種類の種子及び植物繁殖体を包含し、好ましい実施形態では真生種子を意味する。

【0400】

種子の処理という用語は、種子粉衣（seed dressing）、種子コーティング、種子散粉、浸種（seed soaking）、種子ペレット化など、当該技術分野で既知のすべての好適な種子処理技術を含む。

【0401】

本発明はまた、活性化合物でコーティングされた種子又は活性化合物を含む種子を含む。種子は、本発明の化合物を含む種子コーティング組成物でコーティングすることができる。例えば、EP3165092、EP3158864、WO2016198644、WO2016039623、WO2015192923、CA2940002、US2006150489、US2004237395、WO2011028115、EP2229808、WO2007067042、EP1795071、EP1273219、WO200178507、EP1247436、NL1012918、及びCA2083415で報告されている種子コーティング組成物。

【0402】

「コーティングされた及び／又は含有する」という用語は、一般に、活性成分がその大部分が適用時に繁殖生成物の表面上にあることを意味するが、適用方法に応じて、成分のより多い部分又はより少ない部分が繁殖生成物に浸透し得る。繁殖生成物が（再び）植え付けられたときに、水分とともに活性成分を吸収し得る。

【0403】

好適な種子は、穀物、根菜作物、油料作物、野菜、香辛料、観賞用植物の種子であり、例えば、デュラム小麦及び他の小麦、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ（飼料用トウモロコシ及び砂糖トウモロコシ／スイートコーン及び飼料用トウモロコシ）、大豆、油料作物、アブラナ、綿、ヒマワリ、バナナ、米、菜種、カブ、甜菜、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、草、芝生、芝生、飼料草、トマト、ネギ、カボチャ／カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、カラシナ科種、メロン、豆、エンドウ豆、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えば、ジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／ペラルゴニウム、パンジー、及びインパチェンスである。

10

【0404】

更に、本発明の化合物は、遺伝子工学的方法を含む、育種のための除草剤又は殺菌剤又は殺虫剤の作用に耐性である植物由来の種子を処理するために使用することができる。

【0405】

例えば、本発明の化合物は、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネートアンモニウム又はグリホサートイソプロピルアンモニウム、及び類似の活性物質（例えば、EP 2 422 36、EP 2 422 46を参照のこと）（WO 92 / 003 77）（EP 2 579 93、US 5 013 659）からなる群からの除草剤に耐性である植物由来の種子の処理に使用することができ、又は植物を特定の害虫に対して耐性にする *Bacillus thuringiensis* 毒素（Bt毒素）を生成する能力を有する（EP 1 429 24、EP 1 932 59）、トランスジェニック作物植物、例えば、綿において使用することができる。

20

【0406】

更に、本発明の化合物は、例えば、従来の育種方法及び／若しくは突然変異体の生成によって、又は組換え手順によって生成することができる、既存の植物と比較して改変された特徴を有する植物由来の種子の処理に使用することができる。例えば、植物中で合成されたデンプンを改変する目的での作物植物の組換え改変（例えば、WO 92 / 113 76、WO 92 / 148 27、WO 91 / 198 06）又は改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物植物（WO 91 / 139 72）のいくつかの事例が記載されている。

【0407】

本発明の化合物の種子処理の適用は、植物の播種前及び植物の発生前に、種子をスプレー又は散粉することによって行われる。

30

【0408】

種子処理に特に有用な組成物は、例えば：

- A. 可溶性濃縮物（SL、LS）
- B. 乳剤（EW、EO、ES）
- C. 懸濁液（SC、OD、FS）
- D. 水分散性顆粒及び水溶性顆粒（WG、SG）
- E. 水分散性粉末及び水溶性粉末（WP、SP、WS）
- F. ゲル製剤（GF）
- G. 散粉性粉末（DP、DS）

40

【0409】

従来の種子処理製剤には、例えば、流動性濃縮物FS、溶液LS、乾燥処理用粉末DS、スラリー処理用水分散性粉末WS、水溶性粉末SS、乳剤ES及びEC、並びにゲル製剤GFが含まれる。これらの製剤は、希釈された又は未希釈の種子に適用することができる。種子への適用は、播種前に種子に対して直接的に、又は種子を予備発芽させた後に行われる。

【0410】

一実施形態では、FS製剤が種子処理に使用される。典型的には、FS製剤は、1～800 g / lの活性成分、1～200 g / lの界面活性剤、0～200 g / lの凍結防止剤

50

、0～400 g／lの結合剤、0～200 g／lの顔料、及び最大1リットルの溶媒、好ましくは水を含み得る。

【0411】

特に、種子処理のための本発明の化合物のFS製剤は、通常、0.1～80重量%（1～800 g／l）の活性成分、0.1～20重量%（1～200 g／l）の少なくとも1つの界面活性剤、例えば、0.05～5重量%の湿潤剤、及び0.5～15重量%の分散剤、最大20重量%、例えば、5～20%の凍結防止剤、0～15重量%、例えば、1～15重量%の顔料及び／又は染料、0～40重量%、例えば、1～40重量%の結合剤（スチッカー／接着剤）、任意選択的に、最大5重量%、例えば、0.1～5重量%の増粘剤、任意選択的に、0.1～2%の消泡剤、及び任意選択的に、例えば、0.01～1重量%の量の殺生物剤、酸化防止剤などの防腐剤、並びに最大100重量%の充填剤／ビヒクルを含む。

10

【0412】

種子処理製剤は、結合剤及び任意選択的に着色剤を更に含み得る。

【0413】

結合剤を、処理後の種子への活物材料の接着を改善するために添加することができる。好適な結合剤は、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドなどのアルキレンオキシド由来のホモポリマー及びコポリマー、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、及びそれらのコポリマー、エチレンービニルアセテートコポリマー、アクリルホモポリマー及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド、及び

20

【0414】

任意選択的に、着色剤も製剤に含めることができる。種子処理製剤に好適な着色剤又は染料は、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112、C、I、ソルベントレッド1、ピグメントブルー15：4、ピグメントブルー15：3、ピグメントブルー15：2、ピグメントブルー15：1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48：2、ピグメントレッド48：1、ピグメントレッド57：1、ピグメントレッド53：1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレッド10、ベーシックバイオレッド49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

30

【0415】

ゲル化剤の例は、カラギーナン（S a t i a g e l（登録商標））である。

【0416】

種子の処理において、本発明の化合物の適用量は、一般に、種子100 kgあたり0.1 g～10 kg、好ましくは種子100 kgあたり1 g～5 kg、より好ましくは1 g～1000 g、特に種子100 kgあたり1 g～200 gである。したがって、本発明はまた、本明細書に規定する式（I）の化合物又はIの農業的に有用な塩を含む種子を提供する。化合物I又はその農業的に有用な塩の量は、一般に、種子100 kgあたり0.1 g～10 kg、好ましくは種子100 kgあたり1 g～5 kg、特に種子100 kgあたり1 g～1000 gで変動する。レタスなどの特定の作物の場合、その量はより高くなり得る。

40

【0417】

動物の健康

本発明はまた、本発明の少なくとも1つの化合物を含む農業用及び／又は獣医用組成物を提供する。

【0418】

50

本発明は、無脊椎動物害虫又は寄生虫による侵入又は感染から動物を治療又は保護するための医薬の調製における、化合物、N－オキシド、若しくはその獣医学的に許容される塩、又は本発明の組成物の使用に更に関する。

【0419】

式（I）の化合物、そのN－オキシド、及び／又は獣医学的に許容される塩はまた、特に、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための使用に好適である。

【0420】

したがって、本発明の1つの目的は、動物内及び動物上の寄生虫を防除するための新規な方法を提供することである。本発明の別の目的は、動物により安全な防除剤を提供することである。本発明の別の目的は、既存の防除剤よりも低用量で使用することができる動物用の防除剤を提供することである。本発明の別の目的は、寄生虫の長期の残留防除を提供する動物用の防除剤を提供することである。

10

【0421】

本発明はまた、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための、寄生虫駆除的に有効な量の式（I）の少なくとも1つの化合物、そのN－オキシド、又は獣医学的に許容される塩、及び許容される担体を含む組成物に関する。

【0422】

本発明はまた、寄生虫による侵入及び感染に対して動物を治療、防除、予防、及び保護するための方法であって、寄生虫駆除的に有効な量の本発明の化合物又はそれを含む組成物を動物に経口、局所、又は非経口的に投与又は適用することを含む、方法を提供する。

20

【0423】

本発明はまた、寄生虫駆除的に有効な量の本発明の化合物又はこれを含む組成物を含む、寄生虫による侵入又は感染に対して動物を治療、防除、予防、又は保護するための組成物を調製するためのプロセスを提供する。

【0424】

農業害虫に対する化合物の活性は、例えば、経口投与の場合の低い非催吐投与量、動物との代謝の適合性、低い毒性、及び安全な取り扱いを必要とする、動物内及び動物上の内部寄生虫及び外部寄生虫の防除に対する好適性を示唆していない。

【0425】

驚くべきことに、本発明の化合物は、動物内及び動物上の内部寄生虫及び外部寄生虫を駆除するのに好適であることが今や見出された。

30

【0426】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、好ましくは、温血動物（ヒトを含む）及び魚類を含む動物における侵入及び感染を防除及び予防するために使用される。それらは、例えば、哺乳動物、例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、家禽、ウサギ、ヤギ、イヌ、及びネコ、水牛、ロバ、ファロージカ、及びトナカイ、及び毛皮動物、例えば、ミンク、チンチラ、及びアライグマ、鳥類、例えば、雌鶏、ガチョウ、七面鳥、及びアヒル、並びに魚類、例えば、マス、コイ、及びウナギなどの淡水魚及び塩水魚における侵入及び感染を防除及び予防するのに好適である。

【0427】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、好ましくは、イヌ又はネコなどの家畜における侵入及び感染を防除及び予防するために使用される。

40

【0428】

温血動物及び魚への侵入には、シラミ、ハジラミ、ダニ、ハナバエ幼虫、ヒツジシラミバエ、サシバエ、ムスコイドハエ、キンバエ、ハエ、ミアシティックハエ幼虫、ツツガムシ、ブナ、蚊、及びノミが含まれるが、これらに限定されない。

【0429】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、外部寄生虫及び／又は内部寄生虫の全身的及び／又は非全身的防除に適している。それらは、発症のすべて又は一部の段階に対して活性であり得る。

50

【0430】

本発明の化合物は、外部寄生虫を駆除するために特に有用である。

【0431】

本発明の化合物は、それぞれ以下の目及び種の寄生虫を駆除するために特に有用である：
ノミ(ノミ目 (Siphonaptera))、例えば、*Ctenocephalides felis*、*Ctenocephalides canis*、*Xenopsylla cheopis*、*Pulex irritans*、*Tunga penetrans*、及び *Nosopsyllus fasciatus*、ゴキブリ(*Blattaria* *Blattodea*)、例えば、*Blattella germanica*、*Blattella ashmeadi*、*Periplaneta americana*、*Periplaneta japonica*、*Periplaneta brunnea*、*Periplaneta fuliginosa*、*Periplaneta australasiae*、及び *Blatta orientalis*、ハエ、蚊(双翅目 (Diptera))、例えば、*Aedes aegypti*、*Aedes albopictus*、*Aedes vexans*、*Anastrepha ludens*、*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*、*Anopheles gambiae*、*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*、*Anopheles minimus*、*Anopheles quadrimaculatus*、*Calliphora vicina*、*Chrysomya bezziana*、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、*Chrysops discalis*、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomyia hominivorax*、*Cordylobia anthropophaga*、*Culicoides furens*、*Culex pipiens*、*Culex nigripalpus*、*Culex quinquefasciatus*、*Culex tarsalis*、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dermatobia hominis*、*Fannia canicularis*、*Gasterophilus intestinalis*、*Glossina morsitans*、*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates* spp.、*Hypoderma lineata*、*Leptoconops torrens*、*Lucilia caprina*、*Lucilia cuprina*、*Lucilia sericata*、*Lycoria pectoralis*、*Mansonella* spp.、*Musca domestica*、*Musca stabulans*、*Oestrus ovis*、*Phlebotomus argentipes*、*Psorophora columbiae*、*Psorophora ferox*、*Prosimulium mixtum*、*Sarcophaga haemorrhoidalis*、*Sarcophaga* spp.、*Simulium vittatum*、*Stomoxys calcitrans*、*Tabanus bovinus*、*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、及び *Tabanus similis*、シラミ(シラミ目 (Phthiraptera))、例えば、*Pediculus humanus capitis*、*Pediculus humanus corporis*、*Phthirus pubis*、*Haematopinus eurysternus*、*Haematopinus suis*、*Linognathus setosus*、*Bovicola bovis*、*Menopon gallinae*、*Mencaninus stramineus*、及び *Solenopotes capillatus*、ダニ及び寄生ダニ(胸穴ダニ上目 (Parasitiformes))：ダニ(*Ixodida*)、例えば、*Ixodes scapularis*、*Ixodes holocyclus*、*Ixodes pacificus*、*Rhipicephalus sanguineus*、*Dermacentor andersoni*、*Dermacentor*

10

20

30

40

50

variabilis、Amblyomma americanum、Ambryomma maculatum、Ornithodoros hermsi、Ornithodoros turicata、及び寄生ダニ(中気門亜目(Mesostigmata))、例えば、Ornithonyssus bacoti、及びDermanyssus gallinae、ケダニ亜目(Actiniedida(Prostigmata))及びコナダニ亜目(Acaridida(Astigmata))、例えば、Acarapisa spp.、Cheyletiella spp.、Ornithocheyletia spp.、Myobia spp.、Psorergates spp.、Demodex spp.、Trombicula spp.、Listrophorus spp.、Acarus spp.、Tyrophagus spp.、Caloglyphus spp.、Hypodectes spp.、Pterolichus spp.、Psoroptes spp.、Chorioptes spp.、Otodectes spp.、Sarcptes spp.、Notoedres spp.、Knemidocoptes spp.、Cytodites spp.、及びLaminosioptes spp.、カメムシ(Bugs)(異翅目(Heteropterida)): Cimex lectularius、Cimex hemipterus、Reduvius senilis、Triatoma spp.、Rhodnius spp.、Panstrongylus spp.、及びArilus critatus、Anoplurida、例えば、Haematopinus spp.、Linognathus spp.、Pediculus spp.、Phtirus spp.、及びSolenopotes spp.、Mallophagida(suborders Arnblycerina、及びIschnocerina)、例えば、Trimenopon spp.、Menopon spp.、Trinoton spp.、Bovicola spp.、Werneckiella spp.、Lepikentron spp.、Trichodectes spp.、及びFelicola spp.。

【0432】

回虫線虫:

【0433】

コメツキムシ幼虫(Wipeworm)、及び旋毛虫(Trichinosis)(毛管目(Trichosyringida))、例えば、旋毛虫科(Trichinellidae)(Trichinella spp.)、(鞭虫科(Trichuridae))、Trichuris spp.、Capillaria spp.、Rhabditida、例えば、Rhabditis spp.、Strongyloides spp.、Helicephalobus spp.、Strongylida、例えば、Strongylus spp.、Ancylostoma spp.、Necator americanus、Bunostomum spp. (鉤虫(Hookworm))、Trichostongylus spp.、Haemonchus contortus、Ostertagia spp.、Cooperia spp.、Nematodirus spp.、Dictyocaulus spp.、Cyathostoma spp.、Oesophagostomum spp.、Stephanurus dentatus、Ollulanus spp.、Chabertia spp.、Stephanurus dentatus、Syngamus trachea、Ancylostoma spp.、Uncinaria spp.、Globocephalus spp.、Necator spp.、Metastrongylus spp.、Muellerius capillaris、Protostrongylus spp.、Angiostrongylus spp.、Parelaphostrongylus spp.、Aleurostrongylus abstrusus、及びDioctophyma renale、Intestinal roundworms(回虫目(Ascaridida))、例えば、Ascaris lumbricoides、Ascaris suum、Ascaridia galli、Parascaris equorum、Enterobius v

ermicularis (蠕虫 (Threadworm)), Toxocara canis、Toxascaris leonine、Skrjabinema spp.、及びOxyuris equi、Camallanida、例えば、Dracunculus medinensis (メジナ虫 (guinea worm)) Spirurida、例えば、Thelazia spp.、Wuchereria spp.、Brugia spp.、Onchocerca spp.、Dirofilaria spp.、Didipetalonema spp.、Setaria spp.、Elaeophora spp.、Spirocera lupi、及びHabronema spp.、Thorny headed worm (鉤頭虫門 (Acanthocephala))、例えば、Acanthocephalus spp.、Macracanthorhynchus hirudinaceus、及びOncicola spp.、プラナリア (Planaria) (扁形動物 (Plathelminthe))、吸虫 (Fluke) (吸虫 (Trematoda))、例えば、Faciola spp.、Fascioloides magna、Paragonimus spp.、Dicrocoelium spp.、Fasciolopsis buski、Clonorchis sinensis、Schistosoma spp.、Trichobilharzia spp.、Alaria alata、Paragonimus spp.、及びNanocyetes spp.、Cercomeromorpha、特に条虫綱 (Cestoda) (条虫 (Tapeworms))、例えば、Diphyllobothrium spp.、Tenia spp.、Echinococcus spp.、Dipylidium caninum、Multiceps spp.、Hymenolepis spp.、Mesocestoides spp.、Vampirolepis spp.、Moniezia spp.、Anoplocephala spp.、Sirometra spp.、Anoplocephala spp.、並びにHymenolepis spp.。

【0434】

式 (I) の化合物及びそれらを含む組成物は、双翅目 (Diptera)、ノミ目 (Siphonaptera)、及びイクソディダ目 (Ixodida) からの害虫の防除に特に有用である。

【0435】

一実施形態では、本発明は、蚊を駆除するための式 (I) の化合物及びそれらを含む組成物の使用を提供する。

【0436】

一実施形態では、本発明は、ハエを駆除するための式 (I) の化合物及びそれらを含む組成物の使用を提供する。

【0437】

一実施形態では、本発明は、ノミを駆除するための式 (I) の化合物及びそれらを含む組成物の使用を提供する。

【0438】

ダニを駆除するための本発明の化合物及びそれらを含む組成物の使用は、本発明の更に別の実施形態である。

【0439】

本発明の化合物はまた、内部寄生虫 (回虫線虫、鉤頭虫、及びプラナリア) を駆除するために特に有用である。

【0440】

一実施形態では、本発明の化合物の投与は、予防的及び治療的の両方で行うことができる。

【0441】

別の実施形態では、本発明の化合物の投与は、直接的に又は好適な調製物の形態で、経口的に、局所的に／皮膚的に、又は非経口的に行われる。

【0442】

温血動物への経口投与の場合、本発明の化合物は、動物飼料、動物飼料プレミックス、動物飼料濃縮物、丸剤、溶液、ペースト、懸濁液、水薬、ゲル、錠剤、ボラス、及びカプセルとして製剤化し得る。更に、本発明の化合物は、それらの飲料水で動物に投与し得る。経口投与の場合、選択される剤形は、1日あたり $0.01\text{ mg/kg} \sim 100\text{ mg/kg}$ 動物体重の本発明の化合物、好ましくは1日あたり $0.5\text{ mg/kg} \sim 100\text{ mg/kg}$ 動物体重を動物に提供すべきである。

【0443】

或いは、本発明の化合物は、非経口的に、例えば、反芻胃内、筋肉内、静脈内、又は皮下注射によって動物に投与され得る。本発明の化合物は、皮下注射のために生理学的に許容される担体に分散又は溶解され得る。或いは、本発明の化合物は、皮下投与のためのインプラントへと製剤化され得る。更に、本発明の化合物は、動物に経皮的に投与され得る。非経口投与の場合、選択される剤形は、1日あたり $0.01\text{ mg/kg} \sim 100\text{ mg/kg}$ 動物体重の本発明の化合物を動物に与える必要がある。

【0444】

本発明の化合物はまた、浸漬 (dip)、粉剤、粉末、首輪 (collar)、メダル、スプレー、シャンプー、スポットオン (spot-on)、及びポアオン (pour-on) 製剤の形態で、並びに軟膏又は水中油型又は油中水型乳剤で動物に局所的に適用され得る。局所適用の場合、浸漬剤及びスプレー剤は、通常、 $0.5\text{ ppm} \sim 5,000\text{ ppm}$ 、好ましくは $1\text{ ppm} \sim 3,000\text{ ppm}$ の本発明の化合物を含む。更に、本発明の化合物は、動物、特にウシ及びヒツジなどの四足動物の耳標として製剤化し得る。

【0445】

好適な調製物は、溶液、例えば、経口溶液、希釈後の経口投与用の濃縮物、皮膚上又は体腔内で使用するための溶液、ポアオン製剤、ゲル；経口又は皮膚投与用の乳剤及び懸濁液；半固体調製物；活性化合物が軟膏基剤又は水中油型又は油中水型乳剤基剤中で処理されている製剤；固形調製物、例えば、粉末、プレミックス又は濃縮物、顆粒、ペレット、錠剤、ボラス、カプセル；エアロゾル及び吸入剤、並びに活性化合物を含む成形品である。

【0446】

注射に適した組成物は、活性成分を好適な溶媒に溶解し、任意選択的に、酸、塩基、緩衝塩、防腐剤、及び可溶化剤などの更なる成分を加えることによって調製される。

【0447】

溶液は濾過され、無菌状態で充填される。

【0448】

好適な溶媒は、水などの生理学的に許容できる溶媒、アルコール、例えば、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコール、グリセロール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン、2-ピロリドン、及びそれらの混合物である。

【0449】

活性化合物は、任意選択的に、注射に好適である生理学的に許容できる植物油又は合成油に溶解することができる。

【0450】

好適な可溶化剤は、主な溶媒への活性化合物の溶解を促進するか、又はその沈殿を防ぐ溶媒である。例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチル化ヒマシ油、及びポリオキシエチル化ソルビタンエステルである。

【0451】

好適な防腐剤は、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、及びn-ブタノールである。

【0452】

経口溶液は直接投与される。濃縮物は、使用した濃度に事前に希釈した後、経口投与される。経口溶液及び濃縮物は、最新技術に従って及び注射溶液について上記したように調製され、滅菌手順は必要ではない。

【0453】

皮膚に使用するための溶液は、滴らす、広げる、こする、振りかける、又はスプレーされる。

【0454】

皮膚に使用するための溶液は、最新技術に従って、そして注射溶液について上に記載されたものに従って調製され、滅菌手順は必要ではない。

【0455】

更に好適な溶媒は、ポリプロピレングリコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチル又は酢酸ブチル、安息香酸ベンジルなどのエステル、アルキレングリコールアルキルエーテル、例えば、ジプロピレングリコールモノメチルエーテルなどのエーテル、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン、芳香族炭化水素、植物油及び合成油、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、トランスクトール、ソルケタール、プロピレンカーボネート、及びそれらの混合物である。

10

【0456】

調製中に増粘剤を加えることが有利であり得る。好適な増粘剤は、無機増粘剤、例えば、ベントナイト、コロイド状ケイ酸、モノステアリン酸アルミニウム、有機増粘剤、例えば、セルロース誘導体、ポリビニルアルコール及びそのコポリマー、アクリレート及びメタクリレートである。

【0457】

ゲルは、皮膚に適用され若しくは広げられるか、又は体腔に導入される。ゲルは、注射溶液の場合に記載したように調製された溶液を、軟膏のような粘稠度を有する透明な材料が得られるのに十分な増粘剤で処理することによって調製される。使用される増粘剤は、上記の増粘剤である。

20

【0458】

ポアオン製剤は、皮膚の限られた領域に注がれるか又はスプレーされ、活性化合物が皮膚に浸透し、全身的に作用する。ポアオン製剤は、活性化合物を好適な皮膚適合性溶媒又は溶媒混合物に溶解、懸濁、又は乳化することによって調製される。必要に応じて、着色剤、生体吸収促進物質、抗酸化剤、光安定剤、接着剤などの他の助剤が追加される。

【0459】

好適な溶媒は、例えば、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセロール、ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノールなどの芳香族アルコール、酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジルなどのエステル、アルキレングリコールアルキルエーテルなどのエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテルなどのエーテル、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン、プロピレンカーボネート、エチレンカーボネートなどの環状カーボネート、芳香族及び／又は脂肪族炭化水素、植物油又は合成油、DMF、ジメチルアセトアミド、メチルピロリドン、n-ブチルピロリドン又はn-オクチルピロリドン、N-メチルピロリドン、2-ピロリドンなどのn-アルキルピロリドン、2,2-ジメチル-4-オキシーメチレン-1,3-ジオキサラン、又はグリセロールホルマルである。

30

40

【0460】

好適な着色剤は、例えば、動物での使用が許容され、溶解又は懸濁することができるすべての着色剤である。

【0461】

好適な吸収促進物質は、例えば、ジメチルスルホキシド、拡散油、例えば、ミリスチン酸イソプロピル、ジプロピレングリコールペラルゴネート、シリコーン油、及びそれらとポリエーテル、脂肪酸エステル、トリグリセリド、又は脂肪アルコールとのコポリマーである。

【0462】

好適な抗酸化剤は、例えば、亜硫酸塩又はメタ重亜硫酸塩、例えば、メタ重亜硫酸カリ

50

ウム、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、又はトコフェロールである。

【0463】

好適な光安定剤は、例えば、ノバンチソル酸である。好適な接着剤は、例えば、セルロース誘導体、デンプン誘導体、ポリアクリレート、又は天然ポリマー、例えば、アルギネート、ゼラチンである。乳剤は、経口で、皮膚に、又は注射として投与することができる。乳剤は、油中水型又は水中油型のいずれかである。

【0464】

それらは、疎水性相又は親水性相のいずれかに活性化合物を溶解し、好適な乳化剤、及び好適な場合には、他の助剤、例えば、着色剤、吸収促進物質、保存剤、抗酸化剤、光安定剤、粘度増強物質の助けを借りて、これを他の相の溶媒で均質化することによって調製される。

【0465】

好適な疎水性相（油）は、液体パラフィン、シリコン油、天然植物油、例えば、ゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油、合成トリグリセリド、例えば、ジ（カプリル／カプリル酸）グリセリド、鎖長 C_{12} の植物性脂肪酸又は他の特別に選択された天然脂肪酸とのトリグリセリド混合物、ヒドロキシル基を含む可能性もある飽和又は不飽和脂肪酸の部分グリセリド混合物、 C_{12} 脂肪酸のモノ及びジグリセリド、脂肪酸エステル、例えば、ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ- n -ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ジプロピレングリコールペラルゴネート、中鎖長の分岐脂肪酸と鎖長 C_{16} ～ C_{18} の飽和脂肪酸アルコールとのエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長 C_{12} ～ C_{18} の飽和脂肪酸エステルのカプリル／カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、ワックス状脂肪酸エステル、例えば、合成アヒル尾骨腺脂肪、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、及び後者に関連するエステル混合物、脂肪アルコール、例えば、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコール、並びにオレイン酸などの脂肪酸、並びにそれらの混合物である。好適な親水性相は、水、アルコール、例えば、プロピレングリコール、グリセロール、ソルビトール、及びそれらの混合物である。

【0466】

好適な乳化剤は、例えば、非イオン性界面活性剤、例えば、ポリエトキシ化ヒマシ油、ポリエトキシ化ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノステアレート、グリセロールモノステアレート、ポリオキシエチルステアレート、アルキルフェノールポリグリコールエーテル；両性界面活性剤、例えば、 N -ラウリル- p -イミノジプロピオン酸二ナトリウム又はレシチンである。

【0467】

好適なアニオン性界面活性剤は、例えば、ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコールエーテル硫酸塩、モノ／ジアルキルポリグリコールエーテルオルトトリン酸エステルモノエタノールアミン塩である。好適なカチオン性界面活性剤は、セチルトリメチルアンモニウムクロリドである。

【0468】

好適な更なる助剤は、例えば、粘度を増強し、乳剤を安定化する物質、例えば、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、及び他のセルロース、及びデンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテル及び無水マレイン酸のコポリマー、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイド状ケイ酸、又は上記の物質の混合物である。

【0469】

懸濁液は、経口又は局所／皮膚投与することができる。それらは、必要に応じて、他の助剤、例えば、湿潤剤、着色剤、生体吸収促進物質、防腐剤、抗酸化剤、光安定剤を添加して、懸濁剤に活性化合物を懸濁させることによって調製される。

10

20

30

40

50

【0470】

液体懸濁剤は、すべての均質な溶媒及び溶媒混合物である。

【0471】

好適な湿潤剤（分散剤）は、上記の乳化剤である。

【0472】

言及し得る他の助剤は、上記のものである。

【0473】

半固形調製物は、経口又は局所／皮膚投与することができる。それらは、粘度が高いという点でのみ、上記の懸濁液及び乳剤とは異なる。

【0474】

固体調製物の製造のために、活性化合物は、好適な場合には助剤の添加とともに好適な賦形剤と混合され、所望の形態とする。

【0475】

好適な賦形剤はすべて、生理学的に許容できる固体不活性物質である。使用されるものは無機物質及び有機物質である。無機物質は、例えば、塩化ナトリウム、炭酸塩、例えば、炭酸カルシウム、炭酸水素塩、酸化アルミニウム、酸化チタン、ケイ酸、陶土（argillaceous earth）、沈殿又はコロイド状シリカ、又はリン酸塩である。有機物質は、例えば、砂糖、セルロース、食品及び飼料、例えば、乳粉、動物粉、穀物粉及び細片、デンプンなどである。

【0476】

好適な助剤は、上記の防腐剤、抗酸化剤、及び／又は着色剤である。

【0477】

他の好適な助剤は、潤滑剤及び流動促進剤、例えば、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、ベントナイト、崩壊促進物質、例えば、デンプン又は架橋ポリビニルピロリドン、結合剤、例えば、デンプン、ゼラチン、又は線状ポリビニルピロリドン、並びに乾燥結合剤、例えば、微結晶性セルロースである。

【0478】

一般に、「寄生虫駆除的に有効な量」とは、壊死、死、遅延、予防、除去、破壊、又は他では標的の生物の発生及び活動の減少の効果を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要な活性成分の量を意味する。寄生虫駆除的に有効な量は、本発明で 사용되는様々な化合物／組成物について変化し得る。組成物の寄生虫駆除的に有効な量はまた、所望の寄生虫駆除効果及び持続時間、標的の種、適用様式などの一般的な条件に応じて変動する。本発明で使用するすることができる組成物は、一般に、約0.001～95%の本発明の化合物を含む。

【0479】

一般に、本発明の化合物を1日あたり0.5mg/kg～100mg/kg、好ましくは1日あたり1mg/kg～50mg/kgの総量で適用することが好ましい。すぐに使用できる状態にある調製物は、寄生虫、好ましくは外部寄生虫に対して作用する化合物が、10ppm～80重量パーセント、好ましくは0.1～65重量パーセント、より好ましくは1～50重量パーセント、最も好ましくは5～40重量パーセントの濃度で含む。調製物は、使用前に希釈され、外部寄生虫に対して作用する化合物を0.5～90重量パーセント、好ましくは1～50重量パーセントの濃度で含む。更に、調製物は、内部寄生虫に対する本発明の化合物を、10ppm～2重量パーセント、好ましくは0.05～0.9重量パーセント、非常に特に好ましくは0.005～0.25重量パーセントの濃度で含む。

【0480】

一実施形態では、本発明の化合物を含む組成物は、皮膚／局所適用される。

【0481】

別の実施形態では、局所適用は、首輪、メダル、耳標、身体部分に固定するためのバンド、及び接着ストリップ及びホイルなどの化合物含有成形品の形態で行われる。

【0482】

一般に、本発明の化合物を10mg/kg～300mg/kg、好ましくは20mg/kg～200mg/kg、最も好ましくは25mg/kg～160mg/kg治療動物の体重で3週間の経過中に放出する固体製剤を適用することが好ましい。

【0483】

成形品の調製のために、熱可塑性及び軟質プラスチック、並びにエラストマー及び熱可塑性エラストマーが使用される。好適なプラスチック及びエラストマーは、本発明の化合物と十分に適合性のあるポリビニル樹脂、ポリウレタン、ポリアクリレート、エポキシ樹脂、セルロース、セルロース誘導体、ポリアミド、及びポリエステルである。プラスチック及びエラストマーの詳細な列挙、並びに成形品の調製手順がWO2003/086075に示されている。

10

【0484】

ポジティブな作物反応：

本発明の化合物は、昆虫害虫及びダニ害虫を効果的に防除するだけでなく、収量の増加をもたらす、植物成長増強効果、例えば、根の成長の増強、干ばつ、高塩分、高温、寒冷、霜又は光の放射に対する耐性の増強、開花の改善、栄養利用の増強（窒素同化の改善など）、品質向上植物製品、有効分げつの数がより多いこと、真菌、昆虫、害虫などに対する耐性の増強などのポジティブな作物反応を示す。

【0485】

化学実施例：

20

【0486】

以下の実施例は、本発明の化合物をこれを限定することなく製造する方法及びプロセスを示し、本発明を実施するために本発明者らが企図する最良の様式を含む。

【0487】

実施例1：2-（1-（3，5-ジクロロフェニル）-2-（エチルスルホニル）インドリジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4，5-b]ピリジン（化合物番号1）の合成：

【0488】

a) 工程1：1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム：

アセトニトリル（10mL）中のピリジン（10.2mL、126mmol）の攪拌溶液に、2-ブロモ酢酸エチル（15.4mL、139mmol）を添加し、反応混合物を18時間加熱還流した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。得られた沈殿物を濾過して、1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム（20g、120mmol、収率95%）を得た。¹H-NMR（400MHz，DMSO-d₆）δ 9.09-9.11（m，2H），8.70-8.74（m，1H），8.25（dd，J=7.9，6.7Hz，2H），5.73（s，2H），4.22（q，J=7.1Hz，2H），1.21（t，J=7.1Hz，3H）；ESI MS（m/z）166.20（MH）⁺。

30

【0489】

b) 工程2：2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル：

40

【0490】

N，N-ジメチルホルムアミド（80mL）中の1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム（8g、48.1mmol）の攪拌溶液に、2，2-ジフルオロビニル4-メチルベンゼンスルホネート（7.9g、33.7mmol）、炭酸カリウム（6.7g、48.1mmol）、及びトリエチルアミン（6.7mL、48.1mmol）を添加した。反応混合物を70℃で12時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水（150mL）を上記の反応混合物に添加し、酢酸エチル（300mL）で2回抽出した。合わせた酢酸エチル層をブライン（100mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフ

50

イーにより精製して、2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル (4.2 g、20.3 mmol、収率42%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.29 (dq, J=7.2, 1.0 Hz, 1H), 7.51-7.65 (m, 1H), 7.23-7.27 (m, 1H), 6.72-7.08 (m, 1H), 6.27-6.50 (m, 1H), 4.33 (q, J=7.1 Hz, 2H), 1.34 (t, J=7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 208.20 (MH)⁺.

【0491】

c) 工程3: 2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド:

【0492】

N, N-ジメチルホルムアミド (5 mL) 中のカリウムtert-ブトキシド (1.2 g、10.9 mmol) の攪拌溶液に、N, N-ジメチルホルムアミド (5 mL) 中の2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル (0.9 g、4.4 mmol) 及びN-2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2, 3-ジアミン (1 g、5.2 mmol) の溶液を0℃で添加した。反応混合物を25℃で2時間攪拌した。反応完了後、テトラヒドロフランを減圧下で除去して粗生成物を得て、これを水 (25 mL) に溶解し、酢酸エチル (75 mL) で抽出した。酢酸エチル層をブライン (50 mL) 及び水 (50 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製して、2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド (550 mg、1.6 mmol、収率36%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.38 (dd, J=7.1, 0.7 Hz, 1H), 8.75 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.30 (t, J=1.1 Hz, 1H), 7.51-7.72 (m, 2H), 7.17-7.21 (m, 1H), 6.94-7.05 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 2.84-2.89 (d, J=4.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 352.95 (MH)⁺.

【0493】

d) 工程4: 2-(2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0494】

N-メチル-2-ピロリドン (15 mL) 中の2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド (1.4 g、4 mmol)、p-トルエンスルホン酸一水和物 (2.3 g、11.9 mmol) の混合物を窒素雰囲気下において電子レンジ中で150℃で1時間照射した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水 (100 mL) を上記の反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル (200 mL) で抽出した。酢酸エチル層を水 (50 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の20%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (830 mg、2.5 mmol、収率62%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.12 (dd, J=7.1, 0.7 Hz, 1H), 8.78-8.82 (m, 1H), 8.55 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.65-7.75 (m, 1H), 7.16-7.19 (m, 1H), 6.96 (td, J=7.0, 1.3 Hz, 1H), 6.68 (s, 1H), 3.92 (s, 3H); ESI MS (m/z) 335 (MH)⁺.

【0495】

e) 工程5: 2-(2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0496】

乾燥N, N-ジメチルホルムアミド(10 mL)中の2-(2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(830 mg、2.5 mmol)の攪拌溶液に、水素化ナトリウム(149 mg、3.7 mmol)を0℃で添加し、反応混合物を30分間攪拌した。エタンチオール(0.4 mL、5 mmol)を上記の反応混合物に0℃で滴下添加し、反応混合物を60℃で1時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水(50 mL)を反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル(150 mL)で抽出した。酢酸エチル層を水(50 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の酢酸エチルを使用したシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルチオ)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(730 mg、1.94 mmol、収率78%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.83 (q, J=0.9 Hz, 1H), 8.59-8.60 (m, 1H), 8.43 (dd, J=7.1, 0.7 Hz, 1H), 7.57 (dd, J=7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.00 (ddd, J=9.0, 6.6, 1.0 Hz, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.72 (td, J=6.9, 1.2 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.90-2.96 (q, J=7.1 Hz, 2H), 1.19 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 377.05 (MH)⁺.

10

【0497】

f) 工程6: 2-(2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン:

20

【0498】

ジクロロメタン(3 mL)中の2-(2-(エチルチオ)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(200 mg、0.5 mmol)の溶液に、m-クロロ過安息香酸(306 mg、1.1 mmol)を0~5℃で少しずつ添加した。反応混合物を25℃で2時間攪拌した。反応完了後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタン(150 mL)で抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(150 mg、0.4 mmol、69%収率)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.91 (t, J=1.0 Hz, 1H), 8.70 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.14 (dd, J=7.1, 1.0 Hz, 1H), 7.71-7.91 (m, 1H), 7.11-7.16 (m, 2H), 6.88-6.91 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.39 (q, J=7.1 Hz, 2H), 1.15 (t, J=7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 409 (MH)⁺.

30

【0499】

g) 工程7: 2-(1-ブromo-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン:

40

【0500】

ジクロロメタン中の2-(2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(185 mg、0.45 mmol)の攪拌溶液に(2 mL)、N-ブromosuccinimide(89 mg、0.5 mmol)を0℃で添加し、反応混合物を25℃で30分間攪拌した。反応完了後、反応混合物を水(20 mL)で希釈し、ジクロロメタン(50 mL)で3回抽出した。合わせたジクロロメタン層をブライン(100 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の30%酢酸

50

エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(1-ブromo-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(160mg、0.3mmol、72%収率)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 8.90(d, J=1.8Hz, 1H), 8.69(d, J=1.8Hz, 1H), 8.11(d, J=7.3Hz, 1H), 7.68(d, J=9.2Hz, 1H), 7.24(dd, J=9.2, 6.7Hz, 1H), 6.90-6.94(m, 1H), 3.70(s, 3H), 3.36-3.46(m, 2H), 1.12(t, J=7.3Hz, 3H); ESI-MS(m/z) 486.85, 489.05 [(MH)⁺Br^{79,81}].

【0501】

h) 工程8: 2-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン:

【0502】

1,4-ジオキサン(2mL)及び水(0.2mL)の混合物中の2-(1-ブromo-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(110mg、0.2mmol)及び(3,5-ジクロロフェニル)ボロン酸(43.1mg、0.2mmol)の溶液に、炭酸ナトリウム(71.8mg、0.7mmol)及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(13mg、0.01mmol)を添加した。反応混合物を真空/窒素サイクルに3回供することによって十分に脱酸素化し、電子レンジ中で110℃で1.5時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却し、セライトのパッドを通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮し、粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(1-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(73mg、0.1mmol、収率58%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 8.92(t, J=2.2Hz, 1H), 8.71(t, J=2.2Hz, 1H), 8.15-8.17(m, 1H), 7.68-7.74(m, 3H), 7.52-7.55(m, 1H), 7.16-7.20(m, 1H), 6.93-6.99(m, 1H), 3.79(s, 3H), 3.05(dtd, J=63.8, 14.5, 7.3Hz, 2H), 0.89-1.1(m, 3H); ESI-MS(m/z) 553.90, 554.90 [(MH)⁺Cl^{35,37}].

【0503】

実施例2: 2-(2-(エチルスルホニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(化合物番号2)の合成:

【0504】

a) 工程1: 2-(2-イミノピリジン-1(2H)-イル)酢酸:

【0505】

水(10mL)中の2-クロロ酢酸(4.0g、42.3mmol)の攪拌溶液に、トリエチルアミン(6.8mL、48.7mmol)を25℃で滴下添加した。10分間攪拌した後、ピリジン-2-アミン(4.8g、50.8mmol)を添加し、得られた褐色の溶液を90℃で5時間加熱した。25℃に冷却した後、エタノール(20mL)を添加し、得られた懸濁液を5℃で2時間攪拌した。沈殿物を濾取し、冷エタノール(30mL)で洗浄して、2-(2-イミノピリジン-1(2H)-イル)酢酸(4.2g、28mmol、収率65%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 8.11(s, 1H), 7.79-7.91(m, 2H), 6.98(d, J=7.8Hz, 1H), 6.82(s, 1H), 4.44(s, 2H); ESI-MS(m/z) 152.95 (MH)⁺.

10

20

30

40

50

【0506】

b) 工程2: 2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン:

【0507】

トルエン (50 mL) 中の 2-(2-イミノピリジン-1(2H)-イル) 酢酸 (4.2 g、27.6 mmol) の攪拌溶液に、オキシ塩化リン (7.7 mL、83 mmol) を滴下添加し、得られた反応混合物を 100°C で 16 時間加熱した。反応完了後、反応混合物を 25°C に冷却した。冷水 (500 mL) を添加し、溶液を 15 分間攪拌した。水層を 10% 水酸化ナトリウム水溶液で中和し、ジクロロメタン (250 mL) で 2 回抽出した。合わせたジクロロメタン層を水 (100 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン (3.2 g、21 mmol、収率 76%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.50 (dt, J = 6.8, 1.2 Hz, 1H), 8.05–8.08 (m, 1H), 7.54 (dq, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 9.2, 6.8, 1.3 Hz, 1H), 6.99 (td, J = 6.8, 1.2 Hz, 1H); ESI MS (m/z) 152.90 (MH)⁺.

10

【0508】

c) 工程3: 2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボン酸エチル:

【0509】

テトラヒドロフラン (10 mL) 中の 2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン (0.5 g、3.3 mmol) の攪拌溶液に、n-ブチルリチウム (1.8 mL、3.6 mmol) を -78°C で滴下添加した。30 分間攪拌した後、テトラヒドロフラン (10 mL) 中のクロロギ酸エチル (0.36 g、3.3 mmol) を同じ温度で反応混合物に添加した。反応混合物を -78°C で 1 時間攪拌し、続いて 25°C でさらに 1 時間攪拌した。反応完了後、反応物を飽和塩化アンモニウム溶液 (20 mL) を添加することによってクエンチし、酢酸エチル (100 mL) で 2 回抽出した。合わせた酢酸エチル層を水 (100 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の 30% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボン酸エチル (0.5 g、2.2 mmol、収率 68%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.24 (dt, J = 6.9, 1.2 Hz, 1H), 7.77 (dt, J = 9.0, 1.2 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 9.0, 6.9, 1.3 Hz, 1H), 7.31 (td, J = 6.9, 1.3 Hz, 1H), 4.35 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.45 (t, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 224.90 (MH)⁺.

20

30

【0510】

d) 工程4: 2-クロロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボキサミド:

【0511】

テトラヒドロフラン (10 mL) 中のカリウム tert-ブトキシド (0.5 g、4.5 mmol) の攪拌溶液に、テトラヒドロフラン (10 mL) 中の 2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボン酸エチル (0.5 g、2.2 mmol) 及び N-2-メチル-5-(トリフルオロメチル) ピリジン-2, 3-ジアミン (0.4 g、2.2 mmol) の溶液を 0°C で添加した。反応混合物を 25°C で 1 時間攪拌した。反応完了後、テトラヒドロフランを減圧下で除去して粗生成物を得て、これを水 (20 mL) に溶解し、ジクロロメタン (75 mL) で抽出した。ジクロロメタン層をブライン (50 mL) 及び水 (50 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の 40% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-クロロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフ

40

50

ルオロメチル) ピリジン-3-イル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボキサミド (0.45 g、1.2 mmol、収率55%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.16-9.22 (m, 2H), 8.34 (q, J=1.1 Hz, 1H), 7.59-7.76 (m, 3H), 7.24 (td, J=7.0, 1.4 Hz, 1H), 7.03 (q, J=4.6 Hz, 1H), 2.90 (d, J=4.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 369.85 (MH)⁺.

【0512】

e) 工程5: 2-(2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0513】

N-メチル-2-ピロリドン (10 mL) 中の2-クロロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-カルボキサミド (0.25 g、0.68 mmol)、p-トルエンスルホン酸一水和物 (0.39 g、2.03 mmol) の混合物を、窒素雰囲気下において電子レンジ中で150℃で2時間照射した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水 (50 mL) を上記の反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル (150 mL) で抽出した。酢酸エチル層を水 (50 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (0.2 g、0.5 mmol、収率76%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.89 (q, J=0.9 Hz, 1H), 8.68-8.73 (m, 2H), 7.79 (dt, J=9.0, 1.1 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J=9.0, 7.0, 1.3 Hz, 1H), 7.20 (td, J=7.0, 1.2 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H); ESI MS (m/z) 352.05 (MH)⁺.

【0514】

f) 工程6: 2-(2-(エチルチオ)イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0515】

乾燥N,N-ジメチルホルムアミド (5 mL) 中の2-(2-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (0.3 g、0.9 mmol) の攪拌溶液に、水素化ナトリウム (0.1 g、1.7 mmol) を0℃で添加し、反応混合物を30分間攪拌した。エタンチオール (0.1 mL、1.3 mmol) を上記の反応混合物に0℃で添加し、反応混合物を60℃で2時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。冷水 (150 mL) を反応混合物に添加し、得られた沈殿物を濾別し、水 (10 mL) で洗浄し、真空下で乾燥させて、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルチオ)イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (0.25 g、0.7 mmol、収率78%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.85 (t, J=1.0 Hz, 1H), 8.63-8.65 (m, 2H), 7.74 (dt, J=9.0, 1.1 Hz, 1H), 7.50 (ddd, J=9.0, 6.8, 1.2 Hz, 1H), 7.08 (td, J=6.8, 1.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.25 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.23 (t, J=6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 378.10 (MH)⁺.

【0516】

g) 工程7: 2-(2-(エチルスルホニル)イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジ

10

20

30

40

50

ン：

【0517】

ジクロロメタン（5 mL）中の2-（2-（エチルチオ）イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（0.2 g、0.5 mmol）の溶液に、m-クロロ過安息香酸（0.3 g、1 mmol）を0～5℃で少しずつ添加した。反応混合物を25℃で2時間攪拌した。反応完了後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタン（15 mL）で抽出した。ジクロロメタン抽出物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の35%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-（2-（エチルスルホニル）イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（0.1 g、0.3 mmol、収率67%）を得た。¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ 8.93–8.93（m, 1H）, 8.73（dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H）, 8.47（dt, J = 7.0, 1.1 Hz, 1H）, 7.94（dt, J = 9.2, 1.1 Hz, 1H）, 7.68（ddd, J = 9.0, 6.8, 1.2 Hz, 1H）, 7.22（td, J = 6.9, 1.1 Hz, 1H）, 3.86（s, 3H）, 3.49–3.52（q, J = 6.8 Hz, 2H）, 1.15–1.24（t, J = 7.6 Hz, 3H）；ESI MS（m/z）409.95（MH）⁺。

【0518】

実施例3：2-（8-（3, 5-ジクロロフェニル）-2-（エチルスルホニル）インドリジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（化合物番号6）の合成：

【0519】

a）工程1：3-ブロモ-1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム：

【0520】

アセトニトリル（200 mL）中の3-ブロモピリジン（12.4 mL、127 mmol）の攪拌溶液に、2-ブロモ酢酸エチル（15.5 mL、139 mmol）を添加し、反応混合物を16時間加熱還流した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却し、得られた沈殿物を濾過して、3-ブロモ-1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム（30 g、122 mmol、収率97%）を得た。¹H-NMR（400 MHz, クロロホルム-D）δ 9.56（m, 1H）, 9.35（s, 1H）, 8.62（d, J = 8.3 Hz, 1H）, 6.28（s, 2H）, 4.36（q, J = 7.1 Hz, 3H）, 1.33–1.4（t, J = 7.2 Hz, 3H）；ESI MS（m/z）243.85, 245.85 [(MH)⁺ Br^{79, 81}]。

【0521】

b）工程2：6-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル及び8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル：

【0522】

N, N-ジメチルホルムアミド（80 mL）中の3-ブロモ-1-（2-エトキシ-2-オキソエチル）ピリジン-1-イウム（3 g、12.2 mmol）の攪拌溶液に、2, 2-ジフルオロビニル 4-メチルベンゼンスルホネート（1 g、4.3 mmol）、炭酸カリウム（0.85 g、6.1 mmol）、及びトリエチルアミン（0.85 mL、6.1 mmol）を添加した。反応混合物を70℃で16時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水（50 mL）を上記の反応混合物に添加し、酢酸エチル（200 mL）で2回抽出した。合わせた酢酸エチル層をブライン（100 mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を逆相分取HPLCにより精製して、6-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル（240 mg、0.8 mmol、14%収率）及び8-ブロモ-2-フルオロインド

リジン-3-カルボン酸エチル (160 mg、0.56 mmol、9%) を得た。

【0523】

i. 6-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.37-9.47 (m, 1H), 7.63-7.71 (m, 1H), 7.35-7.41 (m, 1H), 6.58-6.69 (m, 1H), 4.35 (q, $J=7.1\text{ Hz}$, 2H), 1.35 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 3H); ESI MS (m/z) 286.05, 288.05 [(MH) + Br $^{79, 81}$].

【0524】

ii. 8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.28-9.40 (m, 1H), 7.58-7.64 (m, 1H), 6.97 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 6.57 (d, $J=11.5\text{ Hz}$, 1H), 4.33 (q, $J=7.2\text{ Hz}$, 2H), 1.3 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 3H); ESI MS (m/z) 286, 288 [(MH) + Br $^{79, 81}$].

【0525】

c) 工程3: 8-ブロモ-2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド:

【0526】

実施例34の工程3に記載されたのと同じ合成手順に従って6-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチル (2.1 g、7.3 mmol) 及びN-2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2,3-ジアミン (1 g、5.23 mmol) を適切な反応物として使用して反応させることにより、8-ブロモ-2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド (1.3 g、3 mmol、収率41%) を得た。 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, クロロホルム- D) δ 9.62 (d, $J=7.0\text{ Hz}$, 1H), 8.37 (d, $J=0.9\text{ Hz}$, 1H), 7.72 (dd, $J=6.7, 2.1\text{ Hz}$, 1H), 7.46-7.52 (m, 1H), 7.33-7.38 (m, 1H), 6.75 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 1H), 6.49 (s, 1H), 5.13 (d, $J=4.3\text{ Hz}$, 1H), 3.05-3.08 (d, $J=5.2\text{ Hz}$, 3H); ESI MS (m/z) 430.75, 432.75 [(MH) + Br $^{79, 81}$].

【0527】

d) 工程4: 2-(8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0528】

8-ブロモ-2-フルオロ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)インドリジン-3-カルボキサミド (2.2 g、5.10 mmol) を使用して環化し、実施例34の工程4に記載されたのと同じ合成手順に従って、2-(8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (1.8 g、4.4 mmol、収率85%) を得た。ESI MS (m/z) 412.70, 414.70 [(MH) + Br $^{79, 81}$].

【0529】

e) 工程5: 2-(8-ブロモ-2-(エチルチオ)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0530】

2-(8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (100 mg、0.2 mmol) を適切な出発物質として、実施例34の工程5に記載されたのと同じ合成手順に従って、2-(8-ブロモ-2-(エチルチオ)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (50 mg、0.1 mmol、収率45%) を得た。 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8

10

20

30

40

50

. 83 (d, $J=1.2\text{ Hz}$, 1H), 8.61 (d, $J=1.5\text{ Hz}$, 1H), 8.41 (d, $J=7.0\text{ Hz}$, 1H), 7.33 (dd, $J=7.3$, 0.6 Hz , 1H), 6.83 (d, $J=0.6\text{ Hz}$, 1H), 6.66 (t, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.98 (q, $J=7.3\text{ Hz}$, 2H), 1.18 (q, $J=7.1\text{ Hz}$, 3H); ESI MS (m/z) 454.95, 456.95 [(MH)⁺Br⁷⁹, 81].

【0531】

f) 工程6: 2-(8-ブロモ-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン:

【0532】

実施例34の工程6に記載されたのと同じ合成手順に従って2-(8-ブロモ-2-(エチルチオ)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(840mg、1.84mmol)を酸化することにより、2-(8-ブロモ-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(800mg、1.6mmol、収率89%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 8.89-8.93 (m, 1H), 8.55-8.72 (m, 1H), 8.12-8.23 (m, 1H), 7.50-7.57 (m, 1H), 7.11-7.26 (m, 1H), 6.75-6.85 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.39-3.51 (q, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 1.15 (t, $J=7.1\text{ Hz}$, 3H); ESI MS (m/z) 487.05, 489.05 [(MH)⁺Br⁷⁹, 81].

【0533】

g) 工程7: 2-(8-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン:

【0534】

実施例34の工程7に記載されたのと同じ合成手順に従いながら、2-(8-ブロモ-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(150mg、0.31mmol)及び(3,5-ジクロロフェニル)ボロン酸(58.7mg、0.31mmol)を使用したスズカップリングにより、2-(8-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(65mg、0.1mmol、収率38%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 8.93 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.22 (d, $J=7.1\text{ Hz}$, 1H), 7.81 (s, 3H), 7.27 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 1H), 6.99-7.13 (m, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.40 (q, $J=7.2\text{ Hz}$, 2H), 1.11 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 3H); ESI-MS (m/z) 553.15, 555.15 [(MH)⁺Cl³⁵, 37].

【0535】

実施例4: 2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(化合物番号8)の合成:

【0536】

実施例42の工程2で得られた8-ブロモ-2-フルオロインドリジン-3-カルボン酸エチルから出発し、2-(8-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンの合成について記載した工程3~7の同じシーケンスに従って表題化合物を調製し、2-(6-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)インドリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンを得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆)

) δ 8.92–8.93 (m, 1H), 8.71–8.71 (m, 1H), 8.55 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 7.90–7.94 (m, 1H), 7.73–7.77 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 7.53 (dd, $J=9.4, 1.6$ Hz, 1H), 7.01–7.28 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.33–3.42 (m, 2H), 1.15 (t, $J=6.2$ Hz, 3H); ESI MS (m/z) 553.00, 555.00 [(MH) + Cl^{35, 37}].

【0537】

実施例5：2-(2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(化合物番号9)の合成：

【0538】

a) 工程1：2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル：

【0539】

酢酸(20 mL)中の5-アミノ-3-(エチルチオ)-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチル(2 g、9.3 mmol) [Acta Chimica Sinica 2003, 63, 855; Organic & Biomolecular Chemistry, 2010, 8, 3394に記載されている手順に従って調製]及び2,4-ペンタンジオン(1.15 mL、11.15 mmol)の攪拌溶液に、2滴の濃硫酸を添加した。得られた混合物を50℃で15分間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水(5 mL)を上記の反応混合物に添加し、反応混合物を酢酸エチル(10 mL)で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の20%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル(2.0 g、7.20 mmol、収率77%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 7.04 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 4.25 (q, $J=7.1$ Hz, 2H), 3.17 (q, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.67–2.83 (m, 3H), 2.56 (d, $J=23.7$ Hz, 3H), 1.36–1.53 (m, 3H), 1.30 (q, $J=6.9$ Hz, 3H); ESI MS (m/z) 280.20 (MH)⁺.

【0540】

b) 工程2：2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸：

【0541】

エタノール(37.5 mL)及び水(37.5 mL)の混合物中の2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル(2.3 g、8.2 mmol)の攪拌懸濁液に、水酸化リチウム-水和物(5.18 g、123.0 mmol)を添加した。反応混合物を60℃で17時間攪拌した。反応完了後、反応混合物を減圧下で濃縮してエタノールを除去した。残渣を1N塩酸溶液で処理し、得られた2-(エチルチオ)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸の沈殿物(88 mg、0.35 mmol、収率59%)を濾別し、水(10 mL)で洗浄し、真空下で乾燥させた。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 12.16 (s, 1H), 7.02 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 3.15 (q, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.67 (d, $J=0.9$ Hz, 3H), 2.53 (s, 3H), 1.37 (t, $J=7.3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z) 252.15 (MH)⁺.

【0542】

c) 工程3：2-(エチルチオ)-5,7-ジメチル-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボキサミド：

【0543】

10

20

30

40

50

無水N, N-ジメチルホルムアミド (27 mL) 中の2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-カルボン酸 (500 mg、2 mmol) の溶液に、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1, 2, 3-トリアゾール [4, 5-b] ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェート (HATU) (908 mg、2.4 mmol) を添加し、反応混合物を0~5℃で15分間で攪拌した。その後、N-2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2, 3-ジアミン (761 mg、4 mmol) 及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン (1 mL、6 mmol) を上記の反応混合物に添加し、反応物を100℃で16時間加熱した。反応完了後、水 (40 mL) を反応混合物に添加し、次いでこれを酢酸エチル (30 mL) で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチル-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-カルボキサミド (510 mg、1.20 mmol、収率60%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.74 (s, 1H), 8.27 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.05-8.07 (m, 1H), 7.14-7.28 (m, 1H), 6.80 (d, J=4.9 Hz, 1H), 3.22 (q, J=7.3 Hz, 2H), 2.92 (d, J=4.6 Hz, 3H), 2.76 (d, J=0.5 Hz, 3H), 2.64 (s, 3H), 1.41 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 425.20 (MH)⁺.

【0544】

d) 工程4: 2-(2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン:

【0545】

N-メチル-2-ピロリドン (8 mL) 中の2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチル-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-カルボキサミド (380 mg、0.90 mmol)、p-トルエンスルホン酸一水和物 (511 mg、2.7 mmol) の混合物を、窒素雰囲気下において電子レンジ中で150℃で1.5時間照射した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水 (50 mL) を上記の反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル (50 mL) で抽出した。酢酸エチル層を水 (30 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (194 mg、0.5 mmol、収率53%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.64 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.31 (d, J=1.5 Hz, 1H), 6.65 (d, J=0.7 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.29 (q, J=7.4 Hz, 2H), 2.79 (d, J=0.7 Hz, 3H), 2.57 (s, 3H), 1.46 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 407.10 (MH)⁺.

【0546】

実施例6: 2-(2-(エチルスルホニル)-5, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (化合物番号10) の合成:

【0547】

ジクロロメタン (8 mL) 中の2-(2-(エチルチオ)-5, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (165 mg、0.4 mmol) の溶液に、m-ク

10

20

30

40

50

ロ口過安息香酸 (255 mg、0.8 mmol) を 0~5℃ で少しずつ添加した。反応混合物を 25℃ で 5 時間攪拌した。反応完了後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタン (20 mL) で抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の 60% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルスルホニル)-5,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (92 mg、0.2 mmol、収率 52%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.84 (s, 1H), 8.61 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J=1.0 Hz, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.73 (q, J=7.3 Hz, 2H), 2.83 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 1.25 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 439.25 (MH)⁺.

【0548】

実施例 7: 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (化合物番号 19) の合成:

【0549】

a) 工程 1: 2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル:

【0550】

酢酸 (65.4 mL) 中の 3-アミノ-5-(エチルチオ)-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチル (1.9 g、9 mmol) の攪拌溶液に、(E)-3-(ジメチルアミノ)-1-(4-フルオロフェニル)プロパ-2-エン-1-オン (1.7 g、9 mmol) を添加し、得られた混合物を 50℃ で 2 時間加熱した。反応完了後、酢酸を減圧下で除去し、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の 30% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル (2.2 g、6.37 mmol、収率 71%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.77 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.20-8.25 (m, 2H), 7.44-7.49 (m, 2H), 7.42 (d, J=4.6 Hz, 1H), 4.30 (q, J=7.1 Hz, 2H), 3.09 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.33 (dt, J=15.6, 7.2 Hz, 6H); ESI MS (m/z) 346.30 (MH)⁺.

【0551】

b) 工程 2: 2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸:

【0552】

エタノール (30 mL) 及び水 (30 mL) の混合物中の 2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸エチル (2.2 g、6.4 mmol) の攪拌懸濁液に、水酸化リチウム-水和物 (2.7 g、63.7 mmol) を添加した。反応混合物を 60℃ で 2 時間攪拌した。反応完了後、反応混合物を減圧下で濃縮してエタノールを除去した。残渣を 1 N 塩酸溶液で処理し、得られた 2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸の沈殿物 (1.6 g、5 mmol、収率 79%) を濾別し、水 (10 mL) で洗浄し、真空下で乾燥させた。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.44 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.28 (ddd, J=12.1, 5.3, 3.2 Hz, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.19 (d, J=4.6 Hz, 1H), 3.00 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.32 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 317.90 (M)⁺.

【0553】

c) 工程3: 2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボキサミド:

【0554】

無水ジクロロメタン(15 mL)中の2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボン酸(500 mg、1.58 mmol)の懸濁液に、2滴のN,N-ジメチルホルムアミドを添加し、続いて塩化オキサリル(0.2 mL、2.4 mmol)を添加し、得られた反応混合物を25℃で4時間撹拌した。反応混合物を減圧下で60℃の浴温で蒸発させた。得られた残渣を無水ジクロロメタン(15 mL)に溶解し、N-2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2,3-ジアミン(304 mg、1.6 mmol)及びトリエチルアミン(0.9 mL、6.6 mmol)の撹拌溶液に0℃で滴下添加した。反応混合物を25℃で16時間撹拌した。反応完了後、水(40 mL)を反応混合物に添加し、次いでこれを酢酸エチル(20 mL)で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボキサミド(377 mg、0.8 mmol、収率49%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.51 (s, 1H), 8.85 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.28-8.34 (m, 3H), 7.90 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 3H), 6.92 (d, J=4.6 Hz, 1H), 3.14 (q, J=7.2 Hz, 2H), 2.89 (d, J=4.6 Hz, 3H), 1.33-1.39 (m, 3H); ESI MS (m/z) 490.95 (M)⁺.

【0555】

d) 工程4: 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン:

【0556】

N-メチル-2-ピロリドン(8 mL)中の2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボキサミド(377 mg、0.8 mmol)、p-トルエンスルホン酸一水和物(439 mg、2.3 mmol)の混合物を窒素雰囲気下において電子レンジ中で150℃で1.5時間照射した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水(50 mL)を上記の反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル(150 mL)で抽出した。酢酸エチル層を水(50 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(185 mg、0.4 mmol、収率51%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.77 (q, J=0.9 Hz, 1H), 8.75 (d, J=4.4 Hz, 1H), 8.54-8.54 (m, 1H), 8.29-8.33 (m, 2H), 7.49-7.53 (m, 2H), 7.43 (d, J=4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.17 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.36 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.00 (MH)⁺.

【0557】

実施例8: 2-(2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)

－3－メチル－6－（トリフルオロメチル）－3H－イミダゾ[4,5-c]ピリジン（化合物番号22）の合成：

【0558】

a) 工程1：2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸エチル：

【0559】

酢酸（38 mL）中の5－アミノ－3－（エチルチオ）－1H－ピラゾール－4－カルボン酸エチル（1.3 g、6 mmol）の攪拌溶液に、3－（ジメチルアミノ）アクロレイン（0.9 mL、9.1 mmol）を添加した。反応混合物を25℃で24時間攪拌した。反応完了後、反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液を使用して中和し、酢酸エチル（20 mL）で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の30%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸エチル（0.9 g、3.5 mmol、収率57%）を得た。¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ 9.18（dd, J=6.9, 1.7 Hz, 1H）, 8.74（q, J=1.9 Hz, 1H）, 7.20（dd, J=7.0, 4.3 Hz, 1H）, 4.27（q, J=7.1 Hz, 2H）, 3.16（q, J=7.3 Hz, 2H）, 1.37（t, J=7.3 Hz, 3H）, 1.25－1.31（m, 3H）；ESI MS（m/z）252.10（MH）⁺。

【0560】

b) 工程2：2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸：

【0561】

エタノール（50 mL）及び水（50 mL）の混合物中の2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸エチル（0.9 g、3.5 mmol）の攪拌懸濁液に、水酸化リチウム水和物（1.45 g、34.6 mmol）を添加した。反応混合物を60℃で2時間攪拌した。反応完了後、反応混合物を減圧下で濃縮してエタノールを除去した。残渣を1N塩酸溶液で処理し、得られた2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸の沈殿物（0.6 g、2.8 mmol、81%収率）を濾別し、水（10 mL）で洗浄し、真空下で乾燥させた。¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ 12.38（s, 1H）, 9.16（dd, J=7.0, 1.8 Hz, 1H）, 8.69（q, J=2.0 Hz, 1H）, 7.16（dd, J=6.7, 4.3 Hz, 1H）, 3.14（q, J=7.3 Hz, 2H）, 1.36（t, J=7.5 Hz, 3H）；ESI MS（m/z）223.85（M）⁺。

【0562】

c) 工程3：2－（エチルチオ）－N－（5－（メチルアミノ）－2－（トリフルオロメチル）ピリジン－4－イル）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボキサミド：

【0563】

無水ジクロロメタン（14 mL）中の2－（エチルチオ）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボン酸（325 mg、1.5 mmol）の懸濁液に、2滴のN,N-ジメチルホルムアミドを添加し、続いて塩化オキサリル（0.2 mL、2.2 mmol）を添加し、得られた混合物を25℃で4時間攪拌した。反応混合物を減圧下、60℃の浴温で蒸発させた。得られた残渣を無水ジクロロメタン（14 mL）に溶解し、N-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-3,4-ジアミン（278 mg、1.5 mmol）及びトリエチルアミン（0.85 mL、6.1 mmol）の攪拌溶液に0℃で滴下添加した。反応混合物を25℃で16時間攪拌した。反応完了後、水（40 mL）を反応混合物に添加し、酢酸エチル（20 mL）で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2－（エチルチオ）－N－（5－（メチルアミノ）－2－（トリフルオロメチル）ピリジン－4－イル）ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン－3－カルボキサミド（

392 mg、1 mmol、収率68%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.45 (d, J=6.8 Hz, 1H), 8.26 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.11 (d, J=6.1 Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.72 (dd, J=6.8, 4.2 Hz, 1H), 5.18-4.61 (2H), 3.35 (s, 3H), 3.21 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.41-1.44 (m, 3H); ESI MS (m/z) 397.05 (MH)⁺.

【0564】

d) 工程4: 2-(2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン:
【0565】

N-メチル-2-ピロリドン(9 mL)中の2-(エチルチオ)-N-(5-(メチルアミノ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-カルボキサミド(392 mg、1 mmol)、p-トルエンスルホン酸-水和物(564 mg、3 mmol)の混合物を、窒素雰囲気下において電子レンジ中で150℃で1.5時間照射した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。水(50 mL)を上記の反応混合物に添加し、続いて酢酸エチル(150 mL)で抽出した。酢酸エチル層を水(30 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の40%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン(256 mg、0.7 mmol、収率68%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.27 (dd, J=6.8, 1.7 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.70 (dd, J=4.3, 1.6 Hz, 1H), 8.19 (d, J=0.7 Hz, 1H), 7.21 (dd, J=6.8, 4.2 Hz, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.22 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.32-1.38 (m, 3H); ESI MS (m/z) 378.90 (MH)⁺.

【0566】

実施例9: 2-(2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン(化合物番号23)の合成:

【0567】

ジクロロメタン(9 mL)中の2-(2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン(187 mg、0.5 mmol)の溶液に、m-クロロ過安息香酸(262 mg、1 mmol)を0~5℃で少しずつ添加した。反応混合物を25℃で5時間撹拌した。反応完了後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタン(20 mL)で抽出した。ジクロロメタン抽出物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の60%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン(105 mg、0.3 mmol、収率52%)を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.50 (dd, J=7.1, 1.7 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.87 (q, J=2.0 Hz, 1H), 8.25 (d, J=0.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=7.2, 4.0 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.74 (q, J=7.4 Hz, 2H), 1.24 (t, J=7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z) 411.05 (MH)⁺.

【0568】

実施例10: 2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾ

10

20

30

40

50

ロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (化合物番号 25) の合成:

【0569】

ジクロロメタン (6 mL) 中の 2-(2-(エチルチオ)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (185 mg、0.4 mmol) の溶液に、m-クロロ過安息香酸 (208 mg、0.8 mmol) を 0~5℃ で少しずつ添加した。反応混合物を 25℃ で 5 時間攪拌した。反応完了後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタン (15 mL) で抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の 60% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(2-(エチルスルホニル)-7-(4-フルオロフェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (120 mg、0.2 mmol、収率 61%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.90 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.85 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.25-8.28 (m, 2H), 7.69 (d, J=4.6 Hz, 1H), 7.53-7.59 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J=7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 505.10 (MH)⁺.

【0570】

実施例 11: 2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6-(トリフルオロメチル) - 3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (化合物番号 102) の合成:

【0571】

a) 工程 1: 2-シアノ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル) アセトアミド:

【0572】

ジメチルホルムアミド (350 mL) 中の 2-シアノ酢酸 (7 g、82 mmol)、N 2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2, 3-ジアミン (12.58 g、65.8 mmol)、及びヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt) (15.12 g、99 mmol) の攪拌溶液に、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (EDC-HCl) (18.93 g、99.0 mmol) 及び N,N-ジイソプロピルエチルアミン (35.9 mL、206 mmol) を添加した。得られた混合物を窒素雰囲気下において 25℃ で 24 時間攪拌した。反応完了後、水 (100 mL) を上記の反応混合物に添加し、反応混合物を酢酸エチル (100 mL) で 3 回抽出した。合わせた酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の 30% 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-シアノ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル) アセトアミド (11.8 g、45.7 mmol、収率 55.5%) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.61 (s, 1H), 8.26 (d, J=1.0 Hz, 1H), 7.64 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.94 (d, J=4.4 Hz, 1H), 3.83 (d, J=17.6 Hz, 2H), 2.87 (d, J=4.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 258 (M)⁺.

【0573】

b) 工程 2: 2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル) アセトニトリル:

【0574】

酢酸 (120 mL) 中の 2-シアノ-N-(2-(メチルアミノ)-5-(トリフルオ

ロメチル)ピリジン-3-イル)アセトアミド(11.8 g、45.7 mmol)の溶液を100℃で2時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却した。反応混合物を減圧下で濃縮して酢酸を除去した。水(100 mL)を上記濃縮反応混合物に添加し、反応混合物を酢酸エチル(75 mL)で3回抽出した。酢酸エチル層を水(100 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の15%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)アセトニトリル(9.0 g、37.5 mmol、収率82%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.76 (t, J=1.0 Hz, 1H), 8.55-8.56 (m, 1H), 4.69 (s, 2H), 3.82 (s, 3H); ESI MS (m/z) 240.95 (MH)⁺.

10

【0575】

c) 工程3: 3,3-ビス(エチルチオ)-2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)アクリロニトリル

【0576】

アセトニトリル(80 mL)中の2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)アセトニトリル(8.8 g、36.6 mmol)の攪拌溶液に、水酸化カリウム(4.84 g、73.3 mmol)を25℃で添加した。得られた反応混合物を25℃で1時間攪拌した。反応混合物をさらに-5℃に冷却し、二硫化炭素(2.2 mL、36.6 mmol)を10分間にわたって滴下添加した。反応混合物を-5℃で1時間攪拌した。さらに反応混合物中に、ヨウ化エチル(5.92 mL、73.3 mmol)を0℃で15分にわたって滴下添加した。反応混合物を再び0℃で2時間攪拌し、25℃で16時間放置した。反応混合物を減圧下で濃縮した。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の10%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、3,3-ビス(エチルチオ)-2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)アクリロニトリル(12.4 g、33.3 mmol、収率91%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.84 (q, J=1.0 Hz, 1H), 8.62 (q, J=0.9 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.25 (q, J=7.3 Hz, 2H), 2.84 (q, J=7.4 Hz, 2H), 1.37 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.14 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 373.00 (MH)⁺.

20

30

【0577】

d) 工程4: 3-(エチルチオ)-4-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-アミン

【0578】

アセトニトリル(1 mL)及びエタノール(2 mL)の混合物中の3,3-ビス(エチルチオ)-2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)アクリロニトリル(1 g、2.69 mmol)の攪拌溶液に、ヒドラジン-水和物(0.17 mL、2.69 mmol (79% w/v))を0℃で滴下添加した。反応混合物を0℃で1時間攪拌した。反応混合物を氷冷水(20 mL)で希釈し、固体を沈殿させた。沈殿した固体を濾過し、水で洗浄し、真空下で乾燥させて、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液として100%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、3-(エチルチオ)-4-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-アミン(720 mg、2.1 mmol、収率78%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 12.01 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 5.75 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.88 (q, J=6.8 Hz, 2H), 1.15 (t, J=6.8 Hz, 3H); ESI MS (

40

50

m/z) 343.00 (MH)⁺.

【0579】

e) 工程5: 2-(エチルチオ)-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7(4H)-オン

【0580】

酢酸(5 mL)中3-(エチルチオ)-4-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-アミン(550 mg、1.61 mmol)及びその非環化中間体の攪拌溶液に、3,3-ジメトキシプロパン酸メチル(0.34 mL、2.41 mmol)を添加した。反応混合物を100℃で6時間加熱した。反応混合物を25℃に冷却し、減圧下で濃縮して酢酸を除去した。水(20 mL)を上記濃縮反応混合物に添加し、反応混合物を酢酸エチル(25 mL)で3回抽出した。酢酸エチル層を水(50 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮し、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてジクロロメタン中の5%メタノールを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(エチルチオ)-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7(4H)-オン(375 mg、0.95 mmol、収率59%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 12.40 (s, 1H), 8.80 (q, J=0.9 Hz, 1H), 8.56 (dd, J=2.1, 0.6 Hz, 1H), 7.84 (d, J=7.3 Hz, 1H), 5.87 (d, J=7.3 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.16 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.32 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 395.00 (M-H)⁺.

【0581】

f) 工程6: 2-(7-ブromo-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン

【0582】

アセトニトリル(28 mL)中の2-(エチルチオ)-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7(4H)-オン(1.05 g、2.66 mmol)の攪拌溶液に、炭酸カリウム(1.10 g、7.99 mmol)及びオキシ臭化リン(2.29 g、7.99 mmol)を25℃で添加した。反応混合物をさらに95℃で4時間加熱した。反応混合物を0℃に冷却した。反応混合物を氷水混合物(50 mL)で希釈した。飽和重炭酸ナトリウム水溶液をゆっくりと添加することにより、反応混合物のpHを7~8に調整した。反応混合物を酢酸エチル(50 mL)で3回抽出した。酢酸エチル層を水(50 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の50%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-(7-ブromo-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(980 mg、2.14 mmol、収率80%)を得た。¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.77 (t, J=1.1 Hz, 1H), 8.55 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.48 (d, J=4.6 Hz, 1H), 7.65 (d, J=4.6 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.25 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.40 (t, J=7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 456.95, 458.95 (MH; Br^{79,81})⁺.

【0583】

g) 工程7: 2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン

【0584】

テトラヒドロフラン（4 mL）及び水（2 mL）の混合物中の2-（7-ブromo-2-（エチルチオ）ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（170 mg、0.37 mmol）及び（3-クロロ-5-フルオロフェニル）ボロン酸（78 mg、0.446 mmol）の溶液に、炭酸ナトリウム（197 mg、1.86 mmol）を添加した。反応混合物を、真空／窒素サイクルに3回供することによって十分に脱酸素化した。テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）（12.9 mg、0.01 mmol）を反応混合物に添加し、85℃で4時間加熱した。反応完了後、反応混合物を25℃に冷却し、セライトのパッドを通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮し、粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の20%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、2-（7-（3-クロロ-5-フルオロフェニル）-2-（エチルチオ）ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル）-3-メチル-6-（トリフルオロメチル）-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（120 mg、0.24 mmol、収率64%）を得た。¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ 8.77-8.79（m, 2H）, 8.55（d, J=1.5 Hz, 1H）, 8.23（d, J=1.5 Hz, 1H）, 8.10（dq, J=9.7, 1.2 Hz, 1H）, 7.79（dt, J=8.8, 2.1 Hz, 1H）, 7.55（d, J=4.6 Hz, 1H）, 3.96（s, 3H）, 3.16（q, J=7.3 Hz, 2H）, 1.40（t, J=7.2 Hz, 3H）; ESI MS（m/z）506.95, 508.95（MH⁺; C₁₃H₁₅N₅Cl₂）。

10

20

【0585】

実施例12：3-（7-（3, 5-ジクロロフェニル）-2-（エチルスルホニル）ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル）-6-（トリフルオロメチル）-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン（化合物番号111）の合成

【0586】

a) 工程1：2-ヒドラジニル-5-（トリフルオロメチル）ピリジン：

【0587】

エタノール中の2-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン（10.0 g、55.1 mmol）の攪拌溶液に、ヒドラジン水和物（5.18 g、123 mmol）を添加した。得られた反応混合物を90℃で16時間攪拌した。反応混合物を25℃に冷却し、減圧下で濃縮してエタノールを除去した。水（50 mL）を上記濃縮反応混合物に添加し、反応混合物を酢酸エチル（200 mL）で3回抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧濃縮して、2-ヒドラジニル-5-（トリフルオロメチル）ピリジン（8.50 g、48.00 mmol、収率87%）を得た。¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ 8.25（d, J=0.7 Hz, 2H）, 7.68（dd, J=9.0, 2.4 Hz, 1H）, 6.78（d, J=9.0 Hz, 1H）, 4.32（s, 2H）; ESI MS（m/z）178.10（MH⁺）。

30

【0588】

b) 工程2：7-（3, 5-ジクロロフェニル）-2-（エチルチオ）-N'-（5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル）ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-カルボヒドラジド：

40

【0589】

N, N-ジメチルホルムアミド（8 mL）中の2-ヒドラジニル-5-（トリフルオロメチル）ピリジン（0.80 g、4.52 mmol）の攪拌溶液に、7-（3, 5-ジクロロフェニル）-2-（エチルチオ）ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-カルボン酸（1.66 g、4.52 mmol）、1-（3-ジメチルアミノプロピル）-3-エチルカルボジイミド塩酸塩（1.29 g、6.77 mmol）、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（0.91 g、6.77 mmol）、及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン（1.75 mL、13.55 mmol）を0℃で添加した。反応混合物を窒素雰囲気下に

50

において25℃で16時間攪拌した。反応完了後、水(20mL)を反応混合物に添加し、得られた沈殿物を濾過し、減圧下で乾燥させて、7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)-N'-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボヒドラジド(1.2g、2.27mmol、収率50%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 9.78(s, 1H), 9.39(s, 1H), 8.83(dd, J=11.9, 4.6Hz, 1H), 8.42(d, J=20.2Hz, 1H), 8.24-8.29(m, 2H), 7.91-7.99(m, 1H), 7.84(dd, J=8.9, 2.1Hz, 1H), 7.58-7.61(m, 1H), 6.77(d, J=8.7Hz, 1H), 3.09(q, J=7.2Hz, 2H), 1.40(t, J=7.2Hz, 3H); ESI MS (m/z) 527.25 (MH)⁺.

10

【0590】

c) 工程3: 3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン:

【0591】

7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)-N'-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボヒドラジド(1g、1.90mmol)に、塩化ホスホリル(3mL)を添加し、得られた反応混合物を90℃で6時間加熱した。反応混合物を25℃で冷却し、減圧下で濃縮した。反応混合物をさらに0℃に冷却し、得られた塊を飽和重炭酸ナトリウム溶液で処理して、pHを塩基性(pH9)にした。得られた混合物を酢酸エチル(50mL)で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、還元下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の25%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン(500mg、0.98mmol、収率52%)を得た。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 9.09(d, J=1.0Hz, 1H), 8.72(d, J=4.4Hz, 1H), 8.32(d, J=2.0Hz, 2H), 8.09(d, J=9.8Hz, 1H), 7.96(t, J=2.0Hz, 1H), 7.68(dd, J=9.7, 1.6Hz, 1H), 7.56-7.58(m, 1H), 3.17(q, J=7.3Hz, 2H), 1.42(t, J=7.3Hz, 3H); ESI MS (m/z) 508.70 (MH)⁺.

20

30

【0592】

d) 工程4: 3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン:

【0593】

ジクロロメタン(8mL)中の3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン(0.35g、0.68mmol)の溶液に、m-クロロペル安息香酸(0.58g、2.06mmol、60%)を0℃で添加した。得られた反応混合物を25℃で16時間攪拌した。反応混合物をジクロロメタン(20mL)で希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液(20mL)で2回洗浄し、続いて水(10mL)で洗浄した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、溶離液としてヘキサン中の30%酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製して、3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン(210mg、0.388mmol、収率56%)を得た。¹H-NMR(400M

40

50

H z, DMSO-d₆) δ 8.90 (d, J=4.4 Hz, 2H), 8.24 (d, J=1.7 Hz, 2H), 8.15 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.01 (t, J=2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J=4.6 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=9.7, 1.6 Hz, 1H), 3.62 (q, J=7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J=7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 540.90 (MH)⁺.

【0594】

実施例13: (7-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)(エチル)(イミノ)-λ⁶-スルファノン(化合物番号135)の合成:

【0595】

メタノール(6 mL)中の2-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(312 mg、0.60 mmol)及びカルバミン酸アンモニウム(140 mg、1.79 mmol)の攪拌溶液に、ヨードベンゼンジアセテート(384 mg、1.19 mmol)を0℃で添加した。得られた反応混合物を25℃で16時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮した。粗残渣を水(20 mL)で希釈し、混合物を酢酸エチル(50 mL)で3回抽出した。酢酸エチル層を水(30 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して粗生成物を得た。粗生成物を分取HPLCにより精製して、(7-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)(エチル)(イミノ)-λ⁶-スルファノン(110 mg、0.2 mmol、収率44%)を得た。1H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.90 (d, J=4.4 Hz, 1H), 8.84 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.62 (t, J=1.1 Hz, 1H), 8.25 (d, J=2.0 Hz, 2H), 7.98 (t, J=2.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J=4.4 Hz, 1H), 4.80 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.49-3.56 (m, 2H), 1.28 (t, J=7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.00 (MH)⁺.

【0596】

以下の化合物(表-1)は、スキーム1~23又は実施例に記載されているような類似の手順を使用して得られた。

【0597】

10

20

30

40

50

【表 1 - 1】

化合物 番号	化合物名	分析データ
1	2 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.92 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 8.15-8.17 (m, 1H), 7.68-7.74 (m, 3H), 7.52-7.55 (m, 1H), 7.16-7.20 (m, 1H), 6.93-6.99 (m, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.05 (dtd, J = 63.8, 14.5, 7.3 Hz, 2H), 0.89-1.1 (m, 3H); ESI-MS(m/z) 553.90, (MH)+
2	2 - (2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.93-8.93 (m, 1H), 8.73 (dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 7.0, 1.1 Hz, 1H), 7.94 (dt, J = 9.2, 1.1 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 9.0, 6.8, 1.2 Hz, 1H), 7.22 (td, J = 6.9, 1.1 Hz, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.49-3.52 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 1.15-1.24 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 409.95 (MH)+.
3	6 - (1 - ブロモ - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.34 (s, 1H), 8.35-8.42 (m, 2H), 7.90-7.96 (m, 1H), 7.56-7.73 (m, 1H), 7.22 (td, J = 6.9, 1.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.52 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.18 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 410.00 (MH)+.
4	2 - (2 - (エチルスルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) ペンゾ [d] オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.49-9.53 (m, 1H), 8.38-8.40 (m, 1H), 8.14 (dd, J = 14.3, 8.4 Hz, 1H), 8.05 (dt, J = 9.0, 1.2 Hz, 1H), 7.87-7.91 (m, 1H), 7.80 (ddd, J = 9.0, 6.8, 1.2 Hz, 1H), 7.51 (td, J = 7.0, 1.3 Hz, 1H), 3.73-3.79 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 395.90 (MH)+.
5	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (トリフルオロメチル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.32 (s, 1H), 8.34-8.36 (m, 2H), 8.26 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.10 (dd, J = 7.5, 2.0 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.36-3.41 (m, 2H), 1.11 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 477.00 (MH)+.
6	2 - (8 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.93 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.22 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.81 (s, 3H), 7.27 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.99-7.13 (m, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.40 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.11 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI-MS(m/z) 553.15, (MH)+.
7	2 - (1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) - 7 - (トリフルオロメチル) インドリジン - 3 - イル) - 3	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.94-8.95 (m, 1H), 8.74 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.72-7.87 (m, 4H), 7.16 (dd, J = 7.5, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.90-3.10 (m, 2H), 0.86-1.01 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS

10

20

30

40

【0598】

【表 1 - 2】

	ーメチルー6ー(トリフル オロメチル)ー3Hーイミ ダゾ [4, 5-b] ピリジ ン	(m/z) 621.00, (MH)+
8	2ー(6ー(3, 5ージク ロロフェニル)ー2ー(エ チルスルホニル) インドリ ジンー3ーイル)ー3ーメ チルー6ー(トリフルオロ メチル)ー3Hーイミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.92-8.93 (m, 1H), 8.71-8.71 (m, 1H), 8.55 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.90-7.94 (m, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 7.53 (dd, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 7.01-7.28 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.33-3.42 (m, 2H), 1.15 (t, J = 6.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 553.00, (MH)+ .
9	2ー(2ー(エチルチオ) ー5, 7ージメチルピラゾ ロ [1, 5-a] ピリミジ ンー3ーイル)ー3ーメチ ルー6ー(トリフルオロメ チル)ー3Hーイミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.64 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.65 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.29 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.79 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 2.57 (s, 3H), 1.46 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 407.10 (MH)+.
10	2ー(2ー(エチルスルホ ニル)ー5, 7ージメチル ピラゾロ [1, 5-a] ピ リミジンー3ーイル)ー3 ーメチルー6ー(トリフル オロメチル)ー3Hーイミ ダゾ [4, 5-b] ピリジ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.84 (s, 1H), 8.61 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 2.83 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 1.25 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 439.25 (MH)+.
11	2ー(2ー(エチルチオ) ー5, 7ージメチルピラゾ ロ [1, 5-a] ピリミジ ンー3ーイル)ー3ーメチ ルー6ー(トリフルオロメ チル)ー3Hーイミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.13 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.06 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.21 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 2.75 (s, 3H), 2.53 (d, J = 2.1 Hz, 3H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 406.90 (MH)+.
12	2ー(2ー(エチルスルホ ニル)ー5, 7ージメチル ピラゾロ [1, 5-a] ピ リミジンー3ーイル)ー3 ーメチルー6ー(トリフル オロメチル)ー3Hーイミ ダゾ [4, 5-c] ピリジ ン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.37 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.83 (d, J = 1.0 Hz, 3H), 2.57 (s, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 439.05 (MH)+.
13	2ー(2ー(エチルチオ) ー5, 7ージメチルピラゾ ロ [1, 5-a] ピリミジ ンー3ーイル)ー5ー((トリフルオロメチル)チオ)ベンゾ [d] オキサゾー ル	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.12 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.93-7.95 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.74 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 2.65 (d, J = 15.4 Hz, 3H), 1.45 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 425.05 (MH)+.
14	2ー(2ー(エチルチオ)	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.27 (dd, J =

10

20

30

40

【0599】

【表 1 - 3】

	ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 7.1, 1.7 Hz, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.71 (q, J = 2.0 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.21 (dd, J = 7.0, 4.3 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 18.6 Hz, 3H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 379.25 (MH)+.
15	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 , 7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.67 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.18-8.20 (m, 1H), 7.43 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.91 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.80 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 2.67 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ; ESI MS (m/z) 489.25(MH)+.
16	2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.50 (dd, J = 7.2, 1.6 Hz, 1H), 8.87 (dd, J = 4.0, 1.6 Hz, 1H), 8.84 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 2.1, 0.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 7.1, 4.2 Hz, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.75 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.21-1.26 (m, 3H); ESI MS (m/z) 411.15 (MH)+.
17	2 - (2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) チオ) ベンゾ [d] オキサゾール	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.27-9.29 (m, 1H), 8.82-8.83 (m, 1H), 8.13 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.69 (dt, J = 8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.26-7.30 (m, 1H), 3.28 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.43 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 396.95 (MH)+.
18	2 - (2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (dd, J = 7.1, 1.7 Hz, 1H), 9.05 (dd, J = 4.2, 1.5 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 7.1, 4.2 Hz, 1H), 3.95 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 411.15 (MH)+.
19	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.77 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.54-8.54 (m, 1H), 8.29-8.33 (m, 2H), 7.49-7.53 (m, 2H), 7.43 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.00 (MH)+.
20	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	^1H -NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.92 (s, 1H), 8.61 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 2H), 7.31 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.07 (s, 3H), 3.26 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.46 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.35 (MH)+.
21	2 - (2 - (エチルスルホ	^1H -NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.23 (s, 1H),

【 0 6 0 0 】

10

20

30

40

50

【表 1 - 4】

	ニル) - 7 - (4-フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	8.90 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.25-8.28 (m, 3H), 7.69 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 504.90 (MH)+.
22	2- (2- (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.27 (dd, J = 6.8, 1.7 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.70 (dd, J = 4.3, 1.6 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 6.8, 4.2 Hz, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.22 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.32-1.38 (m, 3H); ESI MS (m/z) 378.90 (MH)+.
23	2- (2- (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.50 (dd, J = 7.1, 1.7 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.87 (q, J = 2.0 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 7.2, 4.0 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.74 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z) 411.05 (MH)+.
24	2- (7- (3, 5-ジクロロフェニル) - 2- (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.94 (s, 1H), 8.64 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.07 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.62 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.27 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.51 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 522.70 (MH)+.
25	2- (2- (エチルスルホニル) - 7- (4-フルオロフェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.90 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.25-8.28 (m, 2H), 7.69 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 7.53-7.59 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 505.10 (MH)+.
26	2- (7- (3, 5-ジクロロフェニル) - 2- (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.94 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.99 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.71 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.00 (MH)+.
27	2- (2- (エチルチオ) - 7- (4- (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.77 (t, J = 2.3 Hz, 2H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 6.7, 2.1 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H),

10

20

30

40

【0601】

【表 1 - 5】

	ミジン-3-イル)-3- メチル-6-(トリフルオ ロメチル)-3H-イミダ ゾ[4, 5-b]ピリジン	3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.20 (MH) ⁺ .
28	2-(2-(エチルチオ) -7-(4-(トリフルオ ロメトキシ)フェニル)ピ ラゾロ[1, 5-a]ピリ ミジン-3-イル)-3- メチル-6-(トリフルオ ロメチル)-3H-イミダ ゾ[4, 5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.16 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.76-8.78 (m, 1H), 8.35-8.37 (m, 2H), 8.20 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 538.80 (MH) ⁺ .
29	2-(2-(エチルスルホ ニル)-7-(4-(トリ フルオロメトキシ)フェ ニル)ピラゾロ[1, 5-a)ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-b]ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.31 (dd, J = 6.8, 2.2 Hz, 2H), 7.70-7.73 (m, 3H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.24-1.29 (m, 3H); ESI MS (m/z) 571.25 (MH) ⁺ .
30	2-(2-(エチルスルホ ニル)-7-(4-(トリ フルオロメトキシ)フェ ニル)ピラゾロ[1, 5-a)ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-c]ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.31 (dt, J = 9.5, 2.5 Hz, 2H), 8.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.70-7.73 (m, 3H), 3.92 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.22-1.27 (m, 3H); ESI MS (m/z) 570.80 (MH) ⁺ .
31	2-(2-(エチルチオ) -7-(4-(トリフルオ ロメトキシ)フェニル)ピ ラゾロ[1, 5-a]ピリ ミジン-3-イル)-5- ((トリフルオロメチル) チオ)ベンゾ[d]オキサ ゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM- <i>D</i>) δ 8.82 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.17-8.23 (m, 3H), 7.71 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.52-7.62 (m, 1H), 7.45 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.00-7.08 (m, 1H), 3.30 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.51 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 557.15 (MH) ⁺ .
32	2-(2-(エチルスルホ ニル)-7-(4-(トリ フルオロメトキシ)フェ ニル)ピラゾロ[1, 5-a)ピリミジン-3-イル) -5-((トリフルオロメ チル)スルホニル)ベン ゾ[d]オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.10 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.26-8.28 (m, 2H), 8.22 (dd, J = 8.7, 1.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 3.92 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 620.95 (MH) ⁺ .
33	2-(2-(エチルチオ) -7-(4-フルオロフェ ニル)ピラゾロ[1, 5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.87 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.26-8.30 (m, 2H), 8.14 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.70

10

20

30

40

【0602】

【表 1 - 6】

	a] ピリミジン-3-イル) -5-((トリフルオロ メチル)チオ)ベンゾ[d]]オキサゾール	(dd, J = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.48-7.52 (m, 3H), 3.22 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.42 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 491.30 (MH)+.
34	2-(2-(エチルスルホ ニル)-7-(4-フルオ ロフェニル)ピラゾロ[1 , 5-a]ピリミジン-3- イル)-5-((トリフル オロメチル)スルホニル)ベンゾ[d]オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.04 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.11-8.22 (m, 3H), 7.99 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.34-7.39 (m, 3H), 3.67-3.88 (m, 2H), 1.53- 1.75 (m, 3H); ESI MS (m/z) 555.00 (MH)+.
35	2-(7-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルチ オ)ピラゾロ[1, 5-a]]ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-c]ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.16 (s, 1H), 8.76 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.25 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 8.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 6.7, 1.8 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 488.75 (MH) ⁺ .
36	2-(7-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルチ オ)ピラゾロ[1, 5-a]]ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-b]ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.75-8.77 (m, 2H), 8.55 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 489.00 (MH) ⁺ .
37	2-(7-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルス ルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル)- 3H-イミダゾ[4, 5- c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.23 (s, 1H), 8.91 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.20 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.78 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.22-1.27 (m, 3H); ESI MS (m/z) 520.95 (MH)+.
38	2-(7-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルチ オ)ピラゾロ[1, 5-a]]ピリミジン-3-イル) -5-((トリフルオロメ チル)チオ)ベンゾ[d]]オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.87 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 6.7, 2.1 Hz, 2H), 8.14 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.69-7.74 (m, 3H), 7.52 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.22 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41 (q, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 506.90 (MH)+.
39	2-(7-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルス ルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル)-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.91 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.19-8.22 (m, 2H), 7.78 (dd, J = 6.7, 2.1 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.75 (MH)+.

10

20

30

40

【0603】

【表 1 - 7】

	3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	
40	2 - (7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.08 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 8.6, 1.8 Hz, 1H), 8.16-8.18 (m, 2H), 7.76-7.79 (m, 3H), 3.90 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.00 (MH)+.
41	2 - (7 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.94 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.22 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 8.00 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.70 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.95 (MH)+.
42	2 - (7 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) チオ) ベンゾ [d] オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.92 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.17 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.96 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.65-7.74 (m, 2H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.48 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 540.95 (MH)+.
43	2 - (7 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 5 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.12 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 8.7, 1.8 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.99 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.89 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.33 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 605.00 (MH)+.
44	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - フェニルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.25-8.27 (m, 2H), 7.83 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 3.2 Hz, 3H), 4.05 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 455(MH)+
45	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - フェニルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.26-8.29 (m, 2H), 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.54-7.57 (m, 3H), 4.13 (s, 3H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 455.05(MH)+
46	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - フェニルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.56 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz,

10

20

30

40

【 0 6 0 4 】

【表 1 - 8】

	ジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	2H), 8.14 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 13.9, 6.1 Hz, 3H), 3.89 (s, 3H), 3.82 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 487.15(MH)+
47	2-(2-(エチルスルホニル)-5-フェニルピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.55 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.25 (t, J = 6.7 Hz, 3H), 8.14 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.52-7.59 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 3.82 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 487.2(MH)+
48	2-(6-クロロ-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.72 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 2.2 Hz, 2H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.22 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 412.90(MH)+
49	2-(2-(エチルチオ)-6-フェニルピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.66 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.12 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.54 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.54 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.44-7.48 (m, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 455.60(MH)+
50	2-(6-クロロ-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.99 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.90 (dd, J = 39.0, 1.8 Hz, 2H), 8.62 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.71-3.78 (m, 5H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 445.20(MH)+
51	2-(2-(エチルチオ)-5-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 8.40 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 8.20 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.3(MH)+
52	2-(6-クロロ-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.78 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.21 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 412.90(MH)+
53	2-(6-クロロ-2-(エチルスルホニル)ピラゾ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.99 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.95 (d, J = 2.2 Hz,

10

20

30

40

【0605】

50

【表 1 - 9】

	ロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H), 8.26 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.74 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 445.05(MH)+
54	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - フェニルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.89 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.92-7.94 (m, 2H), 7.52-7.60 (m, 3H), 3.83 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 487.15(MH)+
55	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.78 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.37-8.40 (m, 2H), 7.86 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 4.03 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.15(MH)+
56	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.60 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.36-8.38 (m, 2H), 8.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.99 (s, 3H), 3.82 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.1(MH)+
57	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.77 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.54 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.31-8.35 (m, 2H), 7.82 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 8.8 Hz, 2H), 4.03 (s, 3H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.3(MH)+
58	2 - (6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.54 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 488.95(MH)+
59	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a]	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.60 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.34-8.37 (m, 2H), 8.16 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.89

10

20

30

40

【 0 6 0 6 】

【表 1 - 10】

	〕ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-b]ピ リジン	(s, 3H), 3.82 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.6(MH)+
60	2-(2-(エチルチオ) -5-(4-フルオロフェ ニル)ピラゾロ[1, 5- a]ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリ フルオロメチル)-3H- イミダゾ[4, 5-c]ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 8.33-8.37 (m, 2H), 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 4.11 (s, 3H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.3(MH)+
61	2-(2-(エチルスルホ ニル)-5-(4-フルオ ロフェニル)ピラゾロ[1 , 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ[4, 5- c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.56 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.31-8.34 (m, 2H), 8.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.34-7.40 (m, 2H), 3.99 (s, 3H), 3.81 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 505.05(MH)+
62	2-(2-(エチルスルホ ニル)-5-(4-フルオ ロフェニル)ピラゾロ[1 , 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ[4, 5- b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.56 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.86 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63- 8.63 (m, 1H), 8.31 (ddd, J = 12.2, 5.4, 3.2 Hz, 2H), 8.14 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.82 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 505.3(MH)+
63	2-(6-(4-クロロフ ェニル)-2-(エチルス ルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル)- 3H-イミダゾ[4, 5- b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.93 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.63 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.65 (dt, J = 9.1, 2.4 Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.95(MH)+
64	2-(2-(エチルチオ) -6-フェニルピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6- (トリフルオロメチル) -3H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.66 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 9.11 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.54 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.44-7.48 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 455.10(MH)+
65	2-(5-(3, 5-ジク ロロフェニル)-2-(エ チルチオ)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3- イル)-3-メチル-6-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.41 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.77 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 8.55- 8.55 (m, 1H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.95 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.83 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t,

10

20

30

40

【0607】

【表 1 - 1 1】

	(トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.90(MH)
66	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - フェニルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.89 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92-7.94 (m, 2H), 7.57-7.61 (m, 2H), 7.50-7.54 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 487.30(MH)+
67	2 - (5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.65 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.64 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.23-8.26 (m, 3H), 7.85 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.81 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.00(MH)+
68	2 - (5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.40 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.27 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.20 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.83 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 4.09 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.90(MH)+
69	2 - (5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.65 (t, J = 3.8 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.28 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.24-8.25 (m, 3H), 7.86 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.80 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.05(MH)+
70	2 - (6 - ブロモ - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.76 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.76 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.21 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ; ESI MS (m/z) 458.90(MH)+
71	2 - (6 - ブロモ - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.03 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.96 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.85 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.62-8.63 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.74 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 490.75(MH)+
72	2 - (6 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.78 (d, J =

10

20

30

40

【 0 6 0 8 】

50

【表 1 - 1 2】

	ロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	2.4 Hz, 1H), 9.15 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 7.68 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 523.00(MH)+
73	2 - (6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 9.11 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.94 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 4.05 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 489.15(MH)+
74	2 - (6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.93 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 9.24-9.27 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 7.96 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.95(MH)+
75	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.35 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 8.38 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 8.21 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.72-6.98 (m, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.00(MH)+
76	2 - (6 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.07 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.77 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.00(MH)+
77	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.35 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.84 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.72-6.98 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.11(MH)+

【 0 6 0 9 】

10

20

30

40

50

【表 1 - 13】

78	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.59 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.34-8.37 (m, 2H), 8.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.71-6.97 (m, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.81 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 603.50(MH)+
79	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.59 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 6.8, 2.2 Hz, 2H), 8.15 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.71-6.97 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.82 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 603.05(MH)+
80	2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.80 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.16 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 8.20 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.69 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 523.00(MH)+
81	2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.27 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.77 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.90(MH)+
82	2 - (2 - (エチルチオ) - 6 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.02-8.05 (m, 2H), 7.54 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.15(MH)+
83	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 6 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H -	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.93 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.03-8.06 (m, 2H), 7.59 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.71-3.79 (m, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 570.90(MH)+

10

20

30

40

【0610】

【表 1-14】

	イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	
84	2-(5-(4-クロロフェニル))-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.34 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.84 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 4.02 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 488.95(MH)+
85	2-(5-(4-クロロフェニル))-2-(エチルチオ)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.34 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 8.30 (dt, J = 9.2, 2.4 Hz, 2H), 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.61 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 4.10 (s, 3H), 3.23 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 489.05(MH)+
86	2-(2-(エチルチオ)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.71 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.16 (s, 1H), 9.12 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 4.06 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 538.30(MH)+
87	2-(2-(エチルチオ)-7-(4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.76 (d, J = 4.6 Hz, 2H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dd, J = 6.7, 2.1 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.46 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 6.76-7.02 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 570.90(MH)+
88	2-(5-(4-クロロフェニル))-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.58 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.24-8.27 (m, 2H), 8.15 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.60-7.63 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.81 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.90(MH)+
89	2-(5-(4-クロロフェニル))-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.58 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.26-8.28 (m, 3H), 8.15 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.81 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 520.95(MH)+

10

20

30

40

【0611】

50

【表 1 - 15】

	3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	
90	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 -テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 -イル) - 3 -メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.92 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.27-8.30 (m, 2H), 7.72 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.76-7.04 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 602.95(MH)+
91	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 -テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 -イル) - 3 -メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.90-8.93 (m, 1H), 8.27-8.31 (m, 3H), 7.68-7.73 (m, 1H), 7.62 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 6.76-7.04 (m, 1H), 3.91 (d, J = 9.5 Hz, 3H), 3.72 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 603.15(MH)+
92	3 - (7 - (3 , 5 -ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 -イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.72 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.32 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.96 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 7.3, 1.7 Hz, 1H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 508.85(MH)+
93	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 -テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 -イル) - 3 -メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.16 (s, 1H), 8.76 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.32-8.35 (m, 2H), 8.21 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.46 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 6.76-7.02 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 571.10(MH)+
94	3 - (7 - (3 , 5 -ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 -イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.90 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.01 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 7.3, 1.7 Hz, 1H), 3.64 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 540.80(MH)+
95	2 - (2 - (エチルチオ) - 6 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 -テトラフルオロエトキシ) フェニル) ピラゾロ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.69 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.01 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.71-6.98 (m, 1H),

【 0 6 1 2 】

10

20

30

40

50

【表 1 - 16】

	[1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチ ル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	3.98 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 570.85(MH)+
96	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 6 - (4 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオ ロエトキシ) フェニル) ピ ラゾロ [1 , 5 - a] ピリ ミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオ ロメチル) - 3 H - イミダ ゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.92 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 6.6, 2.2 Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.73-6.99 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 602.80(MH)+
97	2 - (7 - (3 - クロロフ ェニル) - 2 - (エチルチ オ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリ フルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.77 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 8.55 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 488.95(MH)+
98	2 - (7 - (3 , 5 - ジフ ルオロフェニル) - 2 - (エ チルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.77-8.79 (m, 2H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.00-8.05 (m, 2H), 7.62 (tt, J = 9.2, 2.4 Hz, 1H), 7.53- 7.55 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.09-3.20 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 1.38 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 490.75(MH)+
99	2 - (7 - (3 - クロロフ ェニル) - 2 - (エチルス ルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.92 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.25 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.77-7.79 (m, 1H), 7.70-7.74 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.71 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 521.05(MH)+
100	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 6 - (4 - (トリ フルオロメトキシ) フェ ニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリ フルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピ リジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.93 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.27 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 6.7, 2.1 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 570.95(MH)+
101	2 - (7 - (3 , 5 - ジフ ルオロフェニル) - 2 - (	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.95 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.64 (d,

【0613】

10

20

30

40

50

【表 1 - 17】

	エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	J = 2.0 Hz, 1H), 7.96-7.98 (m, 2H), 7.79 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.64-7.70 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 522.80(MH)+
102	2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル))-2-(エチルチオ) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.77-8.79 (m, 2H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.10 (dq, J = 9.7, 1.2 Hz, 1H), 7.79 (dt, J = 8.8, 2.1 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 506.95(MH)+
103	2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル))-2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.95 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.06 (dq, J = 9.5, 1.3 Hz, 1H), 7.84 (dt, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 540.06
104	2-(7-(3, 4-ジクロロフェニル))-2-(エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン-3-イル) -3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.16 (dd, J = 8.6, 2.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.82 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 3.72 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.75(MH)+
105	7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)-3-(1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ [d] イミダゾール-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.74 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.05 (s, 1H), 7.94 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.14 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 521.80(MH)+
106	2-(エチルチオ)-3-(1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ [d] イミダゾール-2-イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.24 (dd, J = 7.1, 1.7 Hz, 1H), 8.66 (q, J = 2.0 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.83 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.6, 1.2 Hz, 1H), 7.17 (dd, J = 6.8, 4.2 Hz, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.20 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 377.70(MH)+
107	7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)-3-(1-メ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.91 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.99 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 8.3

【0614】

10

20

30

40

50

【表 1-18】

	チル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン	Hz, 1H), 7.77 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.71 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.85(MH) ⁺
108	2-(エチルスルホニル)-3-(1-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.48 (dd, J = 7.1, 1.7 Hz, 1H), 8.84 (q, J = 2.0 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.89 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.49 (q, J = 3.7 Hz, 1H), 3.72-3.77 (m, 5H), 1.23 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 409.70(MH) ⁺
109	2-(2-(エチルスルホニル)-6-(4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.91 (dd, J = 11.1, 2.3 Hz, 1H), 9.24-9.28 (m, 2H), 8.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03 (dt, J = 9.5, 2.5 Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.86 (tt, J = 51.9, 3.0 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.76 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 603.00(MH) ⁺
110	3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.09 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 8.09 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.96 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.7, 1.6 Hz, 1H), 7.56-7.58 (m, 1H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.42 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 508.70(MH) ⁺
111	3-(7-(3,5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.90 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 8.24 (d, J = 1.7 Hz, 2H), 8.15 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.01 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.7, 1.6 Hz, 1H), 3.62 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 540.90(MH) ⁺
112	2-(7-(2,3-ジクロロフェニル)-2-(エチルチオ)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.78 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 7.64 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.99 (s, 3H), 2.98 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 524.75(MH) ⁺
113	2-(2-(エチルチオ)-7-フェニルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.74-8.77 (m, 2H), 8.54 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.20-8.23 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 3H), 7.42 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz,

10

20

30

40

【0615】

【表 1 - 19】

	6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	2H), 1.34-1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 455.10(MH)+
114	2 - (7 - (2, 3 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.01 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 7.67-7.71 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.68 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.20 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.85(MH)+
115	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - フェニルピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.91 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.16-8.19 (m, 2H), 7.66-7.70 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 486.75(MH)+
116	2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 8.55 (s, 1H), 8.35 (dd, J = 10.8, 2.0 Hz, 1H), 8.11 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.91 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 506.70(MH)+
117	2 - (7 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (d, J = 4.6 Hz, 2H), 8.55 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.95 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.15 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 522.90(MH)+
118	2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.94 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.63-8.64 (m, 1H), 8.28 (dd, J = 10.5, 2.0 Hz, 1H), 8.07 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.96 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.05(MH)+
119	2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.18 (s, 1H), 8.80 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.37 (dd, J = 10.8, 2.0 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.12-8.14 (m, 1H), 7.93 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.19 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS

10

20

30

40

【0616】

【表 1 - 20】

	チル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	(m/z) 507.00(MH;
120	2 - (7 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.81 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.98-4.03 (m, 3H), 3.01 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 522.75(MH)+
121	2 - (7 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.99 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.20 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.00(MH)+;
122	2 - (7 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.17 (s, 1H), 8.81 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.97 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.01 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.25 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 522.95(MH)+,
123	2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.16 (s, 1H), 8.79 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 8.10 (dt, J = 9.6, 1.8 Hz, 1H), 7.80 (dt, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 506.95(MH)+
124	2 - (7 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.26 (s, 1H), 8.97 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.06-8.09 (m, 1H), 7.86 (dt, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 539.05(MH)+
125	2 - (7 - (3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.93 (s, 2H), 8.83 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.78 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.72 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.14 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 591.05(MH)+

10

20

30

40

【 0 6 1 7 】

【表 1 - 2 1】

	フルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	
126	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.77 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.15 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 523.00(MH)+
127	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.77 (t, J = 2.3 Hz, 2H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.13 (dt, J = 10.4, 2.1 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 6.7, 1.2 Hz, 1H), 7.71 (td, J = 7.9, 6.1 Hz, 1H), 7.48-7.55 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 472.75(MH)+
128	2 - (7 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.99 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.84 (s, 2H), 8.64 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.48 (s, 1H), 7.94 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.68 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 623.00(MH)+
129	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.95 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.63-8.64 (m, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.94 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.70 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.00(MH)+
130	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - フルオロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.86 (dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H), 8.63 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.04-8.08 (m, 1H), 8.01-8.03 (m, 1H), 7.72-7.78 (m, 2H), 7.55-7.60 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 504.80(MH)+
131	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.75 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.53 (dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H), 7.17 (dd, J = 4.4, 1.0 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz,

10

20

30

40

【 0 6 1 8 】

50

【表 1 - 2 2】

	- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	2H), 2.81 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 393.05(MH)+
132	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 -フルオロフェ ニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリ フルオロメチル) - 3 H -イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.16 (s, 1H), 8.77 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.13 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 14.2, 8.1 Hz, 1H), 7.49-7.56 (m, 2H), 4.04 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 473.10(MH)+
133	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 7 - メチルピラゾ ロ [1 , 5 - a] ピリミジ ン-3-イル) - 3-メチ ル-6 - (トリフルオロメ チル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.84 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.76 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 4.4, 1.0 Hz, 1H), 3.72-3.78 (m, 5H), 2.88 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 425.05(MH)+
134	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - (3 - (トリフルオ ロメチル) フェニル) ピラ ズロ [1 , 5 - a] ピリミ ジン-3-イル) - 3-メ チル-6 - (トリフルオロ メチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.16 (s, 1H), 8.79 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.21 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.15 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 523.10(MH)+
135	(7 - (3 , 5 -ジクロ フェニル) - 3 - (3 -メ チル-6 - (トリフルオロ メチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン- 2-イル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン-2- イル) (エチル) (イミノ) - λ 6 -スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.90 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.62 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.98 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.80 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.49-3.56 (m, 2H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 554.00(MH)+
136	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 7 - (3 - (トリ フルオロメチル) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン-3-イル) - 3-メチル-6 - (トリフ ルオロメチル) - 3 H-イ ミダゾ [4 , 5 - c] ピリ ジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.95 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.69 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 555.05(MH)+
137	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 7 - (3 -フルオ ロフェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン-3 -イル) - 3-メチル-6	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.24 (s, 1H), 8.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.01-8.07 (m, 2H), 7.72-7.78 (m, 2H), 7.55-7.63 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.72 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS

【 0 6 1 9 】

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 3】

	- (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	(m/z) 505.00(MH)+
138	2 - (2 - (エチルチオ) - 7 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.14 (s, 1H), 8.59 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.17 (dd, J = 4.4, 0.7 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.24 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 1.38 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 393.00(MH)+
140	2 - (7 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルチオ) ピラゾ ロ [1 , 5 - a] ピリミジ ン - 3 - イル) - 3 - メチ ル - 6 - (トリフルオロメ チル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (d, J = 4.6 Hz, 2H), 8.56-8.59 (m, 2H), 8.26 (qd, J = 4.4, 2.3 Hz, 1H), 7.75 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.18 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 506.90(MH)+
141	2 - (2 - (エチルチオ) - 5 , 7 - ビス (トリフル オロメチル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.63 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.22 (s, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.27 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.42 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 515.05(MH)+
142	2 - (2 - (エチルスルホ ニル) - 5 , 7 - ビス (トリ フルオロメチル) ピラゾ ロ [1 , 5 - a] ピリミジ ン - 3 - イル) - 3 - メチ ル - 6 - (トリフルオロメ チル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.90 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.64 (s, 1H), 3.76-3.82 (m, 5H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 546.95(MH)+
143	2 - (エチルチオ) - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリ フルオロメチル) - 3 H- イミダゾ [4 , 5 - b] ピ リジン - 2 - イル) ピラゾ ロ [1 , 5 - a] ピリミジ ン - 7 (4 H) - オン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 12.40 (s, 1H), 8.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.56 (dd, J = 2.1, 0.6 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.16 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.32 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 395.00(M-H)+
144	2 - (7 - プロモ - 2 - (エ チルチオ) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H-イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.77 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z) 456.95(MH)+;

10

20

30

40

【 0 6 2 0】

化合物名は Chemdraw Professional 18.1 を使用して作成

【 0 6 2 1】

以下の化合物 (表 2) は、スキーム 1 ~ 2 3 又は実施例に記載されている類似の手順を使用して得ることができる。

【 0 6 2 2】

【表 2 - 1】

シリアル 番号	化合物名	シリアル 番号	化合物名
145	2 - (エチルスルホニル) - N - メチル - 3 - (7 - (トリフルオ ロメチル) - [1, 2, 4] トリ アゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン	164	6 - (1 - ブロモ - 2 - (エチル スルホニル) - 8 - メチルインド リジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピ リダジン
146	6 - (8 - (4 - クロロ - 3 - フ ルオロフェニル) - 2 - (エチル スルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリ フルオロメチル) - 7 H - イミダ ゾ [4, 5 - c] ピリダジン	165	6 - (8 - ブロモ - 2 - (エチル スルホニル) インドリジン - 3 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 7 - メチル - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン
147	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 3 - (トリ フルオロメチル) - 1 H - ピラゾ ール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオ ロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン	166	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - メトキシピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロ メチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン
148	2 - (エチルチオ) - N - メチル - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリ フルオロメチル) - 3 H - イミダ ゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピ リミジン - 7 - アミン	167	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (メチルチオ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフル オロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン
149	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - フルオロフェノキシ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミ ジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリ ジン	168	2 - (エチルスルホニル) - 3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオ ロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジ ン - 7 (4 H) - チオン
150	6 - (8 - (4 - クロロ - 3 - フ ルオロフェニル) - 2 - (エチル スルホニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチ ル) - 7 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン	169	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1, 1, 2, 2 - テトラ フルオロエトキシ) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフル オロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン
151	2 - (6 - (3, 5 - ジクロロフ ェニル) - 2 - (エチルスルホニ ル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリ ミジン - 3 - イル) - 6 - (トリ フルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピラジン	170	2 - (7 - エトキシ - 2 - (エチ ルスルホニル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) イミ ダゾ [1, 2 - a] ピラジン

【 0 6 2 3 】

10

20

30

40

50

【表 2-2】

152	4-(2-(エチルスルホニル)-3-(7-メチル-3-(トリフルオロメチル)-7H-イミダゾ[4, 5-c]ピリダジン-6-イル)インドリジン-8-イル)-2-フルオロベンゾニトリル	171	ジエチル((2-(エチルスルホニル)-3-(6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1, 2-a]ピラジン-2-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-7-イル)イミノ)-16-スルファノン
153	2-(8-(シクロプロピルメチル)-2-(エチルスルホニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	172	2-(エチルスルホニル)-N,N-ジメチル-3-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-8-アミン
154	2-(7-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	173	6-(2-(エチルスルホニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-7-メチル-3-(トリフルオロメチル)-7H-イミダゾ[4, 5-c]ピリダジン
155	2-(2-(エチルスルホニル)-7-(5-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	174	2-(7-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3, 5-ジメチル-6-(トリフルオロメチル)-3, 5-ジヒドロ-4H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン-4-オン
156	2-(2-(エチルスルホニル)-7-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	175	2-(2-(エチルスルホニル)-7-(3-(トリフルオロメチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3, 5-ジメチル-6-(トリフルオロメチル)-3, 5-ジヒドロ-4H-イミダゾ[4, 5-c]ピリジン-4-オン
157	2-(2-(エチルスルホニル)-7-(1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-イル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン	176	2-(7-(3-クロロ-5-フルオロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピラジン
158	2-(7-シクロプロピル-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-6-(トリフルオロメチル)	177	2-(7-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-(エチルスルホニル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン-3-イル)-7-(トリ

10

20

30

40

【0624】

【表 2 - 3】

	) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピラジン		フルオロメチル) イミダゾ [1, 2-c] ピリミジン	
159	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-c] ピリミジン	178	2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン - 5 (6 H) - オン	10
160	4 - (2 - (エチルスルホニル) - 3 - (7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 7 - イル) モルホリン	179	2 - (7 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン	
161	2 - (7 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) - 2 - (エチルスルホニル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン	180	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン - 5 (6 H) - オン	20
162	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン	181	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 7 - (3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-c] ピリミジン	30
163	2 - (2 - (エチルスルホニル) - 5, 7 - ビス (トリフルオロメチル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 3 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5-b] ピリジン	182	エチル (3 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5-c] ピリジン - 2 - イル) ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン - 2 - イル) (メチルイミノ) - 1, 6 - スルファノン	40

【0625】

化合物名は Chemdraw Professional 18.1 を使用して作成

【0626】

本明細書に記載するように、式 (I) の化合物は、重要な農作物を攻撃する多数の昆虫に関して発揮される殺虫活性を示す。以下の試験に記載するように、本発明の化合物をそれらの活性について評価した：

【0627】

生物学の実施例

【0628】

実施例A: *Helicoverpa armigera*

【0629】

必要量の試験化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のために90分間ボルテックスを維持し、次いで水で希釈して所望の試験濃度にする、食餌組み込み方法を使用した。バイオアッセイ容器において温度が約50℃に達したときに、溶液を半合成の食餌に組み込んだ。適切な混合のために食餌及び溶液を十分に攪拌し、次いで30分間冷却した。固化した食餌を等分に切断し、各ピースをバイオアッセイトレイの1つのセルに移した。バイオアッセイトレイのこれらのセルの各々に、単一の飢餓状態の3齢の幼虫を放ち、各トレイは蓋を覆った。バイオアッセイトレイを、25℃の温度及び70%の相対湿度の実験室条件下で維持した。死んだ幼虫、瀕死の幼虫、及び生きている幼虫の観察を幼虫を放ってから96時間後に記録した。死亡率は、死んだ幼虫及び瀕死の幼虫を合わせ、その結果を未処置の対照の1つと比較することによって計算した。化合物15 21 25 26 27 28 32 39 83 87 90 91 93 97 99 101 102 103 104 109 118 120 126、及び136は、300PPMで70%を超える死亡率の活性を示した。

10

【0630】

実施例B: *Spodoptera litura*

【0631】

必要な量の試験化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のために90分間ボルテックスを維持し、次いで水で希釈して所望の試験濃度にする、食餌取り込み方法を使用した。バイオアッセイ容器における温度が約50℃に達したときに、溶液を半合成の食餌に組み込んだ。適切な混合のために食餌及び溶液を十分に攪拌し、30分間冷却した。固化した食餌を等分に切断し、各ピースをバイオアッセイトレイの1つのセルに移した。単一の飢餓状態の3齢の幼虫をバイオアッセイトレイのこれらの各セルに放ち、トレイを蓋で覆った。バイオアッセイトレイを、25℃の温度及び70%の相対湿度の実験室条件下で維持した。死んだ幼虫、瀕死の幼虫、及び生きている幼虫の観察を、幼虫を放ってから96時間後に記録した。死亡率は、死んだ幼虫及び瀕死の幼虫を合わせ、その結果を未処理の対照の1つと比較することによって計算した。化合物15 21 25 26 37 63 83 87 90 93 101 103 118 126 129、及び134は、300PPMで70%を超える死亡率の活性を示した。

20

30

【0632】

実施例C: *Plutella xylostella*

【0633】

必要な量の化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のためにジルコニアビーズを使用して2000rpmで90分間ボルテックス上で維持し、次いで0.01% Triton-X溶液で希釈して所望の試験濃度にする、葉浸漬方法を試験に使用した。キャベツの葉を溶液に10秒間浸漬し、日陰で20分間乾燥し、次いでバイオアッセイトレイに移した。1秒齢の幼虫を各バイオアッセイトレイのセルに放ち、トレイを蓋で覆った。バイオアッセイトレイを25℃の温度及び70%の相対湿度の実験室条件下で維持した。死んだ幼虫、瀕死の幼虫、及び生きている幼虫の観察を、幼虫を放ってから72時間後に記録した。死亡率は、死んだ幼虫及び瀕死の幼虫を合わせ、その結果を未処理の対照の1つと比較することによって計算した。化合物5 6 9 12 15 18 20 21 22 25 26 27 28 29 30 32 34 35 37 39 40 43 46 48 50 62 63 66 67 69 70 71 74 80 81 83 87 88 90 91 93 95 96 99 100 101 103 104 109 114 115 118 119 129 130 131 133 135 136、及び137は、300PPMで70%を超える死亡率の活動を示した。

40

【0634】

実施例D: *Bemisia tabaci*

必要な量の試験化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のためにジルコ

50

ニアビーズを使用して2000rpmで90分間ボルテックス上で維持し、次いで0.01% Triton-X 溶液で希釈して所望の試験濃度にする、葉浸漬方法を試験に使用した。綿の葉を溶液に10秒間浸し、日陰で20分間乾燥し、次いで葉を水に浸漬しながらガラスユニット中で維持した。既知の数の新たに用いた成虫を放ち、25℃の温度及び70%の相対湿度で植物成長チャンバー中で維持した。死んだ成虫、瀕死の成虫、及び生きている成虫の観察を、放出してから72時間後に記録した。死亡率は、死んだ成虫及び瀕死の成虫を合わせ、その結果を未処理の対照の1つと比較することによって計算した。化合物22及び119は、300PPMで70%を超える死亡率の活性を示した。

【0635】

実施例E: *Myzus persicae*

10

【0636】

必要な量の試験化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のためにジルコニアビーズを使用して2000rpmで90分間ボルテックス上で維持し、次いで0.01% Triton-X 溶液で希釈して所望の試験濃度にする、葉浸漬方法を試験に使用した。トウガラシの葉を溶液に10秒間浸し、日陰で20分間乾燥し、次いで葉を水に浸漬しながらガラスユニット中で維持した。既知の数の3齢のニフをガラスユニットに放ち、25℃の温度及び70%の相対湿度で植物成長チャンバー中で維持した。死んだニフ、瀕死のニフ、及び生きているニフの観察を、放出してから72時間後に記録した。死亡率、死んだニフ及び瀕死のニフを合わせ、その結果を未処理の対照の1つと比較することによって計算した。化合物9 14 16 22 23 50 71 104、及び131は、300PPMで70%を超える死亡率を示す有効性を示した。

20

【0637】

実施例F: *Nilaparvata lugens*

【0638】

必要な量の試験化合物を秤量し、界面活性剤溶液に溶解し、適切な混合のためにジルコニアビーズを使用して2000rpmで90分間ボルテックス上で維持し、次いで0.01% Triton-X 溶液で希釈して所望の試験濃度にする、苗浸漬方法を試験に使用した。イネの苗を溶液に10秒間浸し、日陰で20分間乾燥し、次いで根を水に浸漬しながらガラス管中で維持した。既知の数の3齢のニフを試験管に放ち、試験管を25℃の温度及び75%の相対湿度で植物成長チャンバー中で維持した。死んだニフ、瀕死のニフ、及び生きているニフの観察を、放出してから72時間後に記録した。死亡率は、死んだニフ及び瀕死のニフを合わせ、その結果を未処理の対照の1つと比較することによって計算した。化合物1422及び63は、300PPMで70%を超える死亡率の活性を示した。

30

【0639】

特定の好ましい実施形態を参照して本発明を記載してきたが、他の実施形態は、本明細書を考慮することによって当業者に明らかになるであろう。本発明の範囲から逸脱することなく、材料及び方法の両方に対する多くの修正を行うことができることが当業者に明らかであろう。

40

フロントページの続き

(51)国際特許分類

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

F I

A 0 1 N	43/90	1 0 2	
C 0 7 D	471/04	1 0 7 Z	
C 0 7 D	471/04		C S P
C 0 7 D	519/00	3 1 1	
C 0 7 D	487/04	1 4 4	
C 0 7 D	471/04	1 0 8 Q	
C 0 7 D	487/04	1 4 2	
C 0 7 D	471/04	1 0 8 Z	

インド共和国 2 4 5 3 0 4 ウッタル プラデーシュ, ガーズィヤーバード, ポストーファリッド
ナガー, ビレッジーパッティ

(72)発明者

ジーナ ラリト クマール

インド共和国 7 5 6 0 0 1 オリッサ, バーレーシュワル, ピーエス サハデバンサ, エーティー
ピーオーソバランプール

(72)発明者

ヴァーマ ジーヴァン シン

インド共和国 4 6 6 1 1 6 マディヤ プラデーシュ, セホール, バジラン コロニー アシュタ,
カンノド ロード

(72)発明者

サクセナ ロヒット

インド共和国 2 2 6 0 2 4 ウッタル プラデーシュ, ラクナウ, ヴィカース ナガー, セクター
ー 4, 4 / 7 3 1

(72)発明者

マンダール スニル クマール

インド共和国 5 6 0 1 0 9 カルナータカ, バンガロール, マラサンドラ, オフ カナーカブラ
ロード, シュライラン スラブヒ アパートメンツ, フラット ナンバー エヌアールー 6 0 4

(72)発明者

ガーデ ヴィシュワナート

インド共和国 4 0 0 6 0 1 マハーラーシュトラ, テイン ウェスト, ナッシク ロード, マジワ
ダ, ラスタムジー アツツィアーノ, ジェー ウィング, フラット ナンバー 2 5 0 4

(72)発明者

シー キラン ケー

インド共和国 5 7 7 2 1 5 カルナータカ, ダバンゲレ, チャンナギリ タルク, ゴッペナハリ,
ドア ナンバー 1 5 9, エス オー チャンドラッパ ケー エス

(72)発明者

サラグール ラヴィクマール スリヤナラヤナ

インド共和国 5 6 0 0 9 8 カルナータカ, バンガロール, ラジャジェシュワリ ナガー, ビーイ
ーエムエル レイアウト, ファースト フェーズ, 5 ス ステージ, サード メイン, デカン アルケ
ードーセカンド, 5 ス フロア, ナンバー 5 0 3

(72)発明者

クラウゼナー アレクサンダー ジー. エム.

ドイツ連邦共和国 5 0 2 5 9 プルハイム, シフゲスウェグ 1 8

審査官 堀 洋樹

(56)参考文献

特表 2 0 1 8 - 5 1 5 4 4 0 (J P, A)

国際公開第 2 0 1 7 / 1 2 5 3 4 0 (W O, A 1)

特表 2 0 0 9 - 5 1 4 8 2 3 (J P, A)

特表 2 0 1 9 - 5 3 5 7 5 0 (J P, A)

特表 2 0 1 9 - 5 2 7 2 2 1 (J P, A)

特表 2 0 1 7 - 5 1 4 8 3 3 (J P, A)

国際公開第 2 0 1 8 / 0 5 0 8 2 5 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 5 / 0 7 6 8 0 0 (W O, A 1)

C.G.WERMUTH編, 『最新 創薬化学 上巻』, 株式会社テクノミック, 1998年08月15日, 2
35-271頁, 13章 等価置換に基づく分子の変換

Journal of Organic Chemistry, 2000年, 11(20), 3341-3345

Journal of Combinatorial Chemistry, 2009年, 11(6), 1023-1029

Sulfur Letters, 1993年, 16(4), 165-170

DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN RN 1609639-14-6, 2014年06月05日

, 3-[5-(4-fluorophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]-5,7-dimethyl-2-(methylthio)-Pyrazolo[1,5-a]pyrimidine

DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN RN 1609639-13-5, 2014年06月05日, 5,7-dimethyl-3-[5-(4-methylphenyl)-1H-pyrazol-3-yl]-2-(methylthio)-Pyrazolo[1,5-a]pyrimidine

DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN RN 1598415-59-8, 2014年05月06日, 3-[5-(4-chlorophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]-5,7-dimethyl-2-(methylthio)-Pyrazolo[1,5-a]pyrimidine

DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN RN 1031619-60-9, 2008年06月29日, 3-[3-(1,3-benzodioxol-5-yl)-1,2,4-oxadiazol-5-yl]-5-methyl-2-(methylthio)-Pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7(4H)-one

DATABASE REGISTRY [ONLINE] Retrieved from STN RN 946212-74-4, 2007年09月07日, 5-(chloromethyl)-3-[3-(3,4-dimethoxyphenyl)-1,2,4-oxadiazol-5-yl]-2-(methylthio)-Pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7(4H)-one

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

C 0 7 D

A 0 1 P

A 0 1 N

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