

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2022-523434

(P2022-523434A)

(43)公表日 令和4年4月22日(2022.4.22)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 401/04 (2006.01)	C 0 7 D 401/04	2 B 0 5 1
C 0 7 D 401/14 (2006.01)	C 0 7 D 401/14	C S P 2 B 1 2 1
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	G 4 C 0 6 3
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 N 47/02	4 H 0 1 1
A 0 1 N 53/14 (2006.01)	A 0 1 N 53/14	

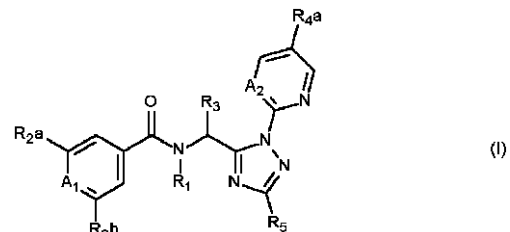
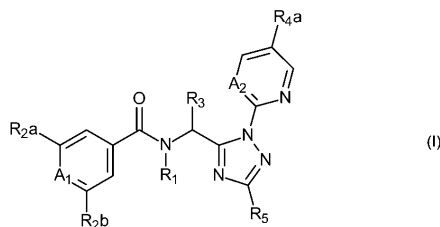
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全195頁) 最終頁に続く

(21)出願番号	特願2021-553291(P2021-553291)	(71)出願人	520222106 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
(86)(22)出願日	令和2年3月6日(2020.3.6)		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(85)翻訳文提出日	令和3年11月1日(2021.11.1)	(74)代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(86)国際出願番号	PCT/EP2020/055989	(74)代理人	100103610 弁理士 吉 田 和彦
(87)国際公開番号	WO2020/182649	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(87)国際公開日	令和2年9月17日(2020.9.17)	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(31)優先権主張番号	19161558.2	(74)代理人	100123777 弁理士 市川 さつき
(32)優先日	平成31年3月8日(2019.3.8)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA, .RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 殺有害生物的に活性なアゾール - アミド化合物

(57)【要約】

式(I)



(式中、置換基は、請求項1に定義されるとおりである)

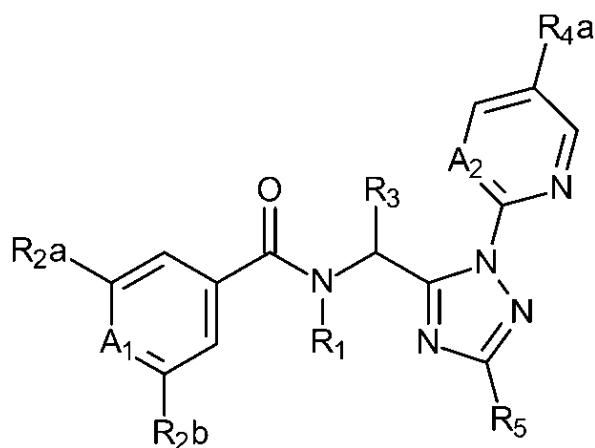
の化合物並びにそれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN - オキシドは、殺虫剤として使用され得る。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



I

10

(式中、

20

A₁は、N又はC - R_{2c}であり；R_{2c}は、H、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、又はC₁~C₃ハロアルコキシであり；R_{2a}は、C₃~C₆シクロアルキル；C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1~3個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキル；C₃~C₆シクロアルキルC₁~C₄アルキル；C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1~5個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキルC₁~C₄アルキル；C₁~C₅シアノアルキル、C₃~C₆シクロアルコキシ、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、又はC₁~C₄ハロアルキルスルフィニルであり；

30

R_{2b}は、H、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃ハロアルキルチオ、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、SF₅、又はCNであり；A₂は、CR_{4b}又はNであり；R_{4b}は、水素、又はハロゲンであり；R_{4a}は、シアノ、又はC₁~C₃ハロアルコキシであり；R₁は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆シアノアルキル、アミノカルボニルC₁~C₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ニトロアルキル、トリメチルシランC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₃~C₄シクロアルキルC₁~C₂アルキル -、C₃~C₄シクロアルキルC₁~C₂アルキル - (ここで、前記C₃~C₄シクロアルキル基は、1若しくは2個のハロ原子で置換されている)、オキセタン - 3 - イル - CH₂ -、ベンジル又はハロ若しくはC₁~C₆ハロアルキルで置換されたベンジルであり；

40

R₃は、C₁~C₃アルキル又はC₁~C₃ハロアルキルであり；R₅は、ハロゲン、アミノ、(C₁~C₃アルキル)アミノ、ヒドロキシ、シアノ、C₃~C₄ハロシクロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₁~C₄ハロアルキルスルファニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、C₁~C₄アルキルスルファニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル

50

、(C₁~C₃アルキル)スルホニルアミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニル(C₁~C₃アルキル)アミノ、(C₁~C₃アルキル)NH C(O)、(C₁~C₃アルキル)₂NC(O)、(C₃~C₆シクロアルキル)NH C(O)、(C₃~C₆シクロアルキル)(C₁~C₃アルキル)NC(O)、(C₁~C₃アルキル)C(O)(C₁~C₃アルキル)N、(C₁~C₃アルキル)C(O)NH、ジフェニルメタンイミン、又はC₁~C₃ハロアルコキシである)；又は式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシド。

【請求項2】

R₃は、メチルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

A₁は、Nである、請求項1又は請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

A₁はC-R_{2c}であり、ここで、R_{2c}は、水素又はハロゲン；好ましくは水素である、請求項1又は請求項2に記載の化合物。

【請求項5】

R₁は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又はHCH CCH₂-である、請求項1~4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R_{2a}は、C₃~C₆シクロアルキル；C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1~3個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキル；ハロゲンから独立して選択される1~5個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキルC₁~C₄アルキル；C₁~C₅シアノアルキル、C₃~C₆シクロアルコキシ、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル又はC₁~C₄ハロアルキルスルフィニルである、請求項1~5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R_{2b}は、ハロゲン、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃ハロアルキルチオ、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、又はCNである、請求項1~6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R_{4a}は、シアノ、又はC₁~C₃フルオロアルコキシである、請求項1~7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

A₂は、Nである、請求項1~8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

A₂は、CHである、請求項1~8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

R₅は、J-1~J-11から選択される、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

10

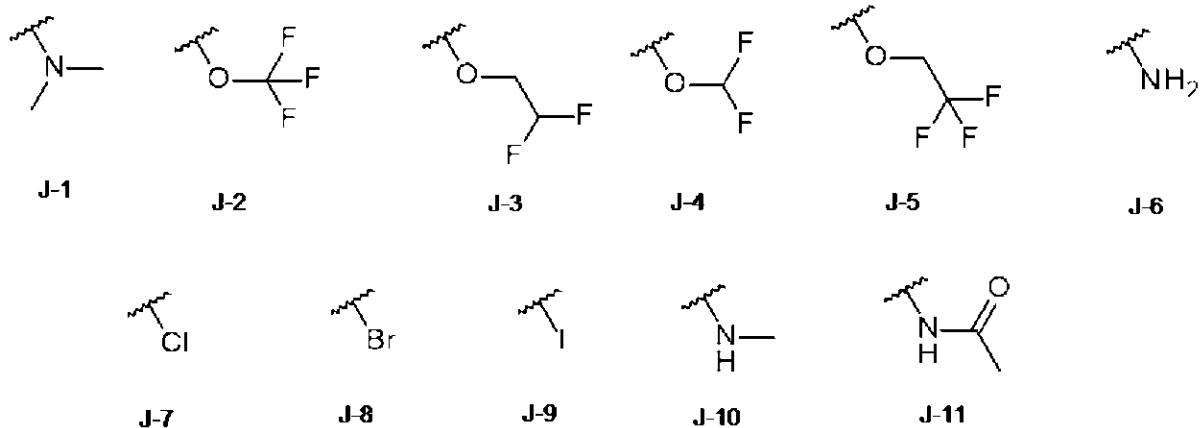
20

30

40

50

【化 2】



10

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、1 種以上の助剤及び希釈剤並びに任意に 1 種以上の他の有効成分を含む組成物。

【請求項 1 3】

(i) 昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物を適用するステップを含む方法、又は

20

(i i) 昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃からの植物繁殖材料の保護の方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物で処理するステップを含む方法、又は

(i i i) 請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物を有効量で投与するステップを含む、必要としている動物の体内又は体表において寄生虫を防除する方法。

【請求項 1 4】

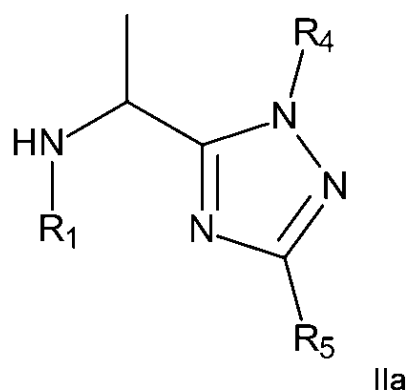
請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料。

30

【請求項 1 5】

式 I I a の化合物

【化 3】



40

(式中、 R_1 は、請求項 1 又は 5 のいずれかに定義されるとおりであり、 R_5 は、請求項 1 又は 1 1 のいずれかに定義されるとおりであり、 R_4 は、5 位においてシアノ又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシで置換された 2 - ピリジル、及び 5 位においてシアノ又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシで置換された 2 - ピリミジルからのものである) 。

50

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、殺有害生物的に有効である、特に殺虫的に有効なアゾール-アミド化合物、その調製プロセス、これらの化合物を含む組成物及び節足動物、特に昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表的なものを含む動物有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

国際公開第2017192385号は、動物 (哺乳類及び非哺乳類動物など) において外寄生生物を防除するために用いられる特定のヘテロアリール-1, 2, 4-トリアゾール及びヘテロアリール-テトラゾール化合物を記載している。

【0003】

新規殺有害生物性活性アゾールアジン化合物がここに見出されている。

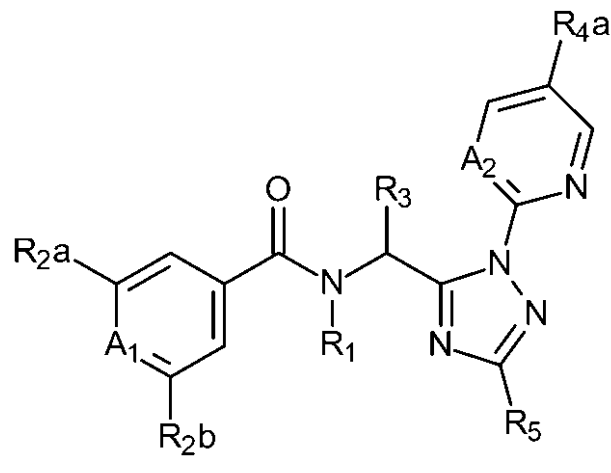
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

従って、本発明は、第1の態様において、式Iの化合物

【化1】



(式中、

A₁は、N又はC-R_{2c}であり；

R_{2c}は、H、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、又はC₁~C₃ハロアルコキシであり；

R_{2a}は、C₃~C₆シクロアルキル；C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1~3個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキル；C₃~C₆シクロアルキルC₁~C₄アルキル；C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1~5個の置換基で置換されているC₃~C₆シクロアルキルC₁~C₄アルキル；C₁~C₅シアノアルキル、C₃~C₆シクロアルコキシ、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、又はC₁~C₄ハロアルキルスルフィニルであり；

R_{2b}は、H、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃ハロアルキルチオ、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、SF₅、又はCNであり；

A₂は、CR_{4b}又はNであり；

R_{4b}は、水素、又はハロゲンであり；

10

20

30

40

50

R_{4a}は、シアノ、又はC₁~C₃ハロアルコキシであり；

R₁は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆シアノアルキル、アミノカルボニルC₁~C₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ニトロアルキル、トリメチルシランC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₃~C₄シクロアルキルC₁~C₂アルキル -、C₃~C₄シクロアルキルC₁~C₂アルキル - (ここで、C₃~C₄シクロアルキル基は、1若しくは2個のハロ原子で置換されている)、オキセタン-3-イル-CH₂-、ベンジル又はハロ若しくはC₁~C₆ハロアルキルで置換されたベンジルであり；

R₃は、C₁~C₃アルキル又はC₁~C₃ハロアルキルであり；

R₅は、ハロゲン、アミノ、(C₁~C₃アルキル)アミノ、ヒドロキシ、シアノ、C₃~C₄ハロシクロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₁~C₄ハロアルキルスルファニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、C₁~C₄アルキルスルファニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、(C₁~C₃アルキル)スルホニルアミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニル(C₁~C₃アルキル)アミノ、(C₁~C₃アルキル)NHCO、(C₁~C₃アルキル)₂NC(O)、(C₃~C₆シクロアルキル)NHCO、(C₃~C₆シクロアルキル)(C₁~C₃アルキル)NC(O)、(C₁~C₃アルキル)C(O)(C₁~C₃アルキル)N、(C₁~C₃アルキル)C(O)NH、ジフェニルメタンイミン、又はC₁~C₃ハロアルコキシ；又は、式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシドに関する。

10

20

【発明を実施するための形態】

【0005】

少なくとも1つの塩基性中心(basic centre)を有する式Iの化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換されるC₁~C₄アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換されるC₁~C₄アルカン - 又はアリーールスルホン酸、例えばメタン - 又はp-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩又はマグネシウム塩、又はアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ -、ジ - 又はトリ - 低級アルキルアミン、例えばエチル -、ジエチル -、トリエチル - 又はジメチルプロピルアミン、又はモノ -、ジ - 又はトリヒドロキシ - 低級アルキルアミン、例えばモノ -、ジ - 又はトリエタノールアミンを形成することができる。

30

40

【0006】

各事例において、本発明に係る式Iの化合物は、遊離形態、N-オキシドとして酸化型又は塩形態であり、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態である。

【0007】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”, A. Albinini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0008】

本発明に係る式Iの化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

【0009】

50

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1～n個の炭素原子を有する飽和直鎖又は分岐炭化水素ラジカルを指し、例えばラジカルであるメチル、エチル、n-プロピル、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、n-ヘキシル、n-ペンチル、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-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピルのいずれか1つである。

10

【0010】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し(上記のとおり)、ここで、これらのラジカル中の水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素によって置換され得、すなわち例えばクロロメチル、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、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-プロモエチル、2-ヨードエチル、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、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、2,3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2,3-ジクロロプロピル、2-プロモプロピル、3-プロモプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリクロロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(プロモメチル)-2-プロモエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-プロモブチル又はノナフルオロブチルのいずれか1つである。「 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル」という用語は、1,2,3,4又は5個のフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ アルキルラジカルを指し、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチル、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、1,1,2,2-テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルのいずれか1つであろう。

20

30

【0011】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、1～n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し、すなわち例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、n-ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1,1-ジメチルエトキシラジカルのいずれか1つである。本明細書において用いられる場合、「ハロ $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、アルキルラジカル上の1個以上の水素原子が、同一の又は異なるハロ原子によって置換された $C_1 \sim C_n$ アルコキシラジカル(例としては、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、3-フルオロプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシが挙げられる)を指す。

40

【0012】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルキル」という用語は、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルキルラジカル(上記のとおり)を指し、ここで、これらのラジカル中の水素原子の1個がシアノ基によって置換されており、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、2-シアノプロピル、3-シアノプロピル、1-(シアノメチル)-2-エチル、1-(メチル)-2-シアノエチル、4-シアノブ

50

チル等である。

【0013】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの3～n員シクロアルキル基を指す。

【0014】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキルラジカルを有する3又はn員シクロアルキル基を指し、このアルキルラジカルは、分子の残部に結合している。例えば、 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-基は置換されており、置換基は、シクロアルキル基又はアルキルラジカルに位置し得る。

10

【0015】

本明細書において用いられる場合、「アミノカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の1個は、 $NH_2C(O)$ 基によって置換されている。

【0016】

本明細書において用いられる場合、「ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、ラジカル中の水素原子の1個が $HO C(O)$ -基によって置換されているアルキルラジカルを指す。

【0017】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ニトロアルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の1個は、 NO_2 基によって置換されている。

20

【0018】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルファニル」又は「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ アルキル部分を指す。同様に、本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル部分を指す。

【0019】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルフィニル」という用語は、 $S(=O)$ 基の硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ アルキル部分を指す。同様に、本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルフィニル」という用語は、 $S(=O)$ 基の硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル部分を指す。

30

【0020】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルホニル」という用語は、 $S(=O)_2$ 基の硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ アルキル部分を指す。同様に、本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルホニル」という用語は、 $S(=O)_2$ 基の硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル部分を指す。

【0021】

本明細書において用いられる場合、「トリメチルシラン $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の1個は、 $(CH_3)_3Si$ -基によって置換されている。

40

【0022】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルケニル」という用語は、2～n個の炭素原子及び1又は2つの二重結合を有する直鎖又は分岐アルケニル鎖を指し、例えばエテニル、プロブ-1-エニル、ブタ-2-エニルである。

【0023】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルケニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロ原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルケニル部分を

50

指す。

【0024】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルキニル」という用語は、2～n個の炭素原子及び1つの三重結合を有する直鎖又は分岐アルキニル鎖を指し、例えばエチニル、プロブ-2-イニル、ブタ-3-イニルである。

【0025】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルキニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロ原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルキニル部分を指す。

【0026】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルなどの他の意味と組み合わせられたハロゲンにも適用される。

【0027】

R_2 及び R_4 に係るピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジン基（無置換又は置換されたもの）は各々、それぞれの環における炭素原子を介して化合物の残部に結合している。

【0028】

本明細書において用いられる場合、「防除する」という用語は、植物又は植物由来産物に対する被害が低減するように有害生物の数を低減させ、有害生物を駆除し、且つ/又はさらなる有害生物による被害を予防することを指す。

【0029】

本明細書において用いられる場合、例えばJ-1、K-1及びL-1における波線は、化合物の残部に対する結合点/接続点を表す。

【0030】

本明細書において用いられる場合、「有害生物」という用語は、農業、園芸、林業、植物由来産物（果実、穀粒及びひき材など）の保管において見られる昆虫、ダニ類、線虫及び軟体動物；並びに人工構造物の被害に関連する有害生物を指す。有害生物という用語は、有害生物のライフサイクルにおけるすべてのステージを包含する。

【0031】

本明細書において用いられる場合、「有効量」という用語は、単一回又は複数回の適用で所望の効果がもたらされる化合物又はその塩の量を指す。

【0032】

有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者によって容易に判定される。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、適用される植物の種類又は植物に由来する産物の種類；防除される有害生物及びそのライフサイクル；適用される特定の化合物；適用の種類；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が考慮される。

【0033】

当業者が理解するであろうとおり、式Iの化合物は、以下の構造中においてアスタリスクで示すステレオジェン中心を含む。

10

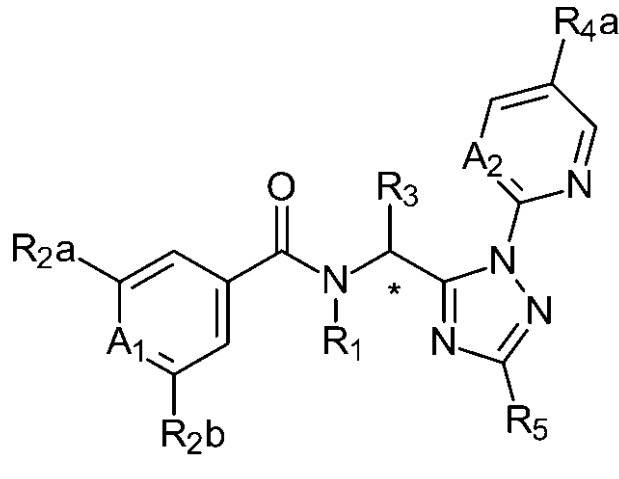
20

30

40

50

【化 2】



10

式中、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 及び A_2 は、第1の態様において定義されているとおりである。

【0034】

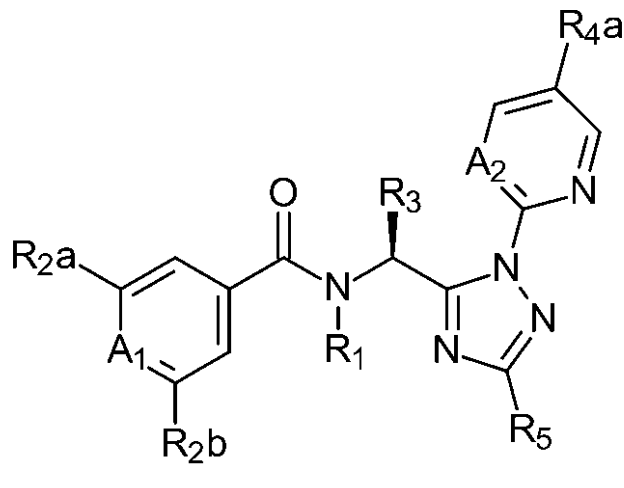
本発明は、ラセミ化合物及び個々の鏡像異性体の両方を企図する。好ましい立体化学を有する化合物を以下に示す。

20

【0035】

特に好ましい本発明の化合物は、式 I' a :

【化 3】



30

(式中、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 及び A_2 は、第1の態様において定義されているとおりである)

の化合物並びに式 (I' a) の化合物の立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及び N - オキシド、並びに農芸化学的に許容可能な塩である。

40

【0036】

本明細書において用いられる場合、「任意に置換されている」という用語は、言及されている基が無置換であるか、又は、指定の置換基によって置換されていることを意味し、例えば、「 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルは1又は2個のハロ原子で任意に置換されている」とは、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、1個のハロ原子で置換された $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、及び、2個のハロ原子で置換された $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを意味する。

【0037】

本発明に係る実施形態は以下のとおり提供される。

【0038】

50

本発明の各態様の一実施形態において、 A_1 は、

A. Nであり；又は

B. C - R_{2c} であり、ここで、 R_{2c} は、水素又はハロゲン；好ましくは水素である。

【0039】

本発明の各態様の一実施形態において、 A_2 は、

A. Nであり；又は

B. C - R_{4b} であり、ここで、 R_{4b} は、水素又はハロゲン；好ましくは水素である。

【0040】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_{2a} は、

A. $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル； $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1～3個の置換基で置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル；ハロゲンから独立して選択される1～5個の置換基で置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルであり；又は

B. $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル； $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、シアノ、及びハロゲンから独立して選択される1～3個の置換基で置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル；ハロゲンから独立して選択される1～5個の置換基で置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル $C_1 \sim C_2$ アルキル； $C_1 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルフィニルであり；又は

C. シクロプロピル；メチル、トリフルオロメチル、シアノ、フルオロ及びクロロから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているシクロプロピル；1～5個のフルオロ置換基で置換されているシクロプロピルメチル； $C_1 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロプロボキシ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルである。

【0041】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_{2b} は、

A. ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、又はCNであり；又は

B. ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり；又は

C. $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである。

【0042】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_{4a} は、

A. シアノ、又は $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシであり；又は

B. シアノ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、又は2, 2 - ジフルオロエトキシである。

【0043】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_1 は、

A. 水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又はHCCH₂-であり；又は

B. 水素、メチル、又はシクロプロピルメチルであり；又は

C. 水素であり；又は

D. メチルであり；又は

E. シクロプロピルメチルである。

【0044】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_3 は、

A. $C_1 \sim C_3$ アルキル又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；又は

B. メチルである。

【0045】

10

20

30

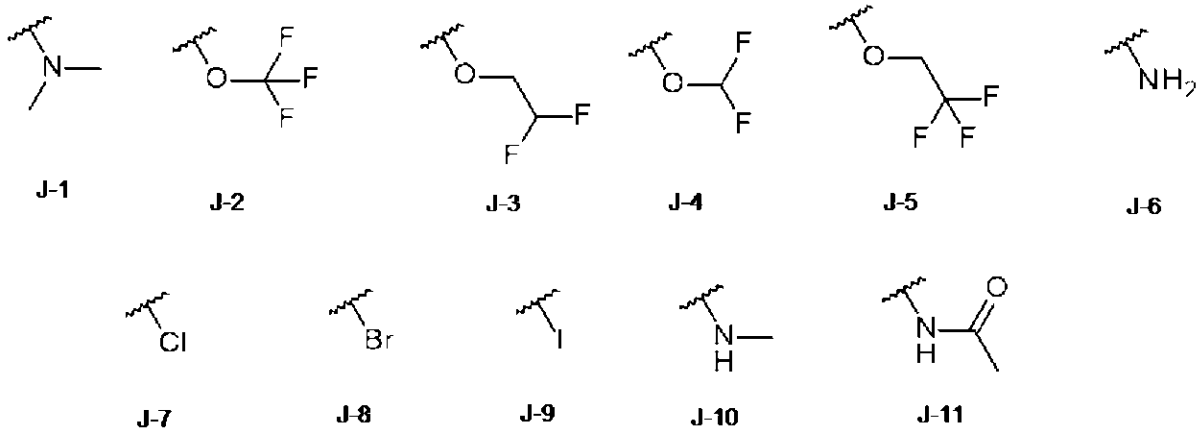
40

50

本発明の各態様の一実施形態において、R₅は、

A. J-1 ~ J-11

【化4】



10

から選択され、

B. J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、及びJ-9から選択され；又は

C. J-2又はJ-8である。

【0046】

本発明は、従って、上記に定義されている置換基R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、R₅、及びA₁及びA₂をすべての組み合わせ/それぞれの順列で有する式Iの化合物を利用可能とする。従って、例えば、A₁が第1の態様(すなわち、A₁は、N又はC-R_{2c}であり、ここで、R_{2c}は、H、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、又はC₁~C₃ハロアルコキシである)のものであり；A₂が実施形態A(すなわち、A₂はNである)であり；R₁が実施形態B(すなわち、水素、メチル、シクロプロピルメチル)であり；R_{2a}が実施形態C(すなわち、シクロプロピル；メチル、トリフルオロメチル、シアノ、フルオロ及びクロロから独立して選択される1~3個の置換基で置換されているシクロプロピル；1~5個のフルオロ置換基で置換されているシクロプロピルメチル；C₁~C₃シアノアルキル、C₃~C₆シクロプロポキシ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニル)であり；R_{2b}が実施形態B(すなわち、ハロゲン、C₁~C₃ハロアルキル、又はC₁~C₃ハロアルコキシ)であり；R₃が実施形態B(すなわち、メチル)であり；R_{4a}が実施形態B(すなわち、シアノ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、又は2,2-ジフルオロエトキシ)であり；R₅が実施形態A(すなわち、J-1~J-11から選択される)である式Iの化合物が利用可能とされている。

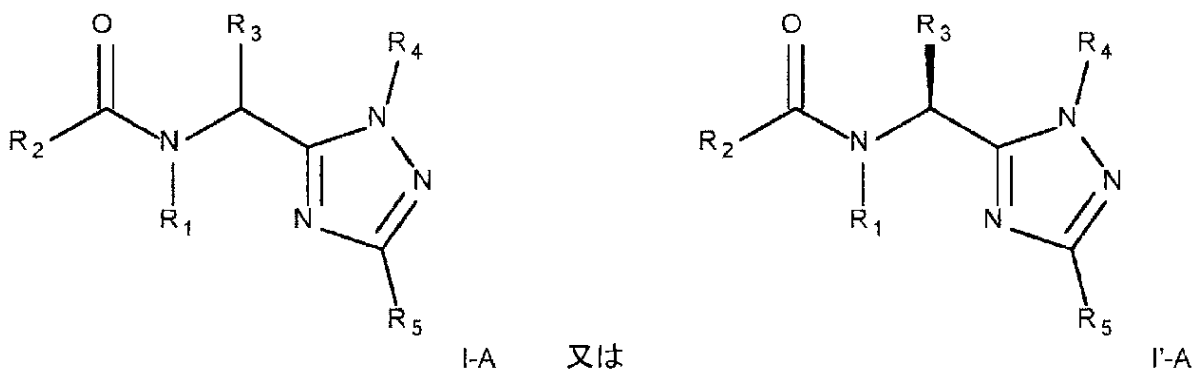
20

30

【0047】

一実施形態において、式Iの化合物は、

【化5】



40

(式中、R₁、R₃及びR₅は、第1の態様において定義されているとおりであり、R₂

50

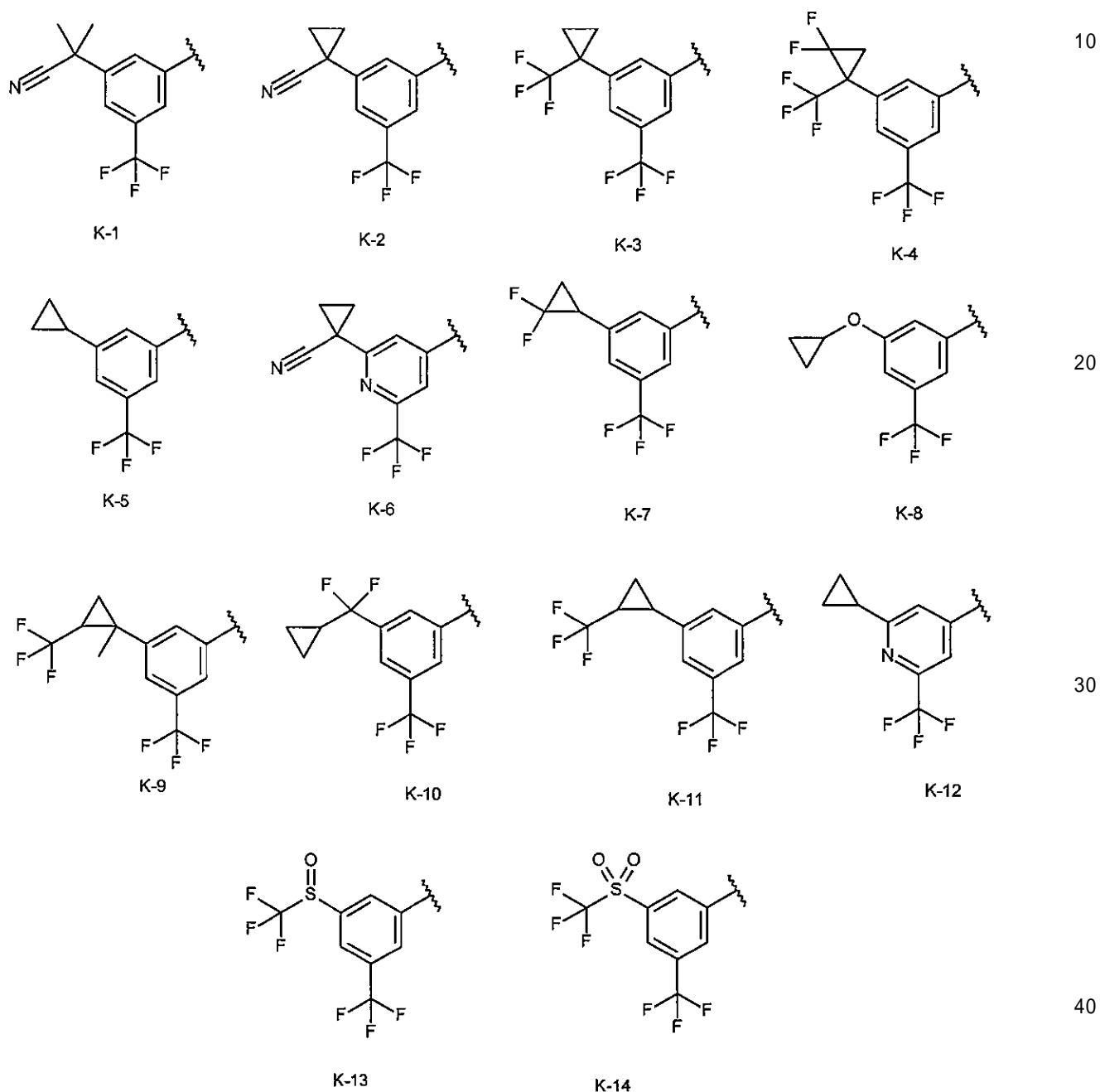
は、第 1 の態様において定義されている A_1 を含有する環式基並びに置換基 R_{2a} 及び R_{2b} であり、 R_4 は、 A_2 を含有する別の環式基及び第 1 の態様において定義されている置換基 R_{4a} である) として表され得る。

【 0 0 4 8 】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_2 (A_1 を含有する環式基及び置換基 R_{2a} 及び R_{2b}) は、

A . K - 1 ~ K - 1 4

【 化 6 】



から選択され、

B . K - 1、K - 2、K - 3、K - 5、K - 6、K - 10、K - 11、K - 12、及び K - 14 から選択され；又は

C . K - 1、K - 2、K - 5、K - 10、K - 11、及び K - 14 から選択され；又は

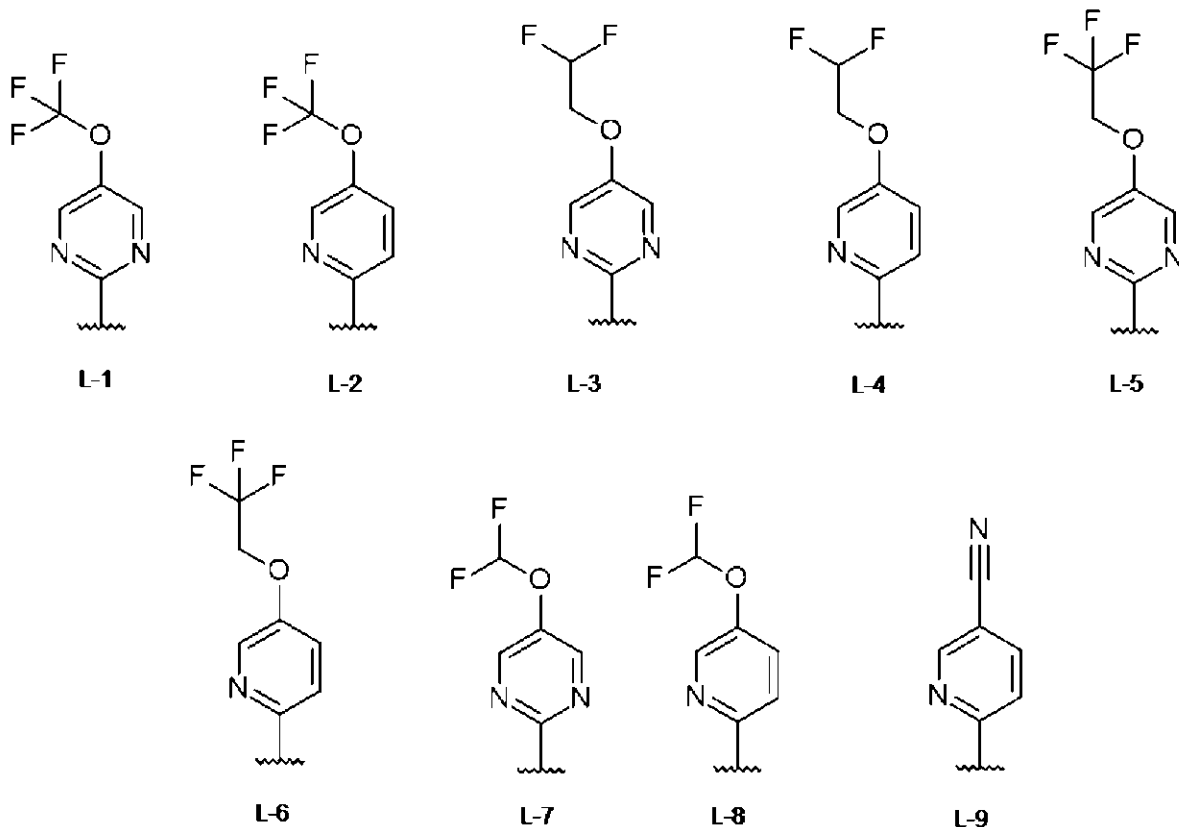
D . K - 5、K - 10、及び K - 14 から選択される。

【 0 0 4 9 】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_4 (A_2 を含有する環式基及び置換基 R_{4a}) は、

A. L - 1 ~ L - 9

【化7】



10

20

から選択され、

B. L - 1、L - 2、L - 7、L - 8、及びL - 9から選択され；又は

C. L - 1又はL - 9から選択される。

30

【0050】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又は HCH_2CCH_2- を有し； R_2 として、K - 1 ~ K - 14の1つを有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1 ~ L - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

【0051】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、K - 1 ~ K - 14の1つを有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1 ~ L - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

40

【0052】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素を有し； R_2 として、K - 1 ~ K - 14の1つを有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1 ~ L - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

【0053】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、K - 1、K - 2、K - 3、K - 5、K - 6、K - 10、K - 11、K - 12、及びK - 14の1つを有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1 ~ L - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

50

【0054】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、1つのK - 1、K - 2、K - 5、K - 10、K - 11、及びK - 14を有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1 ~ L - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

【0055】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、1つのK - 1、K - 2、K - 5、K - 10、K - 11、及びK - 14を有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1、L - 2、L - 7、L - 8、及びL - 9の1つを有し；及び R_5 として、J - 1 ~ J - 11の1つを有する。

10

【0056】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、1つのK - 1、K - 2、K - 5、K - 10、K - 11、及びK - 14を有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1、L - 2、L - 7、L - 8、及びL - 9の1つを有し；及び R_5 として、1つのJ - 2、J - 3、J - 4、J - 5、J - 7、J - 8、及びJ - 9を有する。

【0057】

本発明の各態様の一実施形態において、式Iの化合物は、 R_1 として、水素、メチル、又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として、1つのK - 5、K - 10、及びK - 14を有し； R_3 として、メチルを有し； R_4 として、L - 1又はL - 9の1つを有し；及び R_5 として、1つのJ - 2又はJ - 8を有する。

20

【0058】

第2の態様では、本発明は、第1の態様において定義されている式Iの化合物、1種以上の助剤及び希釈剤並びに任意に1種以上の他の有効成分を含む組成物を利用可能にする。

【0059】

第3の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法を利用可能にし、これは、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、第1の態様において定義されている化合物又は第2の態様において定義されている組成物を適用するステップを含む。

30

【0060】

第4の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃からの植物繁殖材料の保護の方法を利用可能にし、これは、繁殖材料又は繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、第1の態様において定義されている式Iの化合物又は第2の態様において定義されている組成物で処理するステップを含む。

【0061】

第5の態様では、本発明は、第1の態様において定義されている式Iの化合物又は第2の態様において定義されている組成物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料を利用可能にする。

40

【0062】

さらなる態様において、本発明は、寄生生物の防除を、それを必要としている動物内又は上で行う方法であって、有効量の、第1の態様において定義されている式Iの化合物を投与するステップを含む方法を提供する。本発明は、外寄生生物の防除を、それを必要としている動物上で行う方法であって、有効量の、第1の態様の化合物を投与するステップを含む方法をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び/又は処置する方法であって、それを必要としている動物に、有効量の、第1の態様において定義されている式Iの化合物を投与するステップを含む方法をさらに提供する。

【0063】

式Iの化合物は、公知の方法に従うことにより、当業者によって調製可能である。より具

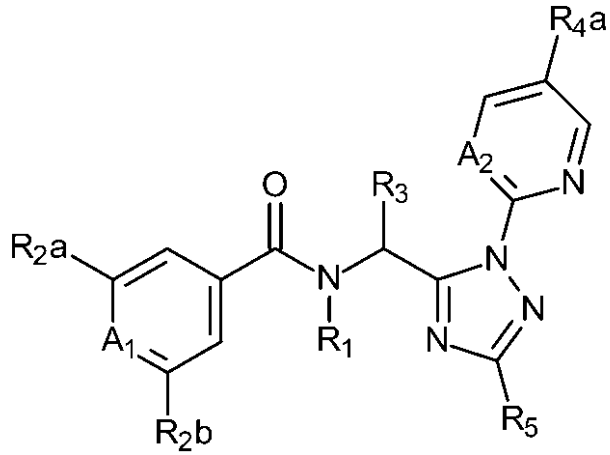
50

体的には、式 I 及び I' a の化合物及び中間体は、従って、スキーム及び実施例において以下に記載のとおり調製可能である。特定のステレオジェン中心は、簡潔さのために不特定のままとされており、決してスキームによる教示を限定することを意図されていない。

【 0 0 6 4 】

式 I の化合物は

【 化 8 】



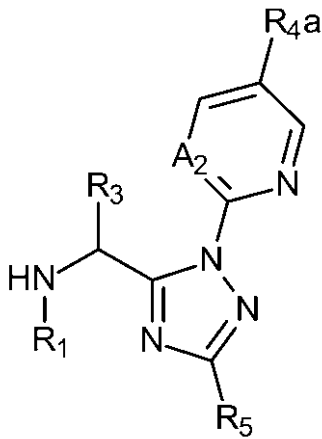
(I)

10

20

式 I I のアミン

【 化 9 】

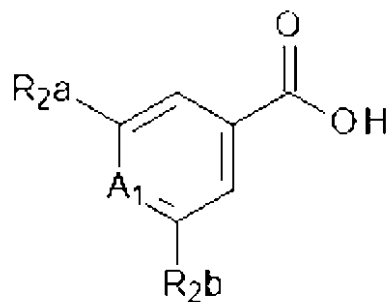


(II)

30

(式中、 R_1 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_2 は式 I に記載されているとおりである)と、式 I I I のカルボン酸誘導体

【 化 1 0 】



40

(式中、 R_{2a} 、 R_{2b} 及び A_1 は式 I において記載されているとおりである)との反応に

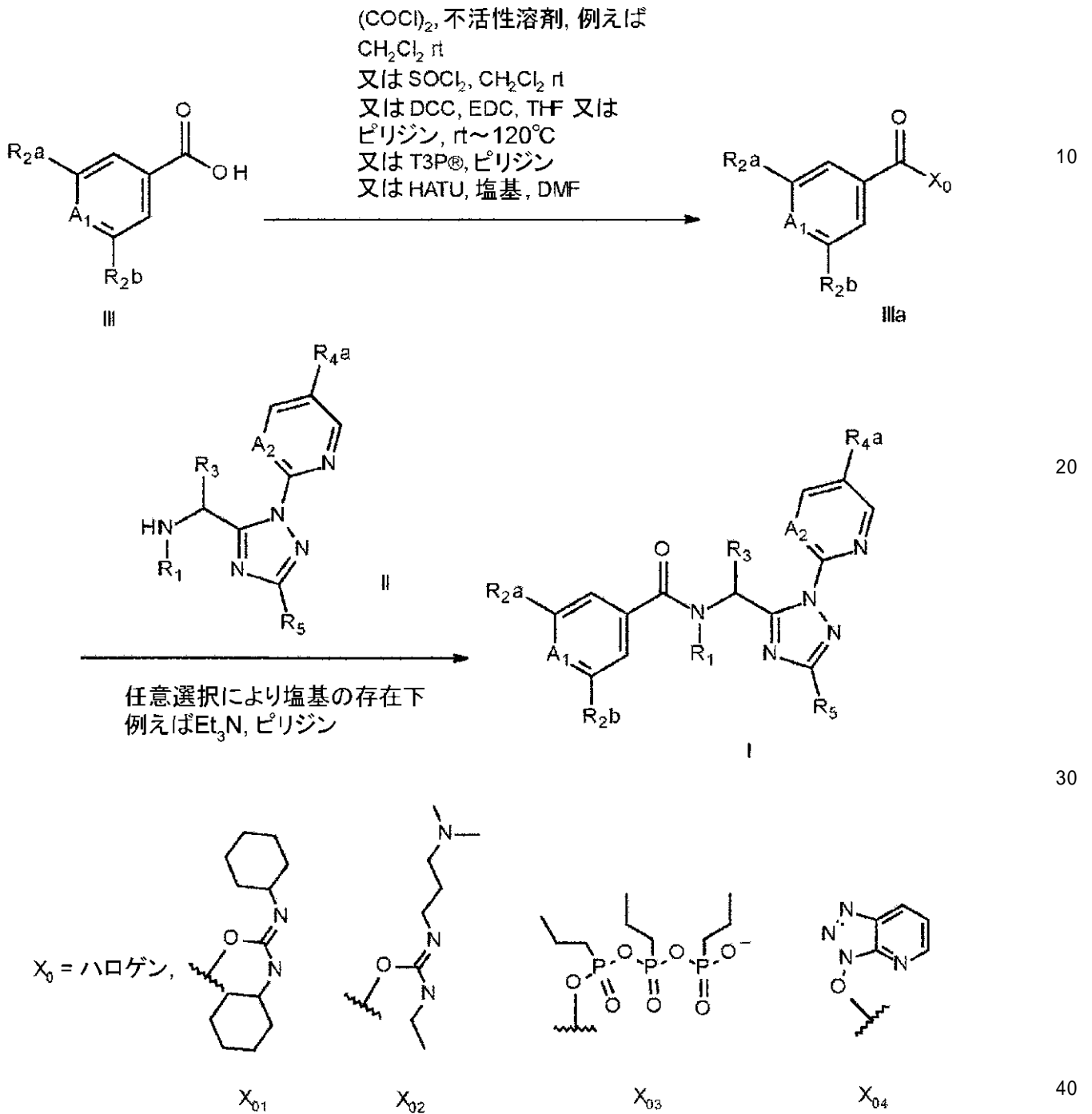
50

よって調製可能である。化学は、スキーム 1 においてより詳細に記載されている。

【 0 0 6 5 】

スキーム 1 :

【 化 1 1 】



スキーム 1 において、式 III の化合物（ここで、R_{2a}、R_{2b}及び A₁は、式 I において定義されているとおりである）は、当業者に公知であると共に、例えば Tetrahedron, 61 (46), 10827-10852, 2005 に記載されている方法により、式 III a の化合物に活性化される。例えば、X₀ がハロゲンである化合物は、例えば、塩化オキサリル又は塩化チオニルによる、触媒量の DMF の存在下における、2 塩化メチレン又は THF などの不活性溶剤中、20 ~ 100、好ましくは 25 の温度での式 III の化合物の処理によって形成される。式 II の化合物（ここで、R₁、R₃、R₅、R_{4a}及び A₂は、上記のとおりである）による、任意に例えばトリエチルアミン又

はピリジンといった塩基の存在下における式 I I I a の処理で式 I の化合物がもたらされる。代わりに、式 I の化合物は、活性化種 I I I a (ここで、X₀は、それぞれ X₀₁及び X₀₂である) がもたらされる、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) による、例えばピリジン又は THF といった不活性溶剤中、任意に例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下における、50 ~ 180 の温度での式 I I I の化合物の処理によって調製可能である。さらに、式 I I I の酸は、例えば、Synthesis 2013, 45, 1569 及び Journal Prakt. Chemie 1998, 340, 581 に記載されている、式 I I I a の化合物 (ここで、X₀は、X₀₃及び X₀₄である) がもたらされる、プロパンホスホン酸無水物 (T3P (登録商標)) 又は O - (7 - アザ - 1 - ベンゾトリアゾリル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート (HATU) などのカップリング試薬との反応によっても活性化可能である。式 I I のアミンとのその後の反応で式 I の化合物がもたらされる。

10

【0066】

式 I の化合物 (ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、R₅、A₁、及び A₂ は、式 I において定義されているとおりである) の調製方法は、一般に公知であり、又は当業者により容易に調製可能である。このような合成の典型的な例は、スキーム 2 に示されている。

【0067】

スキーム 2:

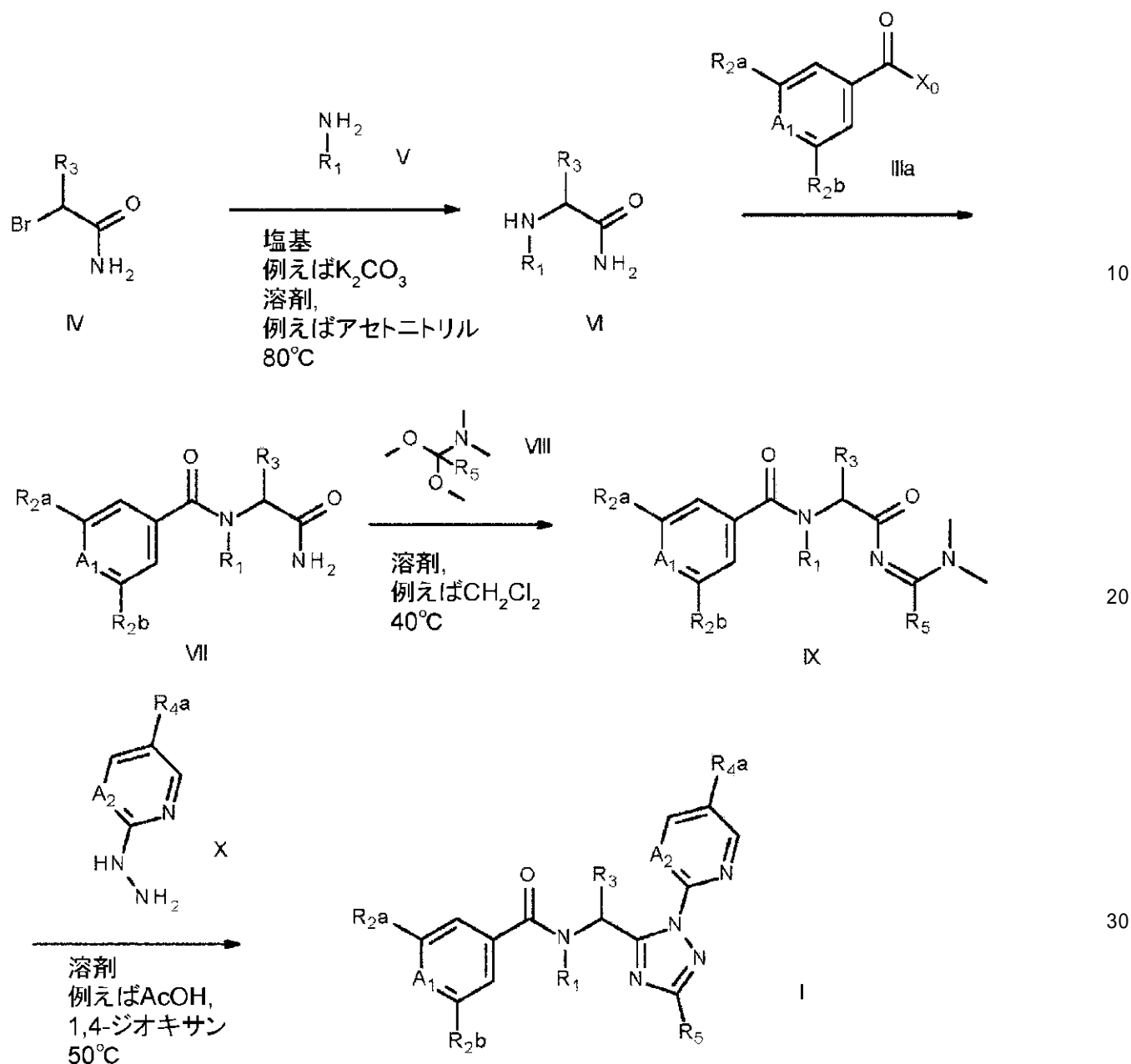
20

30

40

50

【化 1 2】



例えば、式 I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2a 、 R_2b 、 R_3 、 R_4a 、 R_5 、 A_1 、及び A_2 は、式 I において定義されているとおりである）は、例えば酢酸及び 1,4-ジオキサンの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常は室温 ~ 120°C の温度、好ましくは 40°C ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 IX の化合物（ここで、 R_1 、 R_2a 、 R_2b 、 R_3 、及び R_5 は、式 I について定義されている）と、式 X の化合物（ここで、 R_4a 及び A_2 は、式 I において定義されている）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750 において既に記載されている。

【0068】

式 IX の化合物（ここで、 R_1 、 R_2a 、 R_2b 、 R_3 、及び R_5 は、式 I について定義されている）は、例えば、ジクロロメタンを含み得る好適な溶剤中、通常は室温 ~ 150°C の温度、好ましくは 40°C ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式 VII の化合物（ここで、 R_1 、 R_2a 、 R_2b 、 R_3 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）と、式 VII の化合物（ここで、 R_5 は、上記に定義されているとおりである）との反

10

20

30

40

50

応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750、及び米国特許出願公開第2016296501号明細書、第29ページにおいて既に記載されている。

【0069】

式VIIの化合物(ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、及びA₁は、式Iについて定義されている)は、例えば、ピリジン、DMF、アセトニトリル、CH₂Cl₂又はTHFを含み得る好適な不活性溶剤中、任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下、通常は室温~150の温度での加熱下における、式VIの化合物(ここで、R₁及びR₃は、式Iについて定義されている)と、式IIIaの化合物(ここで、R_{2a}、R_{2b}、A₁及びX₀は、上記に定義されているとおりである)との反応により調製され得る(スキーム1を参照のこと)。

10

【0070】

式VIの化合物(ここで、R₁及びR₃は式Iに定義されているとおりである)は、例えばアセトニトリル又はジオキサンを含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基(又は、炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム)の存在下、通常は室温~150の温度、好ましくは40~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式IVの化合物(ここで、R₃は式Iにおいて定義されているとおりである)と、式Vの化合物(ここで、R₁は式Iにおいて定義されているとおりである)との反応により調製され得る。

20

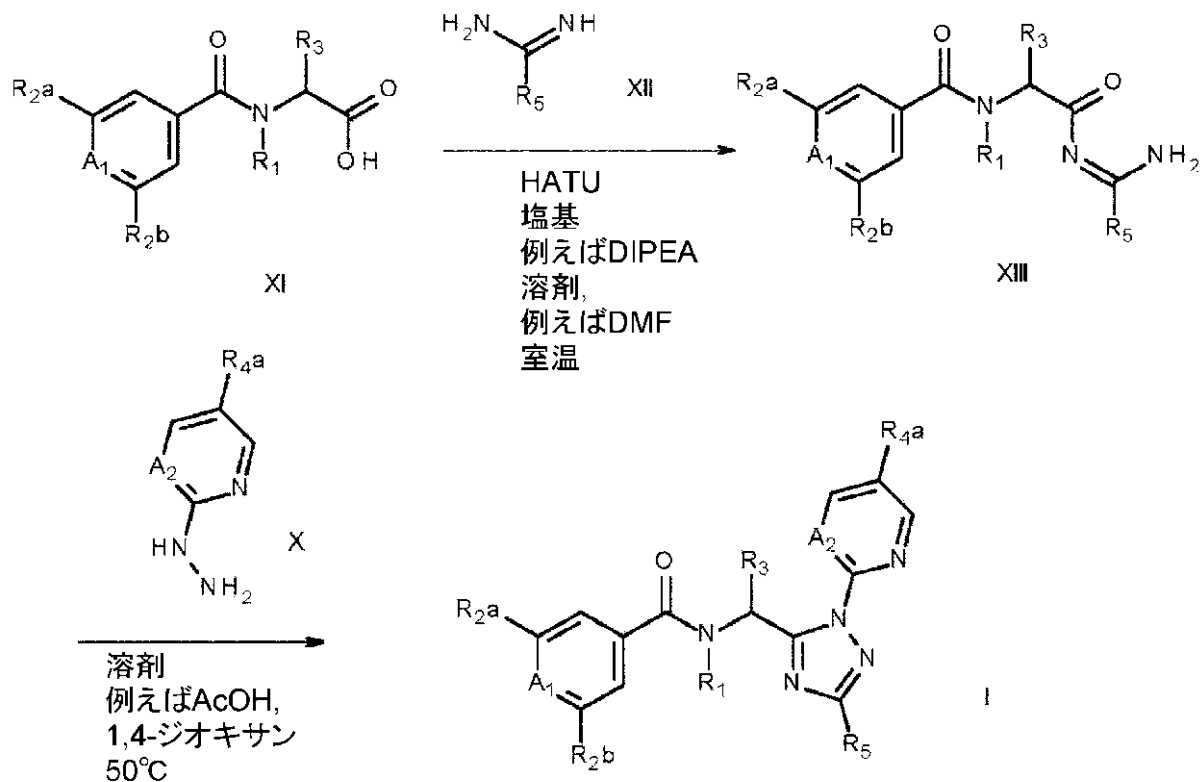
【0071】

式Iの化合物(ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、R₅、A₁、及びA₂は、上記に定義されているとおりである)の調製のためのさらに別の方法は、スキーム3において概説されている。

【0072】

スキーム3.

【化13】



30

40

式Iの化合物(ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、R₅、A₁、及びA₂は、式Iについて定義されている)は、例えば、酢酸を含み得る好適な溶剤中、通常は室温~12

50

0 の温度、好ましくは 40 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 X I I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 、及び A_1 は、式 I について定義されている）と、式 X の化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_2 は、式 I において定義されている）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*J. Org. Chem.* 2011, 76, 1177 において既に記載されている。

【0073】

式 X I I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 、及び A_1 は、式 I について定義されている）は、例えば、HATU を含み得るカップリング剤の存在下、例えば、DMF を含み得る好適な溶剤中、通常は室温 ~ 150 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 X I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、及び A_1 は、式 I について定義されている）と、式 X I I の化合物（ここで、 R_5 は、上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*J. Org. Chem.* 2011, 76, 1177 において既に記載されている。

10

【0074】

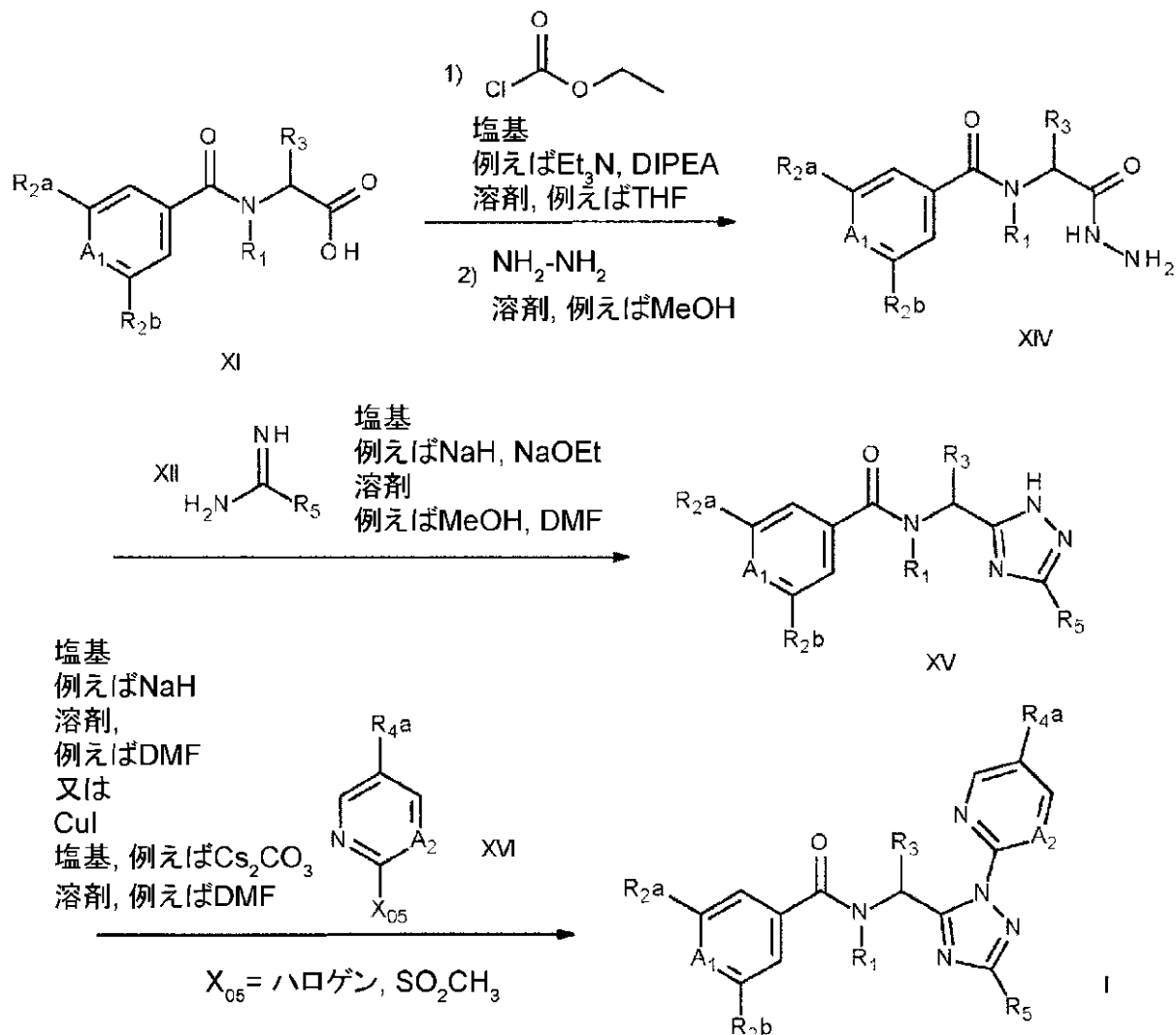
或いは、式 I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 、 A_1 及び A_2 は上記に定義されているとおりである）はまた、スキーム 4 に示されているプロセスによって調製され得る。

【0075】

スキーム 4 .

20

【化 1 4】



30

40

50

例えば、式 I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 、 A_1 及び A_2 は上記に定義されているとおりである）は、任意に、例えば Cu I といった銅触媒の存在下、DMF 又は NMP などの好適な溶剤の存在下、水素化炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温 ~ 200 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 X V の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は上記に定義されているとおりである）と、式 X V I の化合物（ここで、 R_{4a} 、 A_2 は式 I において定義されているとおりであり、及び、 X_{05} は、例えば塩素、臭素、ヨウ素又はメチルスルホンなどの脱離基を表す）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Chem. Asian J. 2014, 9, 166 において既に記載されている。

10

【0076】

式 X V の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 、及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、例えば水素化ナトリウム又は Na O E t といった塩基の存在下、例えば DMF といった好適な溶剤中、通常は室温 ~ 150 の温度での加熱下における、式 X I V の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）と、式 X I I の化合物（ここで、 R_5 は、上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る（国際公開第 2017/191115 号、第 32 ~ 33 ページ、Inorganica Chim. Acta 2010, 363, 2163 又は Angew. Int. Ed. 2017, 129, 9311 と同様に）。

【0077】

20

式 X I V の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、例えばトリメチルアミン又は DIPEA といった塩基の存在下、例えばメタノール又はエタノールといった好適な溶剤中、通常は室温 ~ 150 の温度での加熱下における、クロロギ酸エチル及びヒドラジンによる処理による、式 X I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）の反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、米国特許出願公開第 2011275801 号明細書、第 68 欄において既に記載されている。

【0078】

式 I a の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、 A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）は、スキーム 5 に示されているプロセスによって調製され得る。

30

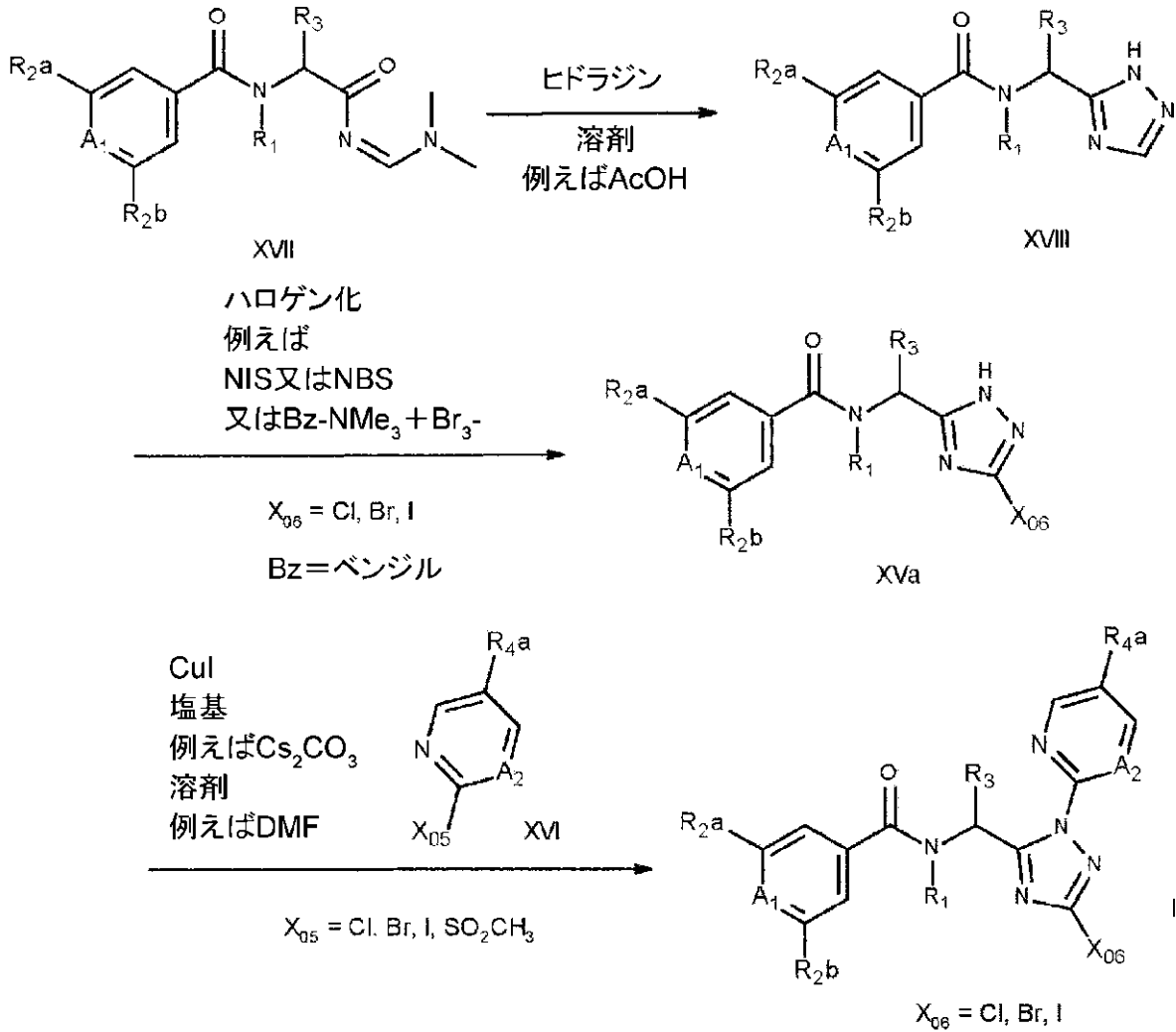
【0079】

スキーム 5 .

40

50

【化15】



10

20

30

40

50

従って、式 I a の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンを表す）は、任意に、例えば CuI といった銅触媒の存在下、好ましくは DMF 又は NMP などの好適な溶剤中、及び水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温 ~ 200 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 XV a の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）と、式 XVI の化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{05} は、例えば塩素、臭素又はヨウ素又は SO_2CH_3 といった脱離基を表す）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Chem. Asian J. 2014, 9, 166 において既に記載されている。

【0080】

式 XV a の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 及び A_1 は上記に定義されているとおりであり、 X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）は、例えば CH_2Cl_2 などの好適な溶剤中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化リチウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温 ~ 150 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 XVII I の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 及び A_1 は上記に定義されているとおりである）の例えばベンジルトリメチルアンモニウムトリブロミド、N-ヨードスクシンイミドといった八

ロゲン化剤によるハロゲン化によって調製され得る。このようなプロセスは、例えば、米国特許出願公開第2014206700号明細書(第37~38ページ)において既に記載されている。

【0081】

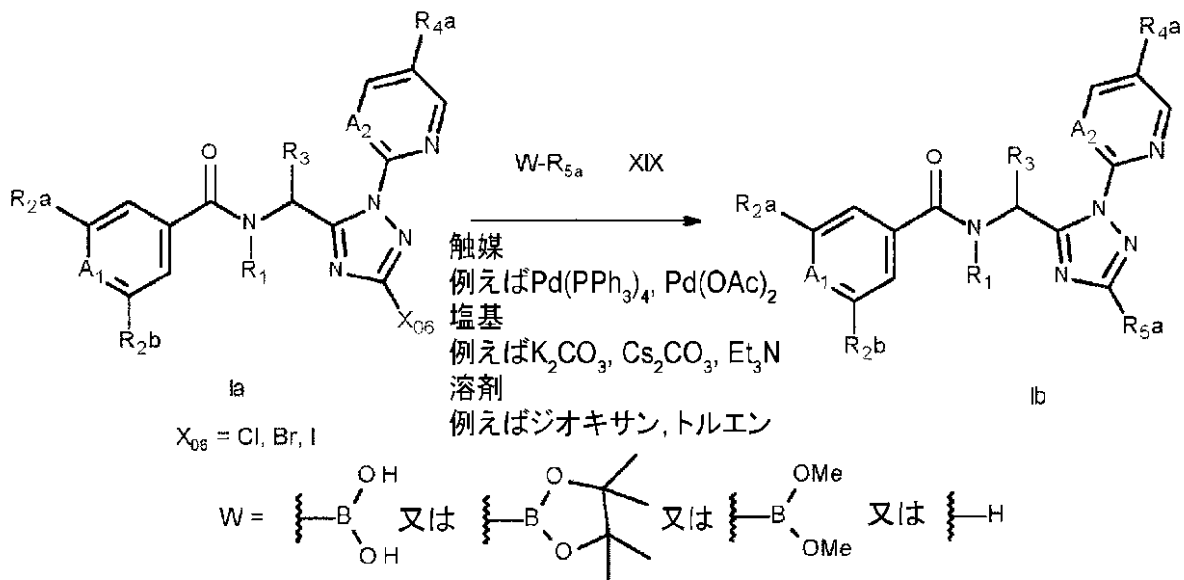
式XVIIの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 及び A_1 は上記に定義されているとおりである)は、例えば酢酸、酢酸及び1,4-ジオキサンの混合物又は酢酸及びトルエンの混合物である好適な溶剤中、通常は室温~120の温度、好ましくは40~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式XVIIの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 及び A_1 は上記に定義されているとおりである)と、ヒドラジンの反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*J. Heterocyclic Chem.* 2008, 45, 887; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 5121において既に記載されている。

10

【0082】

スキーム6。

【化16】



20

30

或いは、式Ibの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、 A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{5a} は、ジフェニルメタンイミン、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルである)は、スキーム6に示されているプロセスによって調製され得る。

【0083】

従って、式Ibの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{5a} は、ジフェニルメタンイミン、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルである)は、スキーム6に示されているように、式Iaの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである)と、式XIXの化合物(ここで、 R_{5a} は上記のとおりであり、及びWは、ボロン酸又はボロン酸エステル又は水素である)との反応により調製され得る。これらの種類の反応は、例えば、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ といったパラジウム触媒の存在下、ジオキサン又はトルエンなどの好適な溶剤中、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下において行われる。このようなプロセスは、例えば、*J. Med. Chem.*, 2014, 57, 3687-3706, *Org. Lett.* 2017, 19, 6594及び*Chemical Science*

40

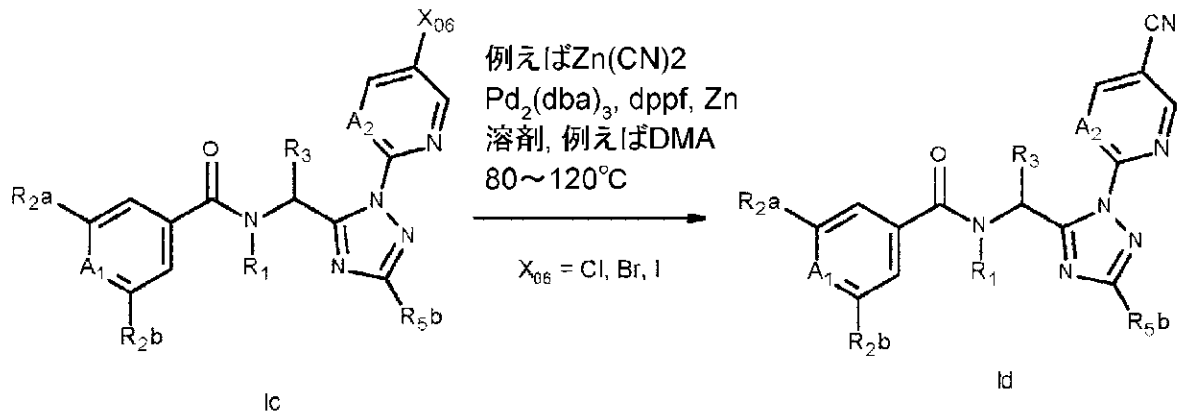
50

2016, 7, 6407において、同様に既に記載されている。

【0084】

スキーム7.

【化17】



10

(スキーム2による調製)

R₅はハロゲンでない

式I dの化合物を調製するためのさらに別の方法は、スキーム7において概説されている。従って、式I dの化合物(ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、A₁、A₂及びR_{5b}は、上記に定義されているとおりである)(ただしハロゲンでない)は、例えば、Pd₂(dba)₃といったパラジウム触媒の存在下、DMA又はDMFなどの好適な溶剤中、通常は80~120の温度、好ましくは120~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式I cの化合物とZn(CN)₂との反応により得られる。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron Lett. 2000, 41, 3271及びChem. Soc. Rev. 2011, 40, 5049において既に記載されている。

20

【0085】

式I Iの中間体(ここで、R₁、R₃、R₅、R_{4a}、及びA₂は、式Iにおいて定義されている)を合成するための方法は、部分的に公知であり(国際公開第2017/192385号、第24~30ページを参照のこと)、又は当業者により容易に調製可能である。このような中間体への典型的な合成経路が、スキーム8において概説されている。

30

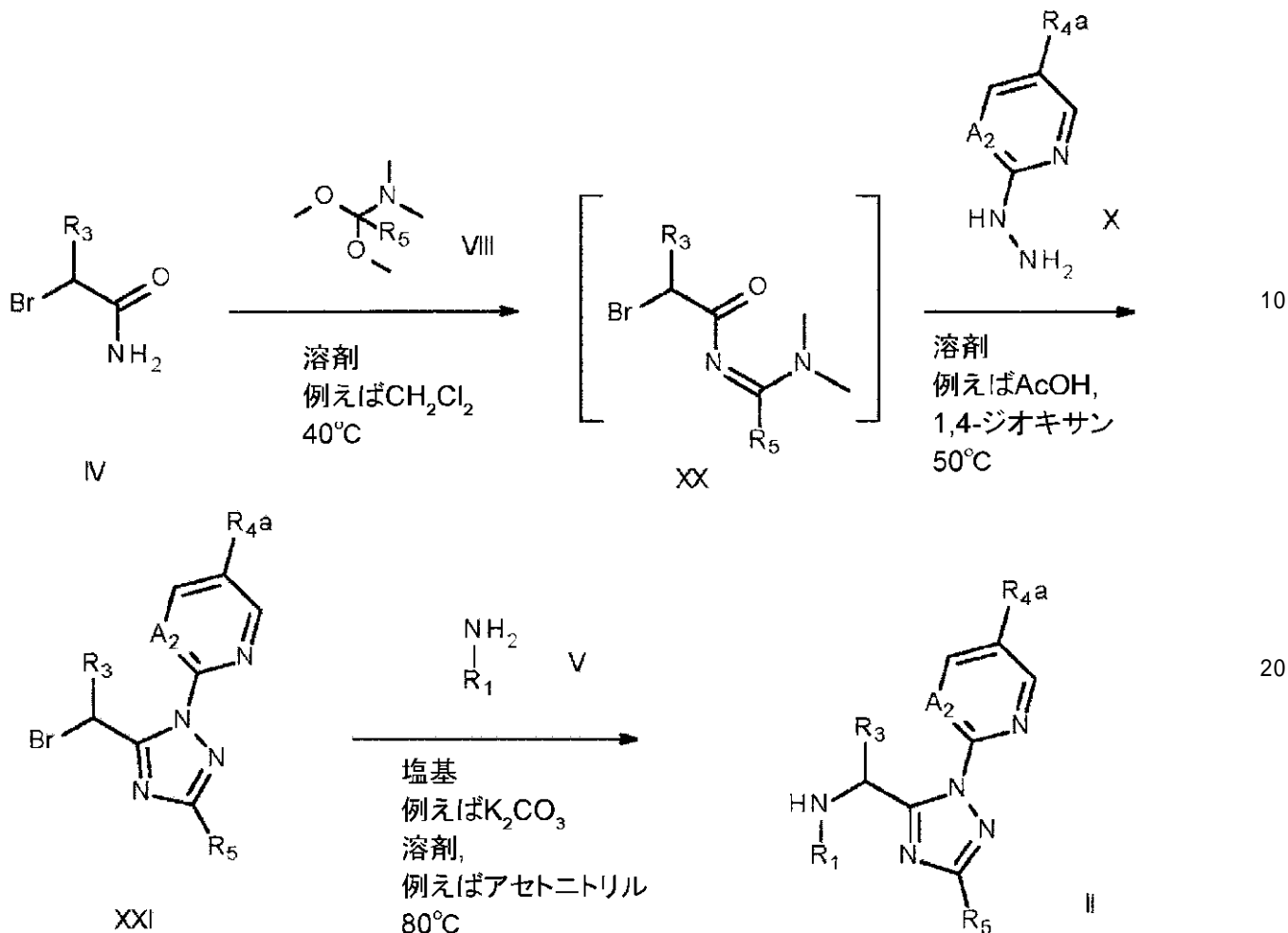
【0086】

スキーム8.

40

50

【化 1 8】



例えは、式 I I の化合物は、例えは、アセトニトリル又はジオキサンといった好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム）などの好適な塩基の存在下、通常は室温～150 の温度、好ましくは40～還流温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 X X I の化合物（ここで、R₃、R₅、R_{4a}、及びA₂は、式 I において定義されているとおりである）と、式 V の化合物（ここで、R₁は、式 I において定義されている）との反応により調製され得る。

【0087】

式 X X I の化合物（ここで、R₃、R_{4a}、R₅、及びA₂は、式 I において定義されているとおりである）は、例えは、酢酸及び1,4-ジオキサンの混合物といった好適な溶剤中、通常は室温～120 の温度、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 X X の化合物（ここで、R₃及びR₅は、式 I において定義されているとおりである）と、式 X の化合物（ここで、R_{4a}及びA₂は、式 I において定義されている）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えは、Tetrahedron 2017, 73, 750 において既に記載されている。

【0088】

式 X X の化合物（ここで、R₃及びR₅は、上記に定義されているとおりである）は、好適な溶剤、例えは、ジクロロメタン、通常は室温～150 の温度、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式 I V の化合物（ここで、R₃は、式 I において定義されているとおりである）と、式 V I I I の化合物（ここで、R₅は、上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えは、Tetrahedron 2017, 73, 750 において既に記載されている。

【0089】

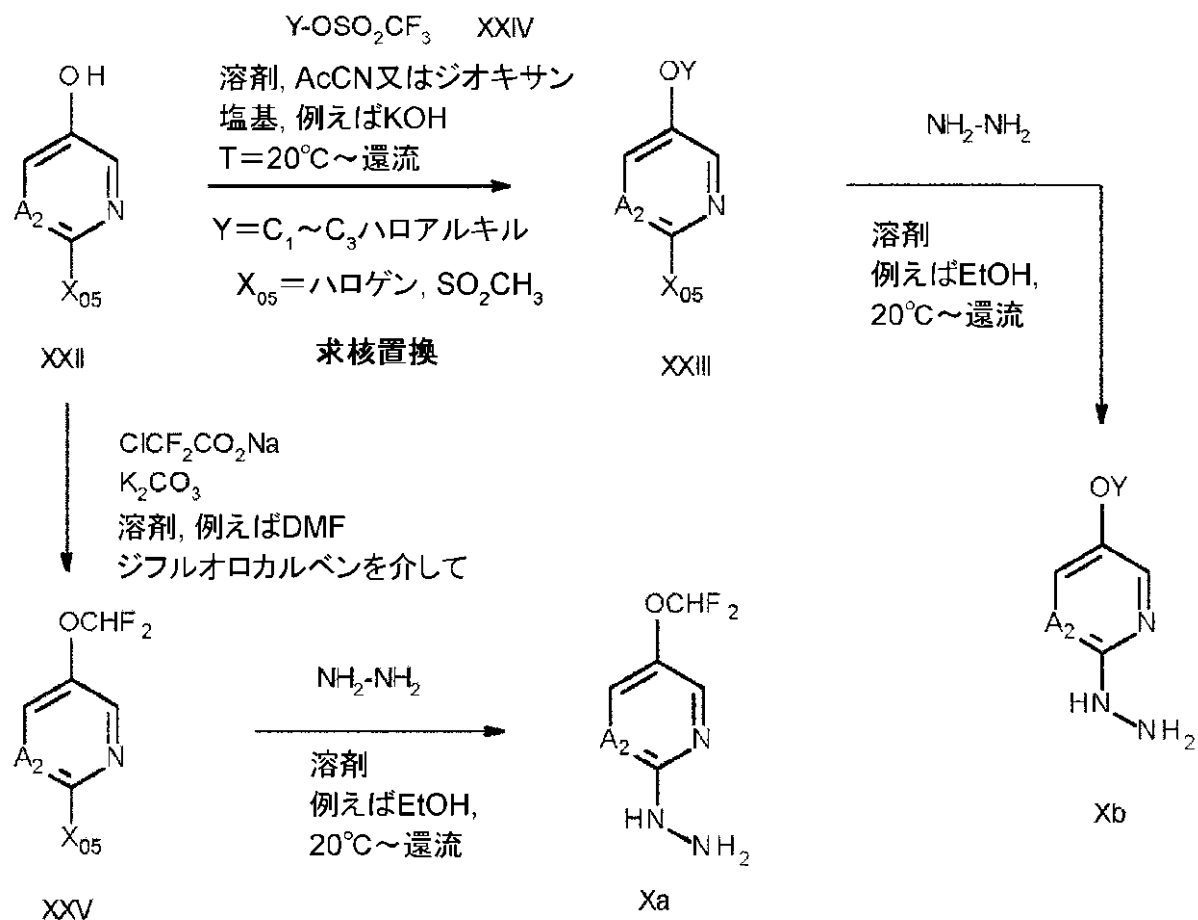
式 X a 又は X b のヒドラジン（ここで、A₂は、上記に定義されているとおりであり、及び Y は、C₁~C₃ハロアルキルである）は、市販されているか、又は周知の方法に従って調製され得（例えば、J. Fluorine Chem. 2017, 203, 155、米国特許出願公開第 2013/0225552 号明細書、第 128 ページ、Org. Process Res. Dev. 2011, 15, 721、ACS Med. Chem. Lett. 2017, 8, 666 及び Tet. Lett. 2016, 57, 1056 を参照のこと）；スキーム 9 は、式 X a 及び X b の化合物をもたらす一般的な合成方法を概説している。このようなヒドラジンは、最終化合物の調製のための有用な中間体である。

【0090】

10

スキーム 9：

【化 19】



20

30

式 X c のヒドラジン（ここで、A₂は、上記に定義されているとおりである）は、スキーム 9 において既に記載されているのとかかなり類似した方法で調製され得る。従って、式 X X V I の化合物（ここで、A₂は、上記に定義されているとおりであり、及び X₀₅は、ハロゲン又はメチルスルホンを表す）は、好適な溶剤、好ましくはエタノール又はイソプロパノール中、20 ~ 還流条件の温度で、ヒドラジンと反応されて、式 X c の化合物が得られる（例えば、Tet. Lett. 2016, 57, 1056 を参照のこと）。

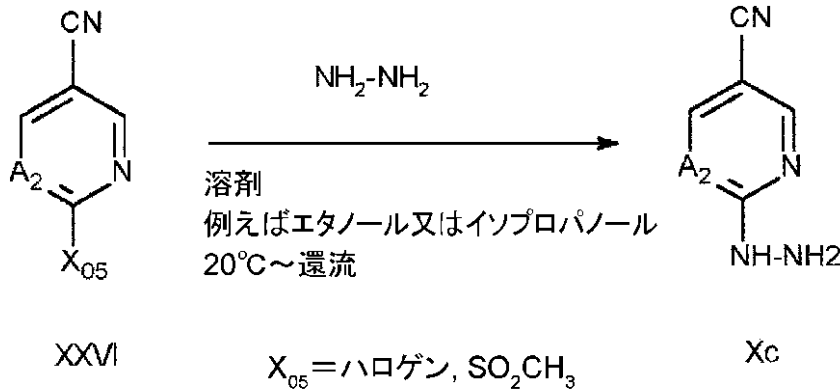
40

【0091】

スキーム 10：

50

【化 2 0】



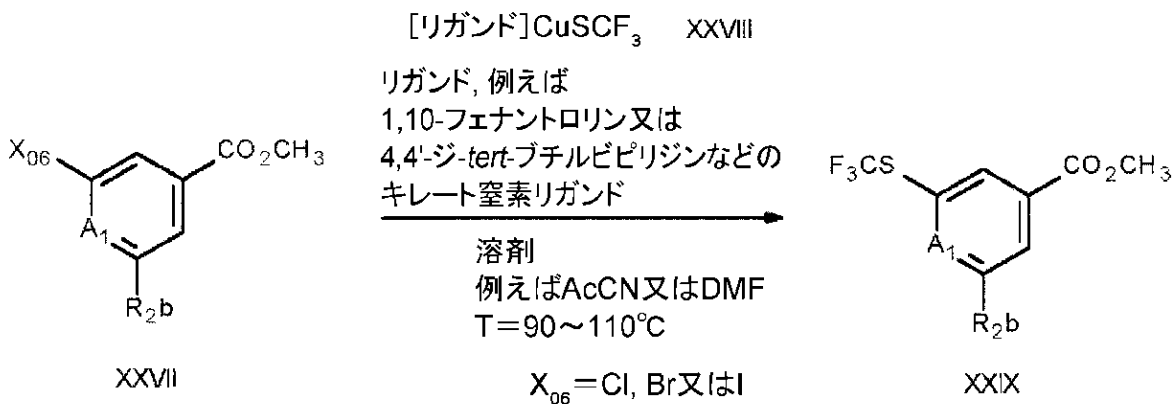
10

式 XXXI のカルボン酸（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、最終化合物の調製のための有用な中間体であり（スキーム 1 を参照のこと）、スキーム 11 に示されているプロセスによって調製され得る。

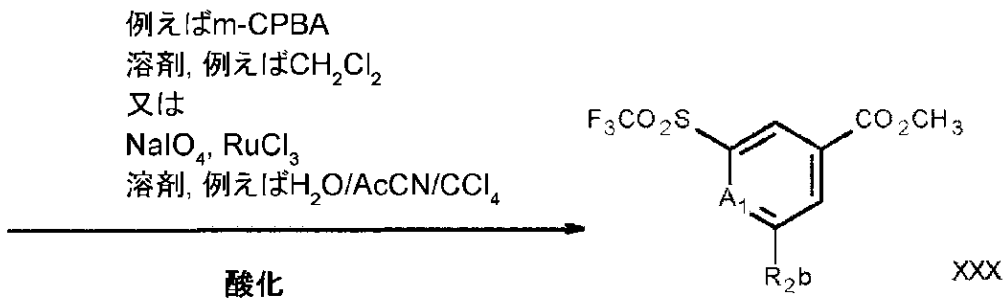
【0092】

スキーム 11 .

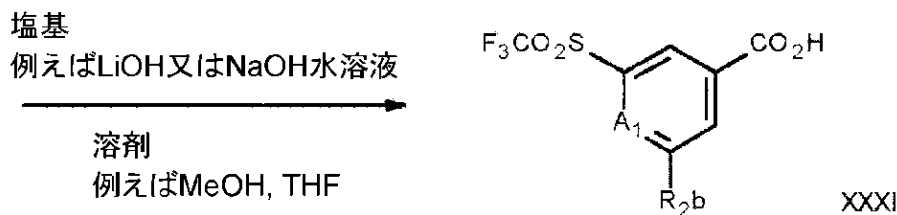
【化 2 1】



20



30



40

従って、式 XXXI の化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、MeOH、THF、及び H_2O 又はそれらの混合物のような好適な溶剤中、通常は室温~還流の温度での加熱下における、式 XXX の化合物と、水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなどの好適な塩基との反応により調製され得る。

50

【0093】

式XXXの化合物は、溶剤、好ましくは CH_2Cl_2 、又は CHCl_3 又は H_2O 、 AcCN 及び CCl_4 の混合物中、例えば、*m*-CPBA又は $\text{NaIO}_4/\text{RuCl}_3$ による酸化によって調製される。このような変換は、当業者に公知であり、例えば、*J. Med. Chem.* 2008, 51, 6902又は国際公開第2004/9086号、第24~25ページに記載されている。

【0094】

最後に、式XXIXの化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、アセトニトリル又はDMFといった好適な溶剤中、通常は20~150の温度、好ましくは40~反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式XXVIIの化合物と、式XXVIIIの好適なトリフルオロメチルチオール化銅試薬（リガンドは、例えば1,10-フェナントロリン又は4,4'-ジ-tert-ブチルピピリジンである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*Angew. Chem. Int. Ed.* 2013, 52, 1548-1552、*Angew. Chem. Int. Ed.* 2011, 50, 3793、*Org. Lett.* 2014, 16, 1744、*J. Org. Chem.* 2017, 82, 11915において既に記載されている。

10

【0095】

式XXXIIIのさらなる中間体（ここで、 R_{2a} 、 R_{2b} 、及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、一般に公知であり、又は当業者により容易に調製可能である。式XXXIIIの化合物のこのような合成の典型的な例は、スキーム12に示されている。

20

【0096】

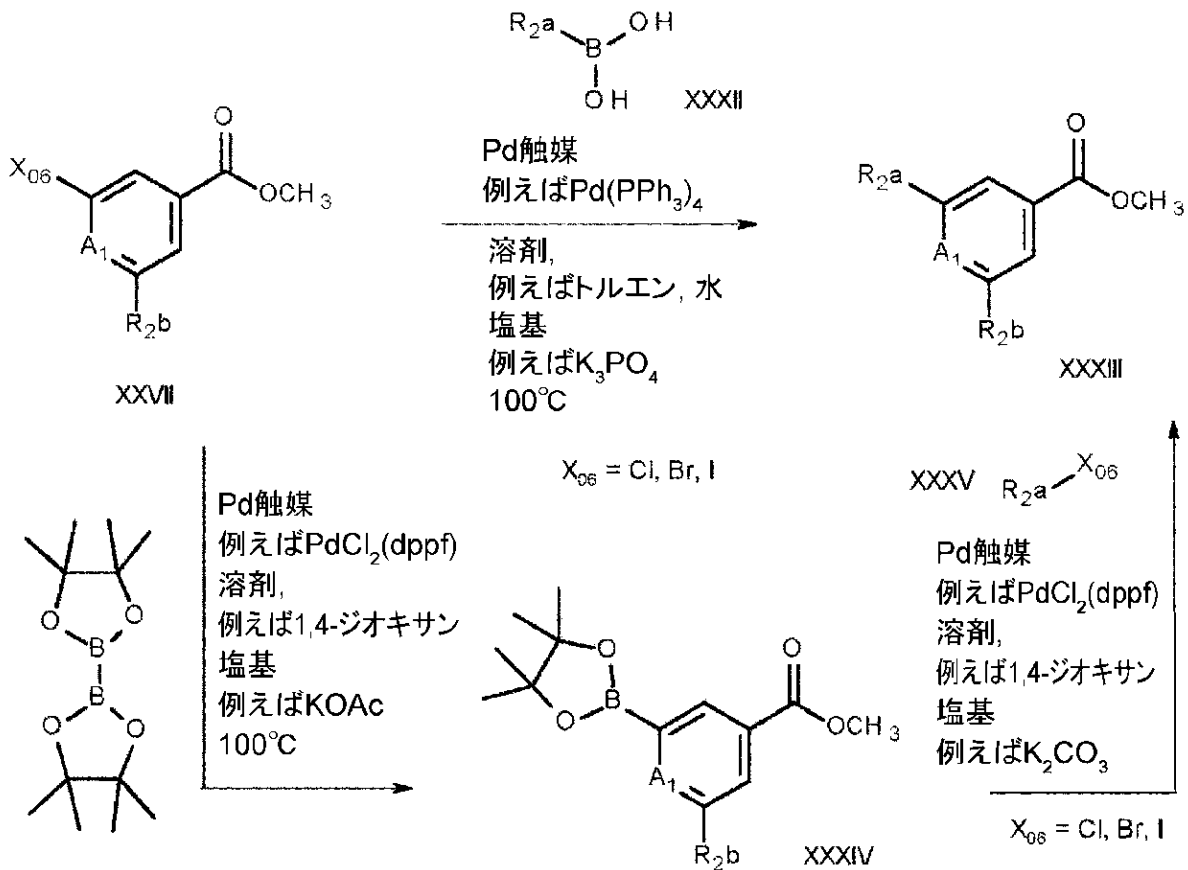
スキーム12

30

40

50

【化 2 2】



10

20

R_{2a}は、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニルでない

例えば、式XXXIIIの化合物（ここで、R_{2a}、R_{2b}、及びA₁は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、Pd(PPh₃)₄といったパラジウム触媒の存在下、例えば、トルエン/水、1,4-ジオキサン/水といった好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム又はリン酸三カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式XXXIIIの化合物（ここで、R_{2b}及びA₁は、上記に定義されているとおりであり、及びX₀₆は、塩素、臭素及びヨウ素を表す）と、式XXXIIの化合物（ここで、R_{2a}は、上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron Letters 2002, 43, 6987-6990において既に記載されている。

30

【0097】

式XXXIIIの化合物（ここで、R_{2a}、R_{2b}、及びA₁は、上記に定義されているとおりである）はまた、例えば、PdCl₂(dppf)といったパラジウム触媒の存在下、例えば、トルエン/水、1,4-ジオキサン/水を含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム又はリン酸三カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式XXXIVの化合物（ここで、R_{2b}及びA₁は、上記に定義されているとおりである）と、式XXXVの化合物（ここで、R_{2a}は、上記に定義されているとおりであり、及びX₀₆は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、国際公開第12139775号、第73ページにおいて既に記載されている。

40

【0098】

50

式 $XXIV$ の化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、 $PdCl_2(dppf)$ といったパラジウム触媒の存在下、例えば、トルエン/水、1,4-ジオキサン/水を含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム又は酢酸カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温～200の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 $XXVII$ の化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）と、ビス(ピナコラト)ジボロン (B_2pin_2) との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*Biorg. Med. Chem. Lett.* 2015, 25, 1730、及び国際公開第12139775号、第67ページにおいて既に記載されている。

10

【0099】

式 $XXVII$ のカルボン酸は、例えば、THF/MeOH混合物を含み得る好適な溶剤中、通常は室温～100の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度での加熱下における、例えばLiOH、NaOH又はKOH水溶液による処理によって、スキーム11に概説されるのと同様に式 $XXVII$ の化合物から調製され得る（スキーム13を参照のこと）。

【0100】

式 $XXVII$ の化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{2a} は、H、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、シアノ及びハロゲンである）は、Fe触媒及び塩基、好ましくはCsFの存在下、0～50°、好ましくは20の温度で、溶剤としてDMA中、(トリフルオロエチル)-ジフェニル-スルホニウムトリフレート ($Ph_2S+CH_2CF_3-O^+Tf$) による、式 $XXVI$ の化合物（これは、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製可能である）（例えば、*Angew. Chem. Int. Ed.* 2004, 43, 1132及び*Pure Appl. Chem.* 1985, 57, 1771を参照のこと）の処理によって調製され得る（*Org. Lett.* 2016, 18, 2471と同様に）。式 $XXVII$ の化合物は、トランス異性体が主要な異性体である立体異性体の混合物として得られる。

20

【0101】

式 $XXVII$ の化合物（ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{2aa} は、H、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、シアノ又はハロゲンである）を調製するためのさらに別の方法は、Fe触媒の存在下で、トリフルオロエチルアミン塩酸塩/ $NaNO_2$ / $NaOAc$ を使用し；この反応は、 H_2O 中；又は CH_2Cl_2 及び H_2O の混合物中で、室温で実施される。例えば、*Angew. Chem. Int. Ed.* 2010, 49, 938及び*Chem. Commun.* 2018, 54, 5110を参照のこと。

30

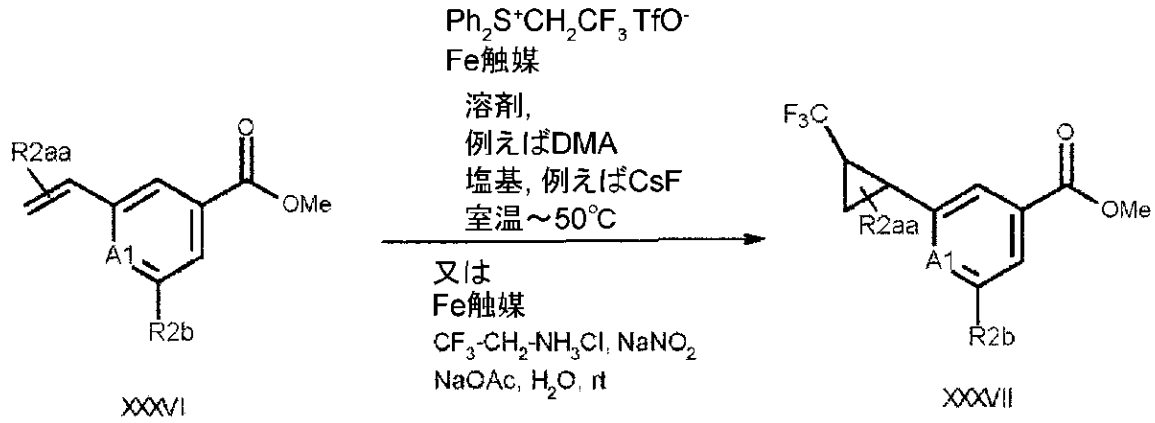
【0102】

スキーム13。

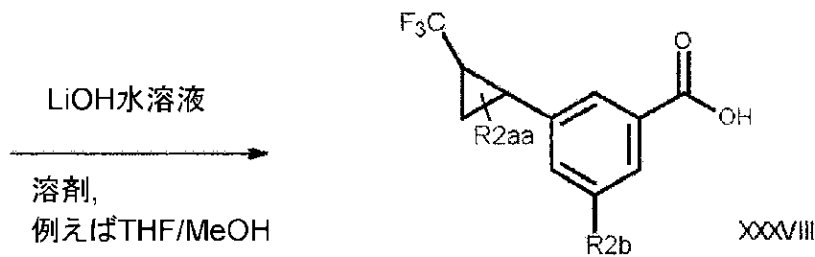
40

50

【化 2 3】



10



20

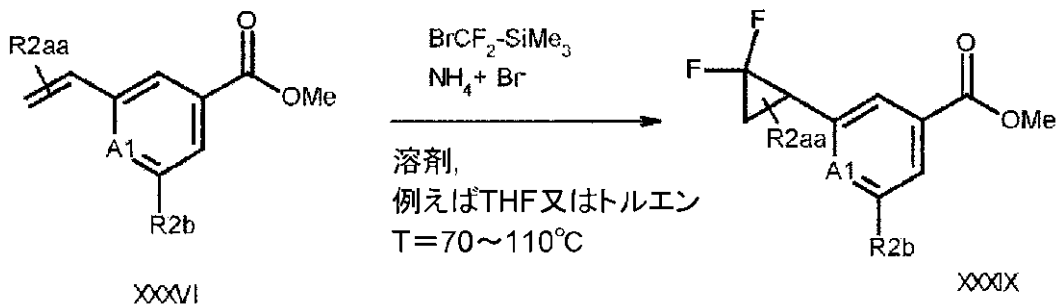
$\text{R}_{2aa} = \text{H}, \text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル}, \text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{ハロアルキル}, \text{シアノ}, \text{ハロゲン}$ である

式XLのカルボン酸（ここで、 R_{2b} 、 A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{2aa} は、 H 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{ハロアルキル}$ 、シアノ及びハロゲンである）は、スキーム13に既に示されているのとかかなり類似した方法で調製され得る。

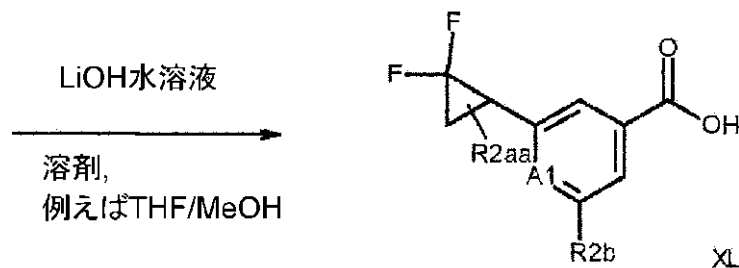
【0103】

スキーム14.

【化 2 4】



30



40

$\text{R}_{2aa} = \text{H}, \text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル}, \text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{ハロアルキル}, \text{シアノ}, \text{ハロゲン}$ である

従って、式XXXIXの化合物（ここで、 R_{2b} 、 A_1 は、上記に定義されているとおり

50

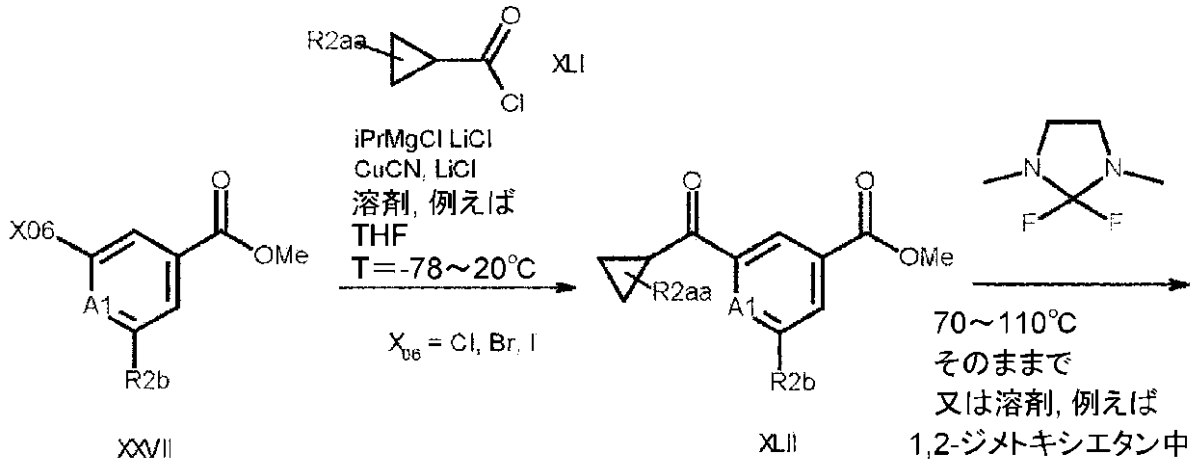
であり、及び R_{2aa} は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シアノ及びハロゲンである)は、 $NH_4^+Br^-$ の存在下、好適な溶剤、好ましくはTHF又はトルエン中、70~110の温度で、式XXXVIの化合物(ACS Med. Chem. Lett. 2013, 4, 514又はTetrahedron Lett. 2001, 42, 4083と同様に合成される)と、(プロモジフルオロメチル)-トリメチルシランとの反応により調製される。メチルエステルXXXIXのその後の酸化により、式XLの化合物が得られる(スキーム14)。

【0104】

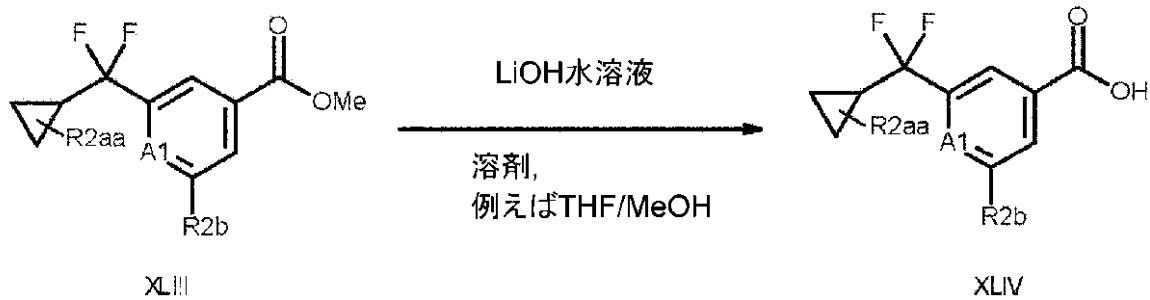
スキーム15.

【化25】

10



20



30

$R_{2aa} = H, C_1 \sim C_3$ アルキル, $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル, シアノ, ハロゲンである

式XLIVのカルボン酸(ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{2aa} は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シアノ及びハロゲンである)は、反応スキーム15に従って調製され得る。従って、式XXXVIIの化合物(ここで、 R_{2b} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素である)は、 $iPrMgCl/LiCl$ -錯体で処理され; $CuCN$ とのその後の反応及び式XLIのシクロプロパンカルボニルクロリド(ここで、 R_{2a} は、上記に定義されているとおりである)によるクエンチにより、式XLIIの化合物が得られる(国際公開第2006/067445号、第148ページと同様に)。例えば1,2-ジメトキシ-エタンといった溶剤中又はそのままの2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリンによるフッ素化(Chem. Commun. 2002, (15), 1618を参照のこと)の後、式XLIIの化合物が得られる。既に記載されている、例えばLiOHを用いたその後の加水分解により、式XLIVのカルボン酸が得られる。

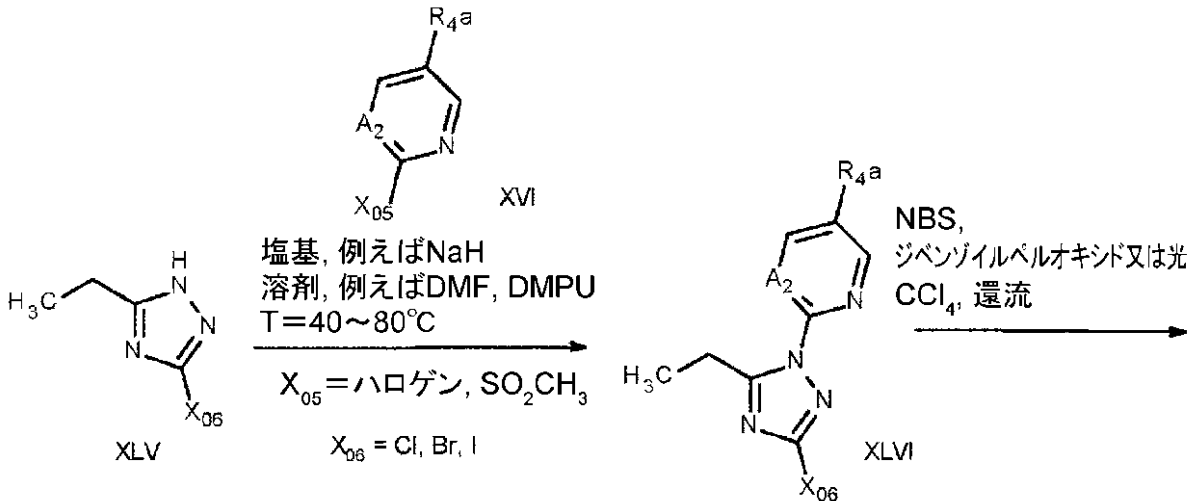
40

【0105】

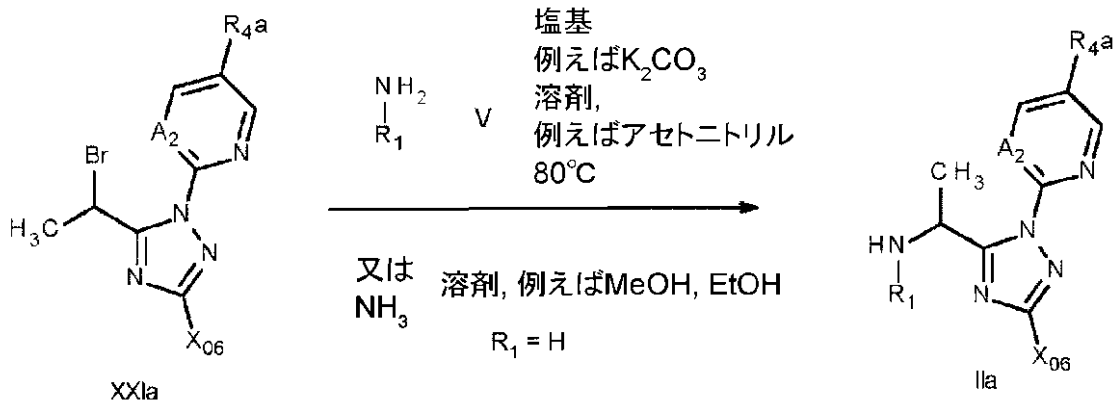
スキーム16

50

【化 2 6】



10



20

式 II a の中間体を調製するためのさらに別の方法は、スキーム 16 において概説されている。従って、式 XLV の化合物（ここで、X₀₆ は、塩素、臭素又はヨウ素である）は、塩基、好ましくは NaH の存在下、例えば DMF 又は DMPU といった非プロトン性溶剤中で、式 XVI の化合物（ここで、R_{4a} 及び A₂ は、上記に定義されているとおりであり、及び X₀₅ は、例えばハロゲン又はメチルスルホンといった脱離基である）で処理されて、一般式 XLVI の化合物が得られる（Chem. Ber. 1967, 100, 2250 による）。公知の条件下における式 XLVI の化合物のその後のベンジル臭素化（米国特許第 4295876 号明細書、第 14 ~ 15 ページと同様に）により、式 XXI a の化合物（ここで、R_{4a}、X₀₆、及び A₂ は、上記に定義されているとおりである）がもたらされる。最後に、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 XXI a の化合物と、アンモニア（例えば、国際公開第 2017/192385 号、第 30 ページを参照のこと）又は式 V のアミン（国際公開第 2008/017932 号、第 53 ページと同様に）（ここで、R₁ は、上記に定義されているとおりである）との反応により、式 II a の化合物が得られる。

30

40

【0106】

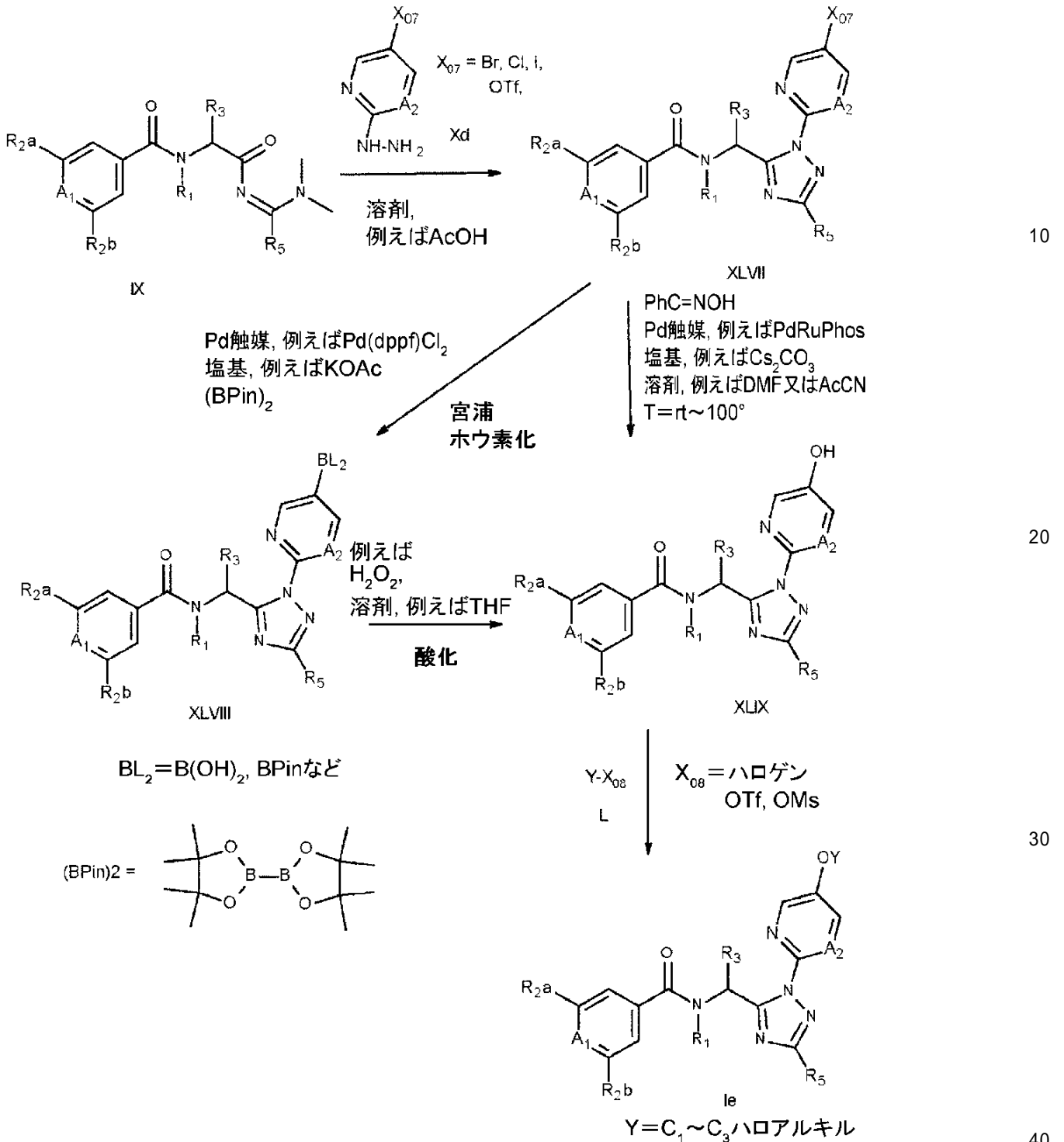
式 I e の最終化合物を調製するためのさらに別の方法は、スキーム 17 において概説されている。

【0107】

スキーム 17 :

50

【化 2 7】



従って、式 I e の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_5 、 A_1 及び A_2 は、既に定義されているとおりであり、及び Y は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである）は、水素化ナトリウム、 K_2CO_3 、又は Cs_2CO_3 などの塩基の存在下、THF、DMF、又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中で、一般式 L のアルキル化試薬（ここで、 X_{08} は、好ましくは、Cl、Br、F、I、 OSO_2CF_3 、又は OSO_2CH_3 などの脱離基であり、及び Y は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである）で処理することにより、式 XLIX の化合物から調製され得、式 I e の化合物が得られる。このようなアルキル化反応は、当業者に周知である。式 XLIX の化合物は、式 XLVII の化合物の宮浦ホウ素化、続いて、式 XLVII の中間体の酸化によって得られる。式 XLVII の中間体（ここで、 R_1

10

20

30

40

50

、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 、 A_1 、 A_2 は、式 I に定義されているとおりであり、及び B 、 L_2 は、ボロン酸誘導体、好ましくは 4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン - 2 - イルを表す) は、パラジウム触媒反応において、ビスピナコールジボラン (BPi n)₂ による、式 XLVII の化合物 (ここで、 X_{07} は、Cl、Br、I、又は OTf などの脱離基であり、及び R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_5 、 A_1 、及び A_2 は、式 I に定義されているとおりである) の処理によって得られる。この反応は、非プロトン性溶剤中、塩基、好ましくは酢酸カリウムなどの弱塩基、及びこのタイプの反応の一般的な触媒としての Pd(dppf)Cl₂ の存在下で、実施され得る。反応の温度は、好ましくは、0 ~ 反応混合物の沸点である。式 XLVII の得られた中間体は、酸化試薬、好ましくは過酸化水素又はその尿素錯体による処理により、式 LX の化合物に 10 転化され得る。式 XLVII の化合物はまた、アセトニトリル又は DMF などの非プロトン性溶剤中、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意に Rock Phos - G3 - パラダサイクル ([(2 - ジ - tert - ブチルホスフィノ - 3 - メトキシ - 6 - メチル - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフェニル) - 2 - (2 - アミノビフェニル)] パラジウム (II) メタンスルホネート) などのパラジウム触媒の存在下、25 ~ 100 の温度での、(E) - ベンズアルデヒドオキシムとの反応により、式 LX の化合物に転化され得る。このような反応は、文献において公知であり、例えば、Ang. Chem. Int. Ed. 56, (16) 4478 - 4482, 2017 に記載されている。そのように得られた式 LX の化合物は、当業者に周知の、及び既に 20 上述されたアルキル化方法により、式 Ie の化合物に転化される。

【0108】

最後に、一般式 LIV のさらなるイソニコチン酸エステル中間体を調製するための方法は、スキーム 18 において概説されている。

【0109】

従って、 R_{2a} が、シアノによって置換されるシクロプロピルである、式 I の化合物の特殊な場合 (式 LI 及び LIV の化合物によって表される) については、化合物は、スキーム 18 に示されている方法により調製され得る。

【0110】

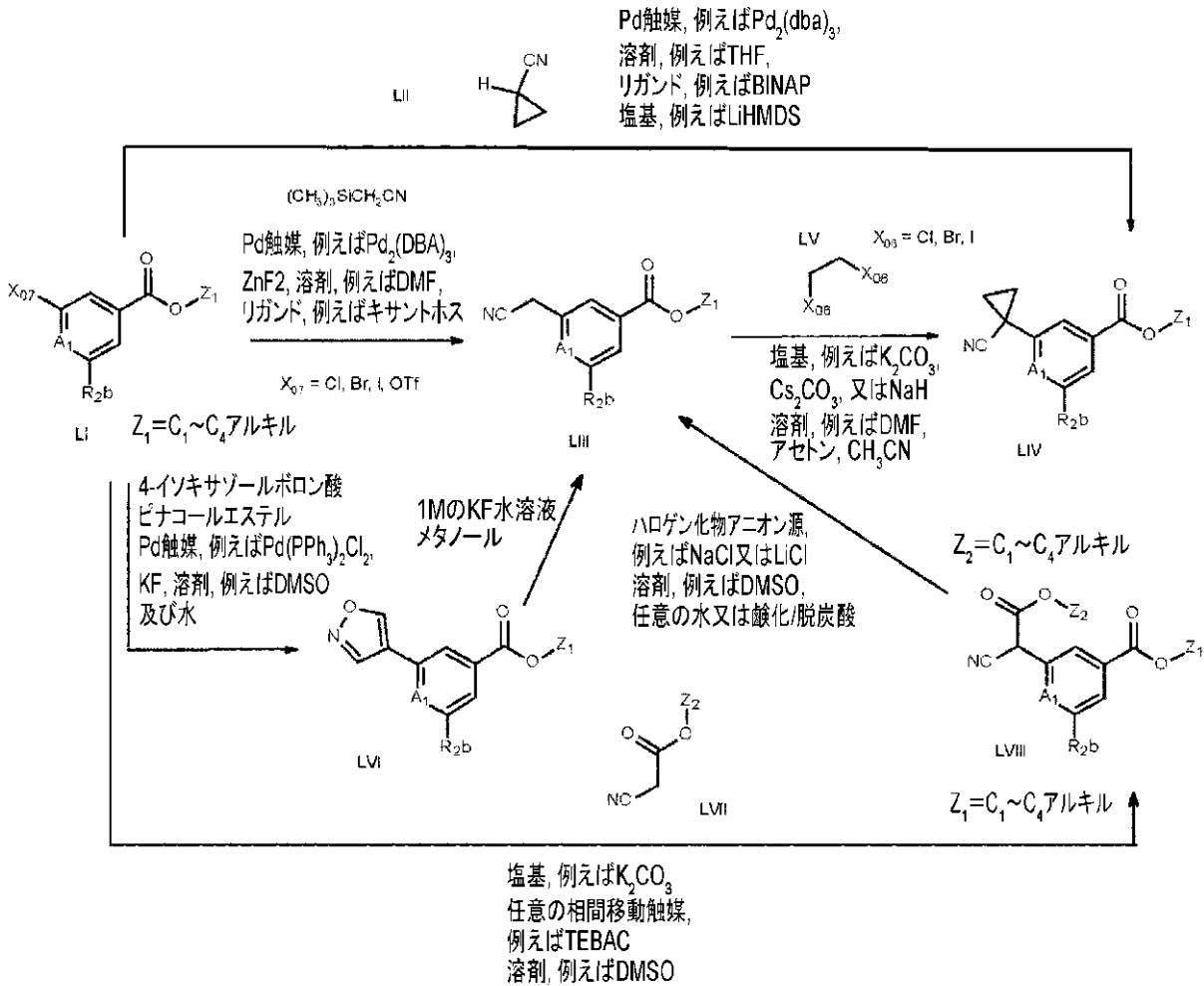
スキーム 18

30

40

50

【化 2 8】



10

20

フッ化亜鉛 (I I) (ZnF₂)、及びトリス (ジベンジリデンアセトン) ジ - パラジウム (0) - クロホルム付加物 (Pd₂(dba)₃) などのパラジウム (0) 触媒の存在下、リガンド、例えばキサントホスと共に、N, N - ジメチルホルムアミド (DMF) などの不活性溶剤中、100 ~ 180 の温度で、任意にマイクロ波加熱下における、トリメチルシリル - アセトニトリル TMSCN による、式 L I の化合物 (ここで、R_{2b} 及び A₁ は、上記の式 I に記載されているとおりであり、及び X₀₇ は、例えばハロゲン又はスルホネート、好ましくは塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメタンスルホネートといった脱離基であり、及び Z₁ は、C₁ ~ C₄アルキルである) の処理により、式 L I I の化合物 (ここで、R_{2b}、Z₁、及び A₁ は、上記のとおりである) がもたらされる。このような化学反応は、例えば、Org. Lett. 16 (24), 6314 - 6317, 2014 といった文献に記載されている。或いは、フッ化カリウム KF、及びビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (I I) ジクロリド Pd (PPh₃)₂Cl₂ などのパラジウム触媒の存在下、ジメチルスルホキシド DMSO などの不活性溶剤中、任意に水との混合物中、40 ~ 150 の温度で、任意にマイクロ波加熱下における、式 L I の化合物と、4 - イソキサゾールボロン酸又は 4 - イソキサゾールボロン酸ピナコールエステルとの反応により、式 L V I の化合物 (ここで、R_{2b}、Z₁ 及び A₁ は、上記の式 I に記載されているとおりである) がもたらされる。ジメチルスルホキシド DMSO 又はメタノールなどの不活性溶剤中、20 ~ 150 の温度で、任意にマイクロ波加熱下における、式 L V I の化合物と、フッ化カリウム KF 水溶液 (0.5 ~ 3 M、好ましくは 1 M の濃度) との反応により、式 L I I I の化合物 (ここで、R_{2b}、Z₁ 及び A₁ は、上記のとおりである) がもたらされる。このような化学反応は、例えば、J. Am. Chem. Soc. 2011, 133, 6948 - 6951 といった文献に記載されている。

30

40

50

【0111】

式L I I Iの化合物(ここで、 R_{2b} 、 Z_1 及び A_1 は、上記の式Iに記載されているとおりである)は、水素化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム K_2CO_3 、又は炭酸セシウム Cs_2CO_3 などの塩基の存在下、 N,N -ジメチルホルムアミド(DMF)、アセトン、又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中、 $0\sim 120$ の温度で、式L Vの化合物(ここで、 X_{06} は、ハロゲン(好ましくは塩素、臭素又はヨウ素)などの脱離基である)でさらに処理されて、式L I Vの化合物(ここで、 R_{2b} 、 Z_1 及び A_1 は、上記の式Iに記載されているとおりである)が得られる。或いは、式L I Vの化合物は、 $Pd_2(dba)_3$ などの触媒の存在下、BINAPなどのリガンド、リチウムヘキサメチルジシラザンLiHMDSなどの強塩基と共に、テトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、 $30\sim 80$ の温度での、式L I Iの化合物による処理により、式L Iの化合物から直接調製され得る。このような化学反応は、例えば、*J. Am. Chem. Soc.* 127(45), 15824-15832, 2005に記載されている。式L Iの化合物から式L I Vの化合物を調製するためのさらに別の方法は、スキーム18に示されている。炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム、又は水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド又はエトキシド、カリウムtert-ブトキシドなどの塩基の存在下、任意にパラジウム(例えば、 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ を含む)又は銅(例えば、CuIを含む)触媒反応下、例えばトルエン、ジオキサン、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、 N,N -ジメチルホルムアミド、 N,N -ジメチルアセトアミド、 N -メチル-2-ピロリドンNMP又はジメチルスルホキシド(DMSO)などの適切な溶剤中、任意に例えばテトラブチルアンモニウムブロミド又はトリエチルベンジルアンモニウムクロリドTEBACなどの相間移動触媒PTCの存在下、室温 ~ 180 の温度での、式L Iの化合物(ここで、 R_{2b} 、 Z_1 及び A_1 は、上記の式Iに記載されているとおりであり、及び X_{07} は、例えばハロゲン又はスルホネート、好ましくは塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメタンスルホネートといった脱離基である)と、式L V Iの試薬(ここで、 Z_2 は、 $C_1\sim C_4$ アルキルである)との反応により、式L V I I Iの化合物(ここで、 R_{2b} 、 Z_1 、 Z_2 及び A_1 は、上記のとおりである)が得られる。式L V I I Iの化合物は、湿潤DMSO中での加熱などの条件を用いて、任意に塩化リチウム又は塩化ナトリウムの存在下、 $50\sim 180$ の温度で、脱炭酸され得る。同様の化学反応が、例えば、*Synthesis* 2010, No. 19, 3332-3338に記載されている。

【0112】

式I fの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_{5c} 、 A_1 、及び A_2)を調製するための別の方法は、スキーム19において概説されている。

【0113】

スキーム19:

10

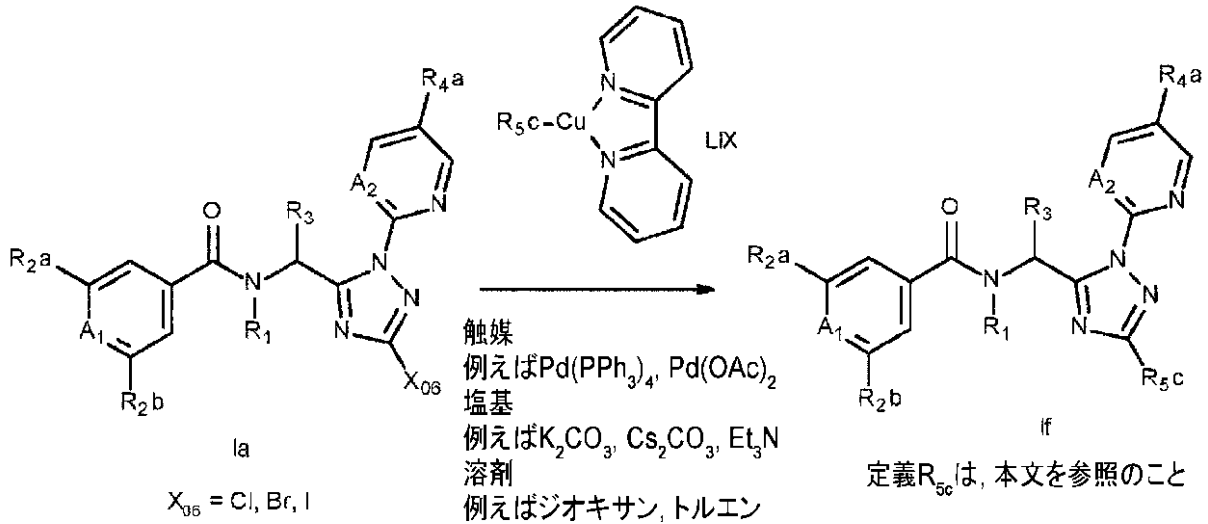
20

30

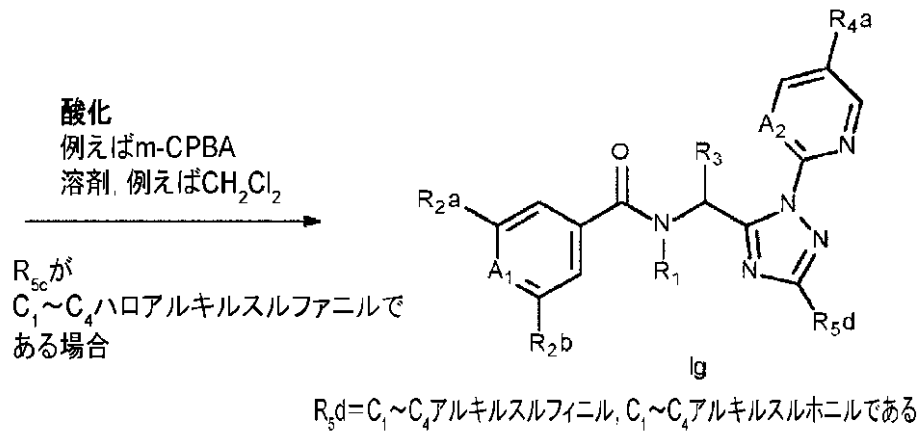
40

50

【化 2 9】



10



20

式 I f の化合物（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、A₁、及び A₂は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{5c}は、ジフェニルメタンイミン、C₁~C₄ハロアルキルスルファニル、C₃~C₄ハロシクロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニルである）は、式 I a の化合物（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、A₁、A₂及び X₀₆は既に記載されている）と、式 L I X の化合物（ここで、R_{5c}は上記のとおりである）との反応により調製され得る（スキーム 6 も参照のこと）。この反応は、例えば、Pd(PPh₃)₄ といったパラジウム触媒の存在下、ジオキサン又はトルエンなどの好適な溶剤中、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常は室温~200 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下において行われる。このようなプロセスは、例えば、Angew. Chem. 2011, 50, 7312 において既に記載されている。R_{5c}が C₁~C₄ハロアルキルスルファニルである場合、式 I f の化合物は、通常は室温~反応混合物の沸点の温度での加熱下において、m-CPBA などの酸化剤により酸化されて、化合物 I g（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、A₁、及び A₂は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{5d}は、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニルである）が得られる。このようなプロセスは、例えば、国際公開第 20100063063 号において既に記載されている。

30

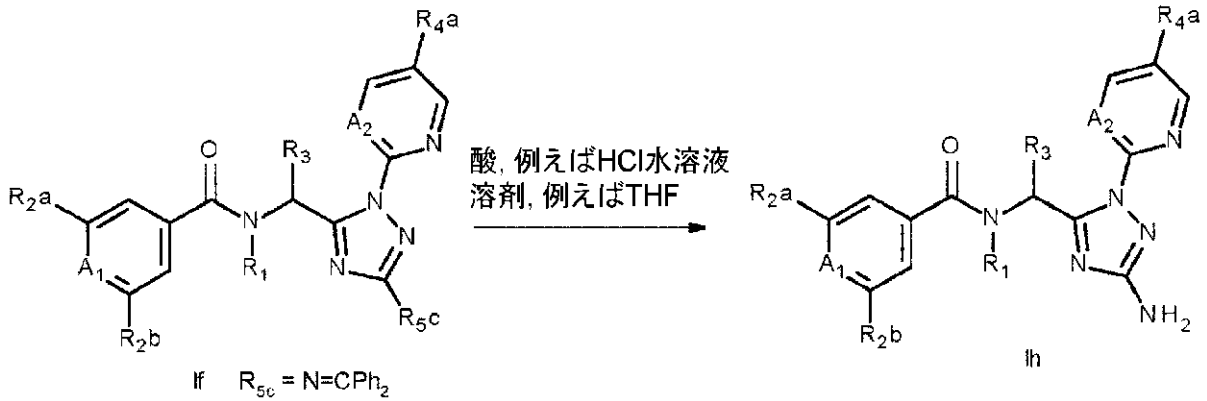
40

【0114】

スキーム 20 :

50

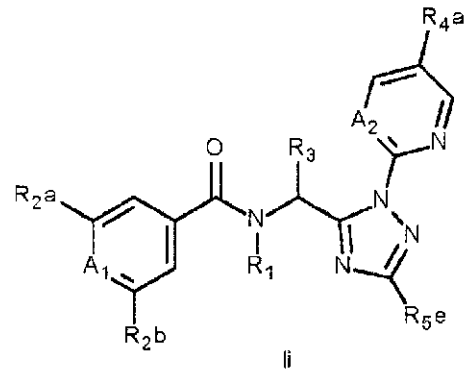
【化 3 0】



10

標準的なアルキル化
 又は
 アシル化
 又は
 スルホニル化方法

定義 R_{5e} は、本文を参照のこと



20

式 I i の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び R_{5e} は、（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）アミノ、（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）スルホニルアミノ、（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）スルホニル（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）アミノ、（ $C_1 \sim C_3$ アルキル） $C(O)(C_1 \sim C_3$ アルキル)N 又は（ $C_1 \sim C_3$ アルキル） $C(O)NH$ である）は、当業者に周知の合成方法により調製され得る。

30

【0115】

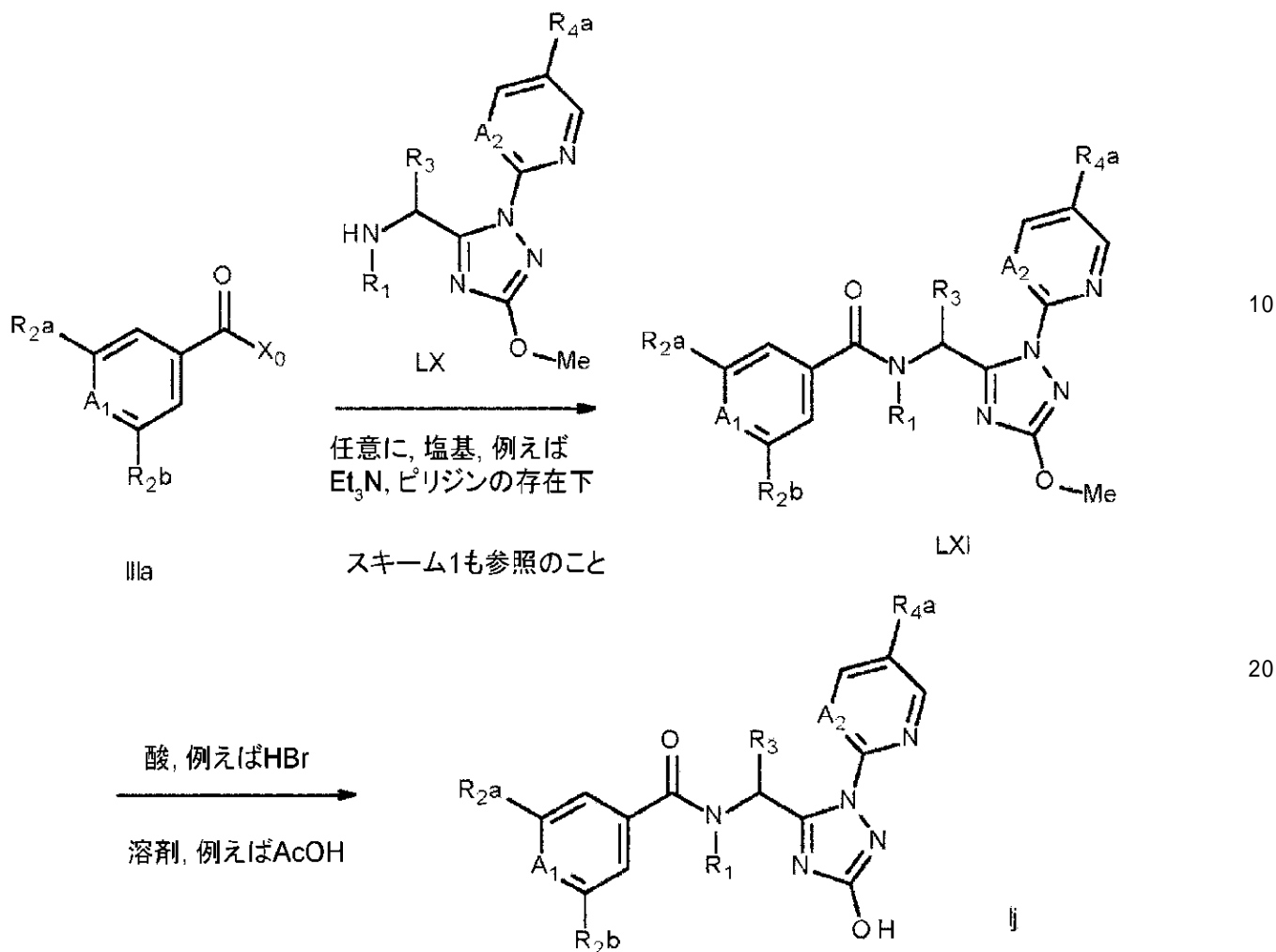
式 I h の化合物（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 及び A_2 は上記に定義されているとおりである）は、化合物 I f（ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 及び A_2 は上記に定義されているとおりであり、及び、 R_{5c} はジフェニルメタンイミンである）の変換により調製可能である。この反応は、THF などの好適な溶剤中、塩化水素又はクエン酸などの酸の存在下、通常は室温～200 の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度での加熱下において実施される。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2018067432号、又は、Eur. J. Med. Chem., 2018, 144, 151-163において既に記載されている。

【0116】

スキーム 21 :

40

【化 3 1】



式 I j の化合物（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃及びR_{4a}、A₁、及びA₂は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、酢酸を含み得る好適な溶剤中、通常は室温～200 の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度での加熱下における、LXIの化合物（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃及びR_{4a}、A₁、及びA₂は、上記に定義されているとおりである）と、例えばHBrなどの酸との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2017090743号において既に記載されている。式LXIの化合物（ここで、R₁、R_{2a}、R_{2b}、R₃、R_{4a}、A₁、及びA₂は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、ピリジン、DMF、アセトニトリル、CH₂Cl₂又はTHFを含み得る好適な不活性溶剤中、任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下、通常は室温～200 の温度での加熱下における、式LXの化合物（ここで、R₁、R₃、R_{4a}、及びA₂は、上記に定義されていると

式IIIaの化合物（ここで、A₁、R_{2a}、R_{2b}及びX₀は、上記に定義されているとおりである）（スキーム1も参照のこと）との反応により調製され得る。

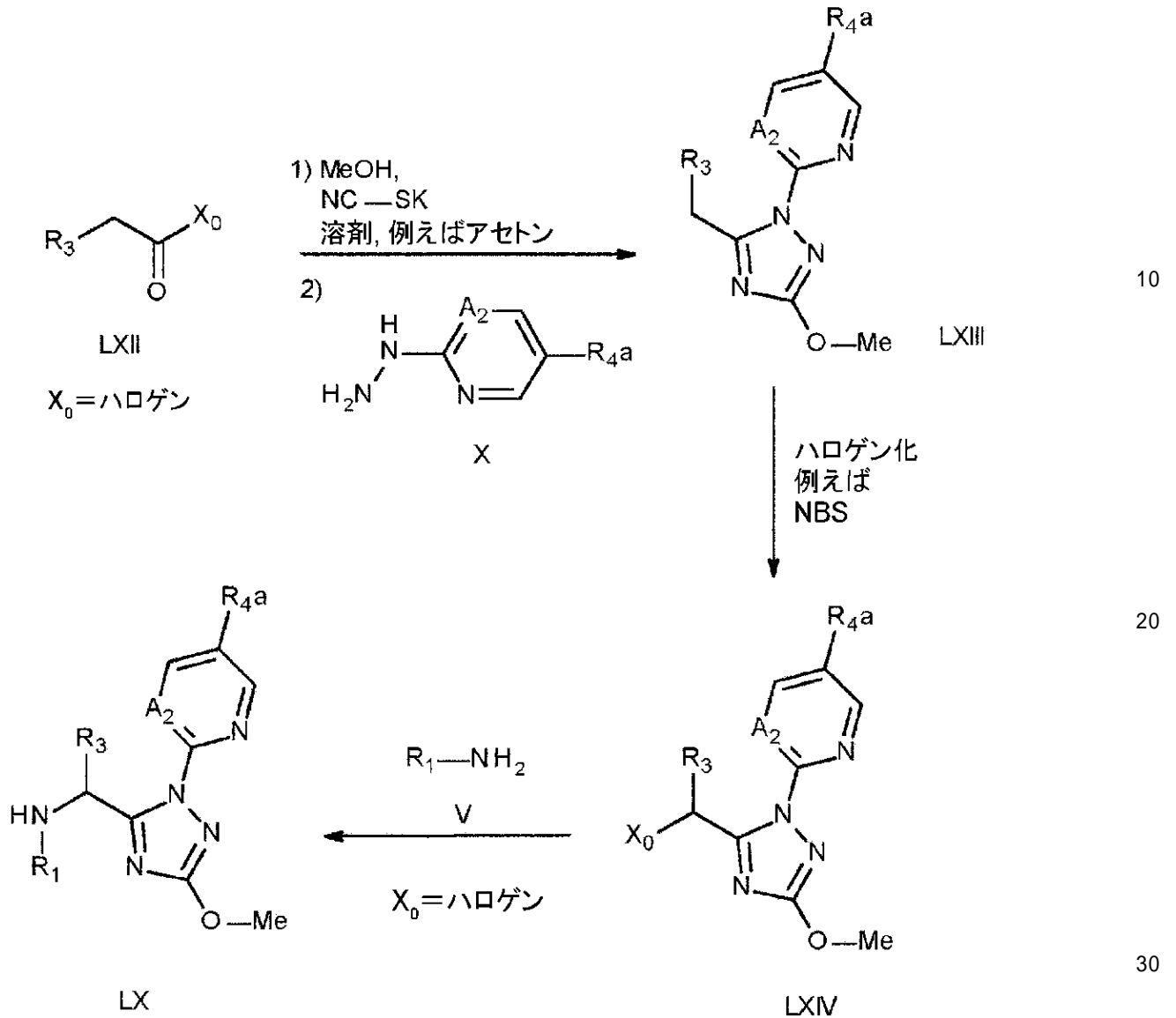
【0117】

式LXの中間体（ここで、R₁、R₃、R_{4a}及びA₂は、上記に定義されているとおりである）は、スキーム22に示されているプロセスによって調製され得る。

【0118】

スキーム22：

【化 3 2】



例えば、式 LX の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_{4a} 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、アセトニトリル又はジオキサンを含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム）などの好適な塩基の存在下、通常は室温～200 の温度、好ましくは 40～反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 LXIV の化合物（ここで、 R_3 、 R_{4a} 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_0 は、ハロゲンである）と、式 V の化合物（ここで、 R_1 は、式 I において定義されている）との反応により調製され得る。

【0119】

式 LXIV の化合物（ここで、 R_3 、 R_{4a} 、 A_2 、及び X_0 は、上記に定義されているとおりである）は、例えば、 CH_2Cl_2 を含み得る好適な溶剤中、過酸化ベンゾイルなどの好適な活性化因子の存在下、通常は室温～200 の温度、好ましくは 20～反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意に白色光灯（230V）下における、例えば、N-ブromo-スクシンイミドなどのハロゲン化剤による、式 LXIII の化合物（ここで、 R_3 、 R_{4a} 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである）のハロゲン化により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、独国特許第 1962429 号明細書において既に記載されている。

【0120】

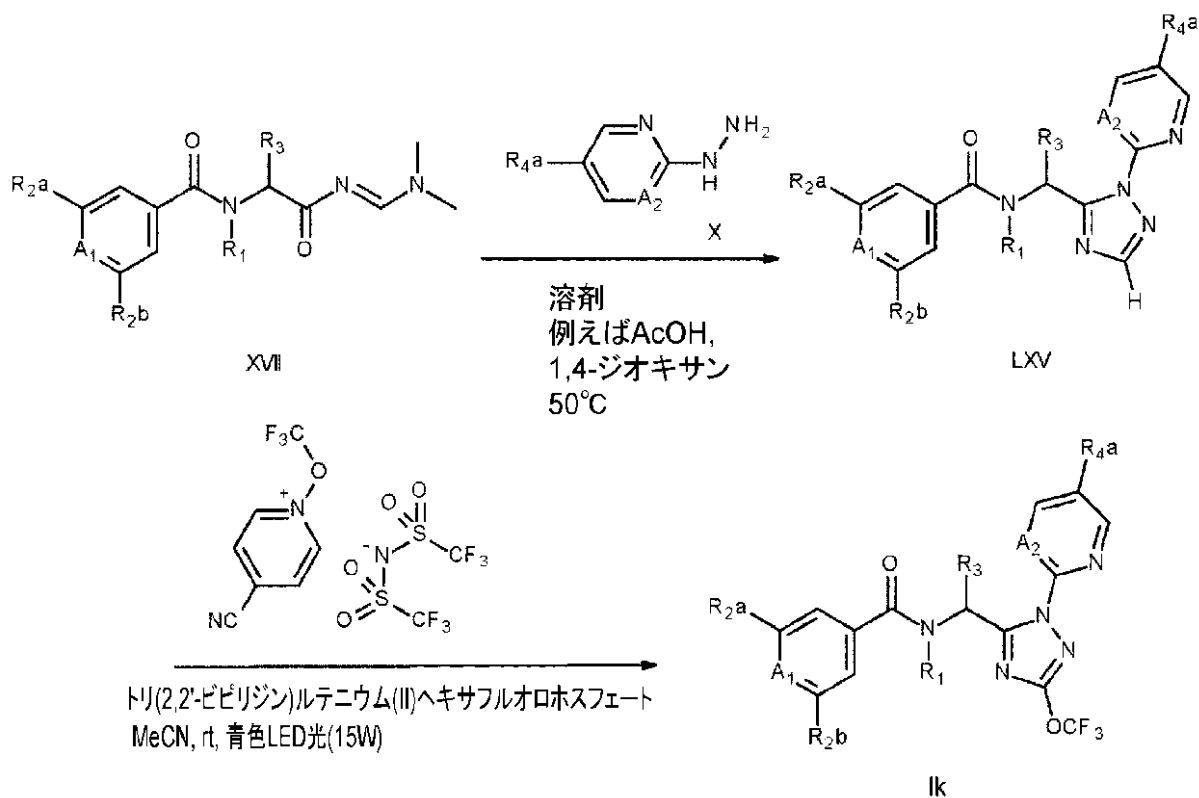
式LXIIIの化合物(ここで、 R_3 、 R_{4a} 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)は、アセトンなどの好適な溶剤中、通常は室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式LXIIIの化合物(ここで、 R_3 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_0 は、例えば臭素、塩素又はヨウ素などのハロゲンである)と、チオシアン酸カリウム及びメタノールとの反応により、2工程で調製され得る。次に、得られた中間体は、第2の工程において、例えばエタノールなどの好適な溶剤中、通常は室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下において、式Xの化合物(ここで、 R_{4a} 及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)と結合されて、式LXIIIの化合物が得られる。

10

【0121】

スキーム23.

【化33】



20

30

スキーム23に従って、式Ikの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)は、アセトニトリルなどの不活性溶剤中、トリス(2,2'-ピピリジン)ルテニウム(III)ヘキサフルオロホスフェートなどの光酸化還元触媒と共に、青色LED光(15W)の照射下、及び1-(トリフルオロメトキシ)ピリジン-4-カルボニトリル; 1,1,1-トリフルオロ-N(トリフルオロメチルスルホニル)メタンスルホンアミドなどのトリフルオロフルオロメトキシ転移試薬の存在下で、化合物LXV(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} は、上記に定義されているとおりである)の処理によって調製され得る。このような反応は、20で実施され、例えば、Ang. Chem., 2018, 57(42), 13784-13789といった文献において記載されている。

40

【0122】

式LXVの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、式Iにおいて定義されるとおりである)は、例えば酢酸及び1,4-ジオキサンの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常は室温~120の温度、好ましくは40~反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意にマイクロ波加熱条件下における、式XVIIの化合物(ここで

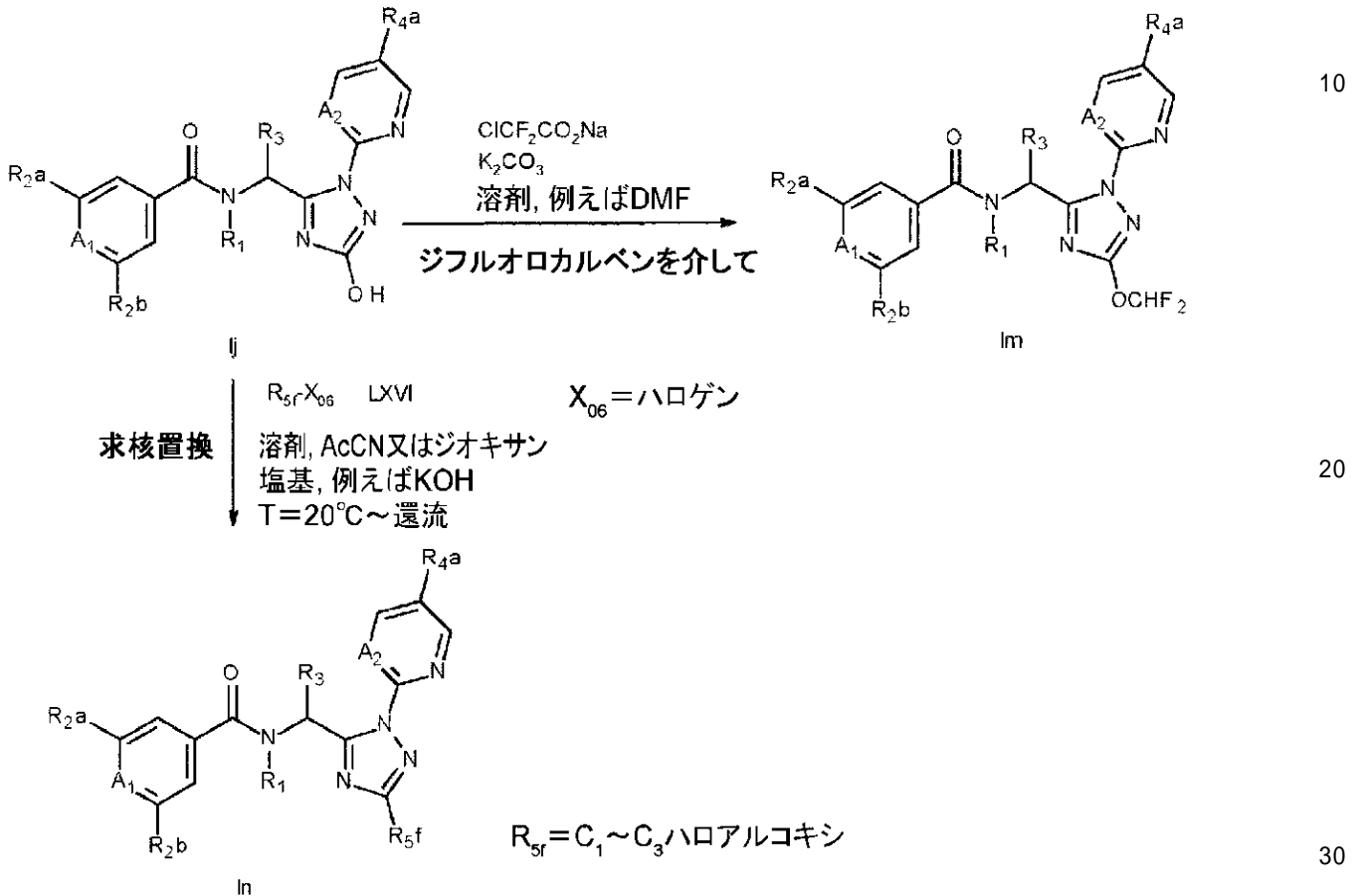
50

、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、及び A_1 は、式Iにおいて定義される)と、式Xの化合物(ここで、 A_2 及び R_{4a} は、式Iにおいて定義されている)との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750において既に記載されている。

【0123】

スキーム24:

【化34】



スキーム24に従って、式Imの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)は、KOH又は炭酸カリウムなどの塩基の存在下、不活性溶剤中、20~80の温度での、例えば $\text{ClCF}_2\text{CO}_2\text{Na}$ 又は $\text{CF}_2\text{SO}_2\text{OCHF}_2$ といったジフルオロカルベン源による処理により、式Ijの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 、 R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)から調製され得る。このような手順は、例えば、J. Fluor. Chem. 2017, 203, 155、及び米国特許出願公開第2013/0225552号明細書、第128ページ、及びOrg. Process Res. Dev., 2011, 15, 721に記載されている。

【0124】

式Ijの化合物(ここで、 R_1 、 R_{2a} 、 R_{2b} 、 R_3 及び R_{4a} 、 A_1 、及び A_2 は、上記に定義されているとおりである)は、例えば炭酸セシウム又は炭酸カリウムといった塩基の存在下、アセトニトリル又はDMFなどの溶剤中、20~80の温度で、式LXVIの化合物でハロアルキル化されて、式Imの化合物(ここで、 X_{06} は、Cl、Br、Iなどのハロゲンを表し; 及び R_{5f} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルコキシである)が得られる。このような反応は、当業者に周知であり、例えば、Med. Chem. Letts., 2017, 8(5), p543-548及びBio. Med. Chem. Letts., 2017, 27(11), 2420-2423において報告されている。

【0125】

手法又は反応条件に応じて、反応体を塩基の存在下で反応させることが可能である。好適な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属ジアルキルアミド又はアルカリ金属又はアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離又はN-アルキル化飽和又は不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

10

【0126】

反応剤は、そのまま、すなわち溶媒又は希釈剤を加えずに互いに反応され得る。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶媒又は希釈剤又はこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリン又はN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒又は希釈剤としても働き得る。

20

【0127】

反応は、約-80 ~ 約+140、好ましくは約-30 ~ 約+100の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約+80の範囲で行われるのが有利である。

【0128】

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基は、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

30

【0129】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

【0130】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理によって遊離化合物Iの酸付加塩に、且つ例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

【0131】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中において、例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転化され得る。

40

【0132】

手順又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が、遊離形態又は塩の形態で得られる。

【0133】

式Iの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態若しくは塩形態において、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて、且つ/又は分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び/若しくはジアステレオマ

50

ーなどの純粋な異性体の形態において、或いは鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物又はラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能なすべての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

【0134】

式Iの化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、いずれの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態において、例えば分別結晶化、蒸留及び/又はクロマトグラフィにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

10

【0135】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィ、例えば好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィ(HPLC)により、例えば1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、又はジアステレオマー塩への転化により、例えば塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばショウノウ酸、酒石酸又はリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を例えば異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることにより、光学対掌体に分解され得る。

20

【0136】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従い、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法、例えば立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによっても得られる。

【0137】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式Iの化合物を好適な酸化剤、例えばH₂O₂/尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32(12), 2561-73, 1989又は国際公開第2000/15615号といった文献から公知である。

30

【0138】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体又はジアステレオマー又は異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物又はジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

【0139】

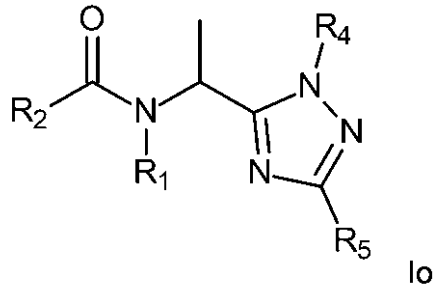
式Iの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態において、必要に応じて水和物の形態において得ることもでき、且つ/又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

【0140】

以下の表A-1~A-297に係る式Iの化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下の実施例は、本発明を例示すると共に、好ましい式Iの化合物を式I_oの化合物の形態で示すことが意図されている。

40

【化 3 5】

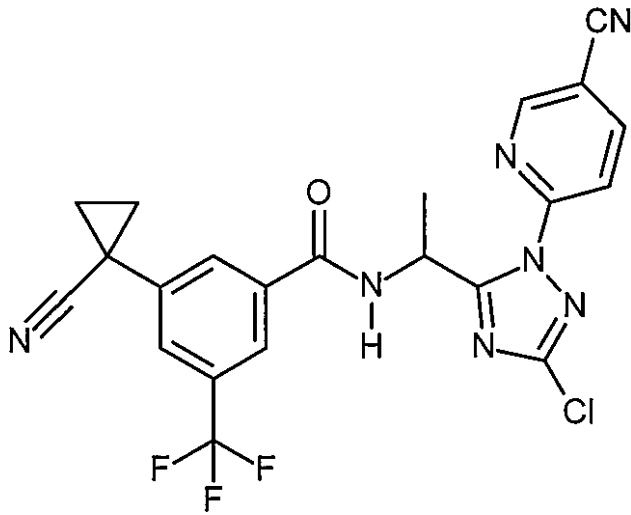


10

【 0 1 4 1】

表 A - 1 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 . 0 0 1 ~ A - 1 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はClであり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及び、R₂は表 Z において定義されているとおりである。例えば、A - 1 . 0 0 2 は

【化 3 6】



20

30

である。

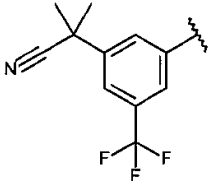
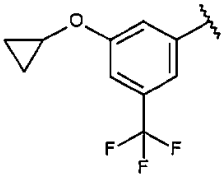
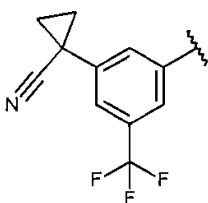
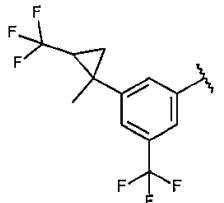
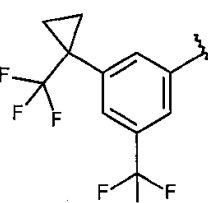
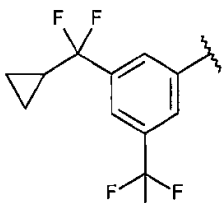
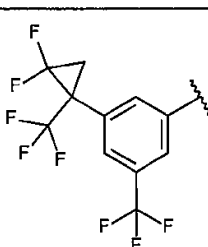
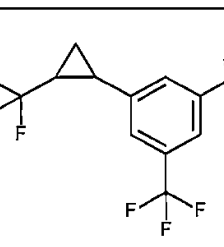
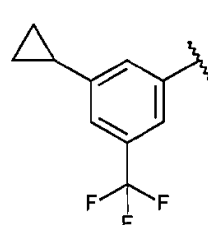
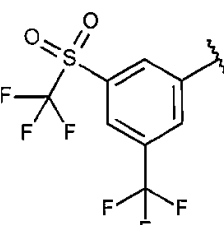
【 0 1 4 2】

40

50

【表 1 - 1】

表 Z: R₂ の置換基定義:

索引	R ₂	索引	R ₂
1		8	
2		9	
3		10	
4		11	
5		12	

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

索引	R ₂	索引	R ₂
6		13	
7		14	

10

20

【0143】

表 A - 2 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 . 001 ~ A - 2 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0144】

表 A - 3 は、14 種の式 I o の化合物 A - 3 . 001 ~ A - 3 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0145】

表 A - 4 は、14 種の式 I o の化合物 A - 4 . 001 ~ A - 4 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0146】

表 A - 5 は、14 種の式 I o の化合物 A - 5 . 001 ~ A - 5 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0147】

表 A - 6 は、14 種の式 I o の化合物 A - 6 . 001 ~ A - 6 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0148】

表 A - 7 は、14 種の式 I o の化合物 A - 7 . 001 ~ A - 7 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は Cl であり、R₄ は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

50

【 0 1 4 9 】

表 A - 8 は、14種の式 I o の化合物 A - 8 . 0 0 1 ~ A - 8 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はClであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 0 】

表 A - 9 は、14種の式 I o の化合物 A - 9 . 0 0 1 ~ A - 9 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はClであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 1 】

表 A - 10 は、14種の式 I o の化合物 A - 10 . 0 0 1 ~ A - 10 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。 10

【 0 1 5 2 】

表 A - 11 は、14種の式 I o の化合物 A - 11 . 0 0 1 ~ A - 11 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 3 】

表 A - 12 は、14種の式 I o の化合物 A - 12 . 0 0 1 ~ A - 12 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。 20

【 0 1 5 4 】

表 A - 13 は、14種の式 I o の化合物 A - 13 . 0 0 1 ~ A - 13 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 5 】

表 A - 14 は、14種の式 I o の化合物 A - 14 . 0 0 1 ~ A - 14 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。 30

【 0 1 5 6 】

表 A - 15 は、14種の式 I o の化合物 A - 15 . 0 0 1 ~ A - 15 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 7 】

表 A - 16 は、14種の式 I o の化合物 A - 16 . 0 0 1 ~ A - 16 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。 40

【 0 1 5 8 】

表 A - 17 は、14種の式 I o の化合物 A - 17 . 0 0 1 ~ A - 17 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 9 】

表 A - 18 は、14種の式 I o の化合物 A - 18 . 0 0 1 ~ A - 18 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。 50

【0160】

表A-19は、14種の式I oの化合物A-19.001~A-19.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0161】

表A-20は、14種の式I oの化合物A-20.001~A-20.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0162】

表A-21は、14種の式I oの化合物A-21.001~A-21.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0163】

表A-22は、14種の式I oの化合物A-22.001~A-22.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0164】

表A-23は、14種の式I oの化合物A-23.001~A-23.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0165】

表A-24は、14種の式I oの化合物A-24.001~A-24.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0166】

表A-25は、14種の式I oの化合物A-25.001~A-25.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0167】

表A-26は、14種の式I oの化合物A-26.001~A-26.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0168】

表A-27は、14種の式I oの化合物A-27.001~A-27.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0169】

表A-28は、14種の式I oの化合物A-28.001~A-28.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0170】

表A-29は、14種の式I oの化合物A-29.001~A-29.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

50

ある。

【0171】

表A-30は、14種の式I oの化合物A-30.001~A-30.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0172】

表A-31は、14種の式I oの化合物A-31.001~A-31.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0173】

表A-32は、14種の式I oの化合物A-32.001~A-32.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0174】

表A-33は、14種の式I oの化合物A-33.001~A-33.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0175】

表A-34は、14種の式I oの化合物A-34.001~A-34.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0176】

表A-35は、14種の式I oの化合物A-35.001~A-35.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0177】

表A-36は、14種の式I oの化合物A-36.001~A-36.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0178】

表A-37は、14種の式I oの化合物A-37.001~A-37.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0179】

表A-38は、14種の式I oの化合物A-38.001~A-38.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0180】

表A-39は、14種の式I oの化合物A-39.001~A-39.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0181】

表A-40は、14種の式I oの化合物A-40.001~A-40.014を提供する

50

ものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0182】

表A-41は、14種の式I oの化合物A-41.001~A-41.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0183】

表A-42は、14種の式I oの化合物A-42.001~A-42.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0184】

表A-43は、14種の式I oの化合物A-43.001~A-43.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0185】

表A-44は、14種の式I oの化合物A-44.001~A-44.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0186】

表A-45は、14種の式I oの化合物A-45.001~A-45.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は NHCH_3 であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0187】

表A-46は、14種の式I oの化合物A-46.001~A-46.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、 R_4 は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0188】

表A-47は、14種の式I oの化合物A-47.001~A-47.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0189】

表A-48は、14種の式I oの化合物A-48.001~A-48.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0190】

表A-49は、14種の式I oの化合物A-49.001~A-49.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0191】

表A-50は、14種の式I oの化合物A-50.001~A-50.014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(2,

50

2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0192】

表 A - 51 は、14 種の式 I o の化合物 A - 51 . 001 ~ A - 51 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0193】

表 A - 52 は、14 種の式 I o の化合物 A - 52 . 001 ~ A - 52 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0194】

表 A - 53 は、14 種の式 I o の化合物 A - 53 . 001 ~ A - 53 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0195】

表 A - 54 は、14 種の式 I o の化合物 A - 54 . 001 ~ A - 54 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0196】

表 A - 55 は、14 種の式 I o の化合物 A - 55 . 001 ~ A - 55 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0197】

表 A - 56 は、14 種の式 I o の化合物 A - 56 . 001 ~ A - 56 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0198】

表 A - 57 は、14 種の式 I o の化合物 A - 57 . 001 ~ A - 57 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0199】

表 A - 58 は、14 種の式 I o の化合物 A - 58 . 001 ~ A - 58 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0200】

表 A - 59 は、14 種の式 I o の化合物 A - 59 . 001 ~ A - 59 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0201】

表 A - 60 は、14 種の式 I o の化合物 A - 60 . 001 ~ A - 60 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定

50

義されているとおりである。

【0202】

表A-61は、14種の式I oの化合物A-61.001~A-61.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0203】

表A-62は、14種の式I oの化合物A-62.001~A-62.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

10

【0204】

表A-63は、14種の式I oの化合物A-63.001~A-63.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0205】

表A-64は、14種の式I oの化合物A-64.001~A-64.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

20

【0206】

表A-65は、14種の式I oの化合物A-65.001~A-65.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0207】

表A-66は、14種の式I oの化合物A-66.001~A-66.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

30

【0208】

表A-67は、14種の式I oの化合物A-67.001~A-67.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0209】

表A-68は、14種の式I oの化合物A-68.001~A-68.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

40

【0210】

表A-69は、14種の式I oの化合物A-69.001~A-69.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0211】

表A-70は、14種の式I oの化合物A-70.001~A-70.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

50

【0212】

表A-71は、14種の式I oの化合物A-71.001~A-71.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0213】

表A-72は、14種の式I oの化合物A-72.001~A-72.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0214】

表A-73は、14種の式I oの化合物A-73.001~A-73.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0215】

表A-74は、14種の式I oの化合物A-74.001~A-74.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0216】

表A-75は、14種の式I oの化合物A-75.001~A-75.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0217】

表A-76は、14種の式I oの化合物A-76.001~A-76.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0218】

表A-77は、14種の式I oの化合物A-77.001~A-77.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0219】

表A-78は、14種の式I oの化合物A-78.001~A-78.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0220】

表A-79は、14種の式I oの化合物A-79.001~A-79.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0221】

表A-80は、14種の式I oの化合物A-80.001~A-80.014を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0222】

表A-81は、14種の式I oの化合物A-81.001~A-81.014を提供する

50

ものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2HF_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0223】

表A - 82は、14種の式I oの化合物A - 82 . 001 ~ A - 82 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0224】

表A - 83は、14種の式I oの化合物A - 83 . 001 ~ A - 83 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0225】

表A - 84は、14種の式I oの化合物A - 84 . 001 ~ A - 84 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0226】

表A - 85は、14種の式I oの化合物A - 85 . 001 ~ A - 85 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0227】

表A - 86は、14種の式I oの化合物A - 86 . 001 ~ A - 86 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0228】

表A - 87は、14種の式I oの化合物A - 87 . 001 ~ A - 87 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0229】

表A - 88は、14種の式I oの化合物A - 88 . 001 ~ A - 88 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0230】

表A - 89は、14種の式I oの化合物A - 89 . 001 ~ A - 89 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0231】

表A - 90は、14種の式I oの化合物A - 90 . 001 ~ A - 90 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CF_3 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0232】

表A - 91は、14種の式I oの化合物A - 91 . 001 ~ A - 91 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OC_2CHF_2 であり、 R_4 は(5 - シア

50

ノ - 2 - ピリジル) であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0233】

表 A - 92 は、14 種の式 I o の化合物 A - 92 . 001 ~ A - 92 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0234】

表 A - 93 は、14 種の式 I o の化合物 A - 93 . 001 ~ A - 93 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。 10

【0235】

表 A - 94 は、14 種の式 I o の化合物 A - 94 . 001 ~ A - 94 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0236】

表 A - 95 は、14 種の式 I o の化合物 A - 95 . 001 ~ A - 95 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。 20

【0237】

表 A - 96 は、14 種の式 I o の化合物 A - 96 . 001 ~ A - 96 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0238】

表 A - 97 は、14 種の式 I o の化合物 A - 97 . 001 ~ A - 97 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。 30

【0239】

表 A - 98 は、14 種の式 I o の化合物 A - 98 . 001 ~ A - 98 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0240】

表 A - 99 は、14 種の式 I o の化合物 A - 99 . 001 ~ A - 99 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は H であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。 40

【0241】

表 A - 100 は、14 種の式 I o の化合物 A - 100 . 001 ~ A - 100 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0242】

表 A - 101 は、14 種の式 I o の化合物 A - 101 . 001 ~ A - 101 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。 50

【0243】

表 A - 102 は、14種の式 I o の化合物 A - 102 . 001 ~ A - 102 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0244】

表 A - 103 は、14種の式 I o の化合物 A - 103 . 001 ~ A - 103 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0245】

表 A - 104 は、14種の式 I o の化合物 A - 104 . 001 ~ A - 104 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0246】

表 A - 105 は、14種の式 I o の化合物 A - 105 . 001 ~ A - 105 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0247】

表 A - 106 は、14種の式 I o の化合物 A - 106 . 001 ~ A - 106 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0248】

表 A - 107 は、14種の式 I o の化合物 A - 107 . 001 ~ A - 107 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0249】

表 A - 108 は、14種の式 I o の化合物 A - 108 . 001 ~ A - 108 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はClであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0250】

表 A - 109 は、14種の式 I o の化合物 A - 109 . 001 ~ A - 109 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0251】

表 A - 110 は、14種の式 I o の化合物 A - 110 . 001 ~ A - 110 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0252】

表 A - 111 は、14種の式 I o の化合物 A - 111 . 001 ~ A - 111 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0253】

50

表 A - 1 1 2 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 2 . 0 0 1 ~ A - 1 1 2 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0254】

表 A - 1 1 3 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 3 . 0 0 1 ~ A - 1 1 3 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0255】

表 A - 1 1 4 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 4 . 0 0 1 ~ A - 1 1 4 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0256】

表 A - 1 1 5 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 5 . 0 0 1 ~ A - 1 1 5 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0257】

表 A - 1 1 6 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 6 . 0 0 1 ~ A - 1 1 6 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0258】

表 A - 1 1 7 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 7 . 0 0 1 ~ A - 1 1 7 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0259】

表 A - 1 1 8 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 8 . 0 0 1 ~ A - 1 1 8 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0260】

表 A - 1 1 9 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 1 9 . 0 0 1 ~ A - 1 1 9 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0261】

表 A - 1 2 0 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 2 0 . 0 0 1 ~ A - 1 2 0 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0262】

表 A - 1 2 1 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 2 1 . 0 0 1 ~ A - 1 2 1 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0263】

表 A - 1 2 2 は、14 種の式 I o の化合物 A - 1 2 2 . 0 0 1 ~ A - 1 2 2 . 0 1 4 を提

10

20

30

40

50

供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0264】

表A-123は、14種の式Iの化合物A-123.001~A-123.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0265】

表A-124は、14種の式Iの化合物A-124.001~A-124.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0266】

表A-125は、14種の式Iの化合物A-125.001~A-125.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0267】

表A-126は、14種の式Iの化合物A-126.001~A-126.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0268】

表A-127は、14種の式Iの化合物A-127.001~A-127.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0269】

表A-128は、14種の式Iの化合物A-128.001~A-128.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0270】

表A-129は、14種の式Iの化合物A-129.001~A-129.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0271】

表A-130は、14種の式Iの化合物A-130.001~A-130.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0272】

表A-131は、14種の式Iの化合物A-131.001~A-131.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0273】

表A-132は、14種の式Iの化合物A-132.001~A-132.014を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5-(2

50

、2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0274】

表A-133は、14種の式I oの化合物A-133.001~A-133.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0275】

表A-134は、14種の式I oの化合物A-134.001~A-134.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0276】

表A-135は、14種の式I oの化合物A-135.001~A-135.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNH₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0277】

表A-136は、14種の式I oの化合物A-136.001~A-136.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0278】

表A-137は、14種の式I oの化合物A-137.001~A-137.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0279】

表A-138は、14種の式I oの化合物A-138.001~A-138.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0280】

表A-139は、14種の式I oの化合物A-139.001~A-139.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0281】

表A-140は、14種の式I oの化合物A-140.001~A-140.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0282】

表A-141は、14種の式I oの化合物A-141.001~A-141.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0283】

表A-142は、14種の式I oの化合物A-142.001~A-142.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定

50

義されているとおりである。

【0284】

表A-143は、14種の式I oの化合物A-143.001~A-143.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0285】

表A-144は、14種の式I oの化合物A-144.001~A-144.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

10

【0286】

表A-145は、14種の式I oの化合物A-145.001~A-145.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0287】

表A-146は、14種の式I oの化合物A-146.001~A-146.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

20

【0288】

表A-147は、14種の式I oの化合物A-147.001~A-147.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0289】

表A-148は、14種の式I oの化合物A-148.001~A-148.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

30

【0290】

表A-149は、14種の式I oの化合物A-149.001~A-149.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0291】

表A-150は、14種の式I oの化合物A-150.001~A-150.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

40

【0292】

表A-151は、14種の式I oの化合物A-151.001~A-151.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

【0293】

表A-152は、14種の式I oの化合物A-152.001~A-152.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されていると

50

【0294】

表A-153は、14種の式I oの化合物A-153.001~A-153.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0295】

表A-154は、14種の式I oの化合物A-154.001~A-154.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0296】

表A-155は、14種の式I oの化合物A-155.001~A-155.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0297】

表A-156は、14種の式I oの化合物A-156.001~A-156.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0298】

表A-157は、14種の式I oの化合物A-157.001~A-157.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0299】

表A-158は、14種の式I oの化合物A-158.001~A-158.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0300】

表A-159は、14種の式I oの化合物A-159.001~A-159.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0301】

表A-160は、14種の式I oの化合物A-160.001~A-160.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0302】

表A-161は、14種の式I oの化合物A-161.001~A-161.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0303】

表A-162は、14種の式I oの化合物A-162.001~A-162.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0304】

50

表 A - 163 は、14 種の式 I o の化合物 A - 163 . 001 ~ A - 163 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0305】

表 A - 164 は、14 種の式 I o の化合物 A - 164 . 001 ~ A - 164 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0306】

表 A - 165 は、14 種の式 I o の化合物 A - 165 . 001 ~ A - 165 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0307】

表 A - 166 は、14 種の式 I o の化合物 A - 166 . 001 ~ A - 166 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0308】

表 A - 167 は、14 種の式 I o の化合物 A - 167 . 001 ~ A - 167 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0309】

表 A - 168 は、14 種の式 I o の化合物 A - 168 . 001 ~ A - 168 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0310】

表 A - 169 は、14 種の式 I o の化合物 A - 169 . 001 ~ A - 169 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0311】

表 A - 170 は、14 種の式 I o の化合物 A - 170 . 001 ~ A - 170 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリジン - 2 - イル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0312】

表 A - 171 は、14 種の式 I o の化合物 A - 171 . 001 ~ A - 171 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0313】

表 A - 172 は、14 種の式 I o の化合物 A - 172 . 001 ~ A - 172 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0314】

表 A - 173 は、14 種の式 I o の化合物 A - 173 . 001 ~ A - 173 . 014 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 -

50

(トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0315】

表A - 174は、14種の式I oの化合物A - 174 . 001 ~ A - 174 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0316】

表A - 175は、14種の式I oの化合物A - 175 . 001 ~ A - 175 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0317】

表A - 176は、14種の式I oの化合物A - 176 . 001 ~ A - 176 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0318】

表A - 177は、14種の式I oの化合物A - 177 . 001 ~ A - 177 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0319】

表A - 178は、14種の式I oの化合物A - 178 . 001 ~ A - 178 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0320】

表A - 179は、14種の式I oの化合物A - 179 . 001 ~ A - 179 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0321】

表A - 180は、14種の式I oの化合物A - 180 . 001 ~ A - 180 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0322】

表A - 181は、14種の式I oの化合物A - 181 . 001 ~ A - 181 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0323】

表A - 182は、14種の式I oの化合物A - 182 . 001 ~ A - 182 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0324】

表A - 183は、14種の式I oの化合物A - 183 . 001 ~ A - 183 . 014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されて

50

いるとおりである。

【0325】

表A-184は、14種の式I oの化合物A-184.001~A-184.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0326】

表A-185は、14種の式I oの化合物A-185.001~A-185.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0327】

表A-186は、14種の式I oの化合物A-186.001~A-186.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0328】

表A-187は、14種の式I oの化合物A-187.001~A-187.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0329】

表A-188は、14種の式I oの化合物A-188.001~A-188.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0330】

表A-189は、14種の式I oの化合物A-189.001~A-189.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0331】

表A-190は、14種の式I oの化合物A-190.001~A-190.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0332】

表A-191は、14種の式I oの化合物A-191.001~A-191.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0333】

表A-192は、14種の式I oの化合物A-192.001~A-192.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0334】

表A-193は、14種の式I oの化合物A-193.001~A-193.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにお

50

いて定義されているとおりである。

【0335】

表A-194は、14種の式I oの化合物A-194.001~A-194.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0336】

表A-195は、14種の式I oの化合物A-195.001~A-195.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0337】

表A-196は、14種の式I oの化合物A-196.001~A-196.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0338】

表A-197は、14種の式I oの化合物A-197.001~A-197.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0339】

表A-198は、14種の式I oの化合物A-198.001~A-198.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0340】

表A-199は、14種の式I oの化合物A-199.001~A-199.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0341】

表A-200は、14種の式I oの化合物A-200.001~A-200.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0342】

表A-201は、14種の式I oの化合物A-201.001~A-201.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0343】

表A-202は、14種の式I oの化合物A-202.001~A-202.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0344】

表A-203は、14種の式I oの化合物A-203.001~A-203.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

50

【0345】

表A-204は、14種の式I oの化合物A-204.001~A-204.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0346】

表A-205は、14種の式I oの化合物A-205.001~A-205.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0347】

表A-206は、14種の式I oの化合物A-206.001~A-206.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0348】

表A-207は、14種の式I oの化合物A-207.001~A-207.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はClであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0349】

表A-208は、14種の式I oの化合物A-208.001~A-208.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0350】

表A-209は、14種の式I oの化合物A-209.001~A-209.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0351】

表A-210は、14種の式I oの化合物A-210.001~A-210.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0352】

表A-211は、14種の式I oの化合物A-211.001~A-211.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0353】

表A-212は、14種の式I oの化合物A-212.001~A-212.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0354】

表A-213は、14種の式I oの化合物A-213.001~A-213.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0355】

50

表 A - 2 1 4 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 4 . 0 0 1 ~ A - 2 1 4 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 5 6 】

表 A - 2 1 5 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 5 . 0 0 1 ~ A - 2 1 5 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 5 7 】

表 A - 2 1 6 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 6 . 0 0 1 ~ A - 2 1 6 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 5 8 】

表 A - 2 1 7 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 7 . 0 0 1 ~ A - 2 1 7 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 5 9 】

表 A - 2 1 8 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 8 . 0 0 1 ~ A - 2 1 8 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 0 】

表 A - 2 1 9 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 1 9 . 0 0 1 ~ A - 2 1 9 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 1 】

表 A - 2 2 0 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 2 0 . 0 0 1 ~ A - 2 2 0 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 2 】

表 A - 2 2 1 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 2 1 . 0 0 1 ~ A - 2 2 1 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 3 】

表 A - 2 2 2 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 2 2 . 0 0 1 ~ A - 2 2 2 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 4 】

表 A - 2 2 3 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 2 3 . 0 0 1 ~ A - 2 2 3 . 0 1 4 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂ C y p であり、R₅は I であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 6 5 】

表 A - 2 2 4 は、14 種の式 I o の化合物 A - 2 2 4 . 0 0 1 ~ A - 2 2 4 . 0 1 4 を提

10

20

30

40

50

供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0366】

表A - 225は、14種の式I oの化合物A - 225 . 001 ~ A - 225 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0367】

表A - 226は、14種の式I oの化合物A - 226 . 001 ~ A - 226 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。 10

【0368】

表A - 227は、14種の式I oの化合物A - 227 . 001 ~ A - 227 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0369】

表A - 228は、14種の式I oの化合物A - 228 . 001 ~ A - 228 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。 20

【0370】

表A - 229は、14種の式I oの化合物A - 229 . 001 ~ A - 229 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0371】

表A - 230は、14種の式I oの化合物A - 230 . 001 ~ A - 230 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。 30

【0372】

表A - 231は、14種の式I oの化合物A - 231 . 001 ~ A - 231 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0373】

表A - 232は、14種の式I oの化合物A - 232 . 001 ~ A - 232 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。 40

【0374】

表A - 233は、14種の式I oの化合物A - 233 . 001 ~ A - 233 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、 R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0375】

表A - 234は、14種の式I oの化合物A - 234 . 001 ~ A - 234 . 014を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は[5 50

- (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0376】

表 A - 235 は、14 種の式 I o の化合物 A - 235 . 001 ~ A - 235 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0377】

表 A - 236 は、14 種の式 I o の化合物 A - 236 . 001 ~ A - 236 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0378】

表 A - 237 は、14 種の式 I o の化合物 A - 237 . 001 ~ A - 237 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0379】

表 A - 238 は、14 種の式 I o の化合物 A - 238 . 001 ~ A - 238 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0380】

表 A - 239 は、14 種の式 I o の化合物 A - 239 . 001 ~ A - 239 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0381】

表 A - 240 は、14 種の式 I o の化合物 A - 240 . 001 ~ A - 240 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0382】

表 A - 241 は、14 種の式 I o の化合物 A - 241 . 001 ~ A - 241 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0383】

表 A - 242 は、14 種の式 I o の化合物 A - 242 . 001 ~ A - 242 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0384】

表 A - 243 は、14 種の式 I o の化合物 A - 243 . 001 ~ A - 243 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、 R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0385】

表 A - 244 は、14 種の式 I o の化合物 A - 244 . 001 ~ A - 244 . 014 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cy_p であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R

50

4は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0386】

表A-245は、14種の式I oの化合物A-245.001~A-245.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0387】

表A-246は、14種の式I oの化合物A-246.001~A-246.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0388】

表A-247は、14種の式I oの化合物A-247.001~A-247.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0389】

表A-248は、14種の式I oの化合物A-248.001~A-248.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0390】

表A-249は、14種の式I oの化合物A-249.001~A-249.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0391】

表A-250は、14種の式I oの化合物A-250.001~A-250.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0392】

表A-251は、14種の式I oの化合物A-251.001~A-251.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0393】

表A-252は、14種の式I oの化合物A-252.001~A-252.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0394】

表A-253は、14種の式I oの化合物A-253.001~A-253.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0395】

表A-254は、14種の式I oの化合物A-254.001~A-254.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R

50

4は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0396】

表A-255は、14種の式I oの化合物A-255.001~A-255.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0397】

表A-256は、14種の式I oの化合物A-256.001~A-256.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0398】

表A-257は、14種の式I oの化合物A-257.001~A-257.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0399】

表A-258は、14種の式I oの化合物A-258.001~A-258.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0400】

表A-259は、14種の式I oの化合物A-259.001~A-259.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0401】

表A-260は、14種の式I oの化合物A-260.001~A-260.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0402】

表A-261は、14種の式I oの化合物A-261.001~A-261.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0403】

表A-262は、14種の式I oの化合物A-262.001~A-262.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0404】

表A-263は、14種の式I oの化合物A-263.001~A-263.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0405】

表A-264は、14種の式I oの化合物A-264.001~A-264.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されて

50

いるとおりである。

【0406】

表A-265は、14種の式I oの化合物A-265.001~A-265.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0407】

表A-266は、14種の式I oの化合物A-266.001~A-266.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0408】

表A-267は、14種の式I oの化合物A-267.001~A-267.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0409】

表A-268は、14種の式I oの化合物A-268.001~A-268.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0410】

表A-269は、14種の式I oの化合物A-269.001~A-269.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0411】

表A-270は、14種の式I oの化合物A-270.001~A-270.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0412】

表A-271は、14種の式I oの化合物A-271.001~A-271.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0413】

表A-272は、14種の式I oの化合物A-272.001~A-272.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0414】

表A-273は、14種の式I oの化合物A-273.001~A-273.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0415】

表A-274は、14種の式I oの化合物A-274.001~A-274.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにお

50

いて定義されているとおりである。

【0416】

表A-275は、14種の式I oの化合物A-275.001~A-275.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0417】

表A-276は、14種の式I oの化合物A-276.001~A-276.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0418】

表A-277は、14種の式I oの化合物A-277.001~A-277.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0419】

表A-278は、14種の式I oの化合物A-278.001~A-278.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0420】

表A-279は、14種の式I oの化合物A-279.001~A-279.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0421】

表A-280は、14種の式I oの化合物A-280.001~A-280.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0422】

表A-281は、14種の式I oの化合物A-281.001~A-281.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0423】

表A-282は、14種の式I oの化合物A-282.001~A-282.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0424】

表A-283は、14種の式I oの化合物A-283.001~A-283.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0425】

表A-284は、14種の式I oの化合物A-284.001~A-284.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて

50

定義されているとおりである。

【0426】

表A-285は、14種の式I oの化合物A-285.001~A-285.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0427】

表A-286は、14種の式I oの化合物A-286.001~A-286.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0428】

表A-287は、14種の式I oの化合物A-287.001~A-287.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0429】

表A-288は、14種の式I oの化合物A-288.001~A-288.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0430】

表A-289は、14種の式I oの化合物A-289.001~A-289.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0431】

表A-290は、14種の式I oの化合物A-290.001~A-290.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0432】

表A-291は、14種の式I oの化合物A-291.001~A-291.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0433】

表A-292は、14種の式I oの化合物A-292.001~A-292.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0434】

表A-293は、14種の式I oの化合物A-293.001~A-293.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0435】

表A-294は、14種の式I oの化合物A-294.001~A-294.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R

50

2は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0436】

表A-295は、14種の式I oの化合物A-295.001~A-295.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0437】

表A-296は、14種の式I oの化合物A-296.001~A-296.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0438】

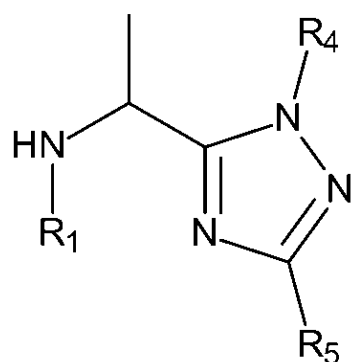
表A-297は、14種の式I oの化合物A-297.001~A-297.014を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0439】

式II aのアミン

【化37】

20



IIa

30

の特定の間接化合物も利用可能であり、そのうちのいくつかは新規であり、ここで、R₁、R₄（式Iにおいて定義されている、A₂を含有する環及びR_{4a}に対応する）及びR₅は、式Iについて定義されているとおりである。

【0440】

式II aの化合物の特定の例は、R₁、R₄及びR₅が、表A-1~A-297において定義されている場合である。

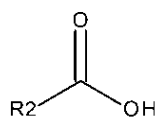
【0441】

さらに、

40

・式III a aの化合物

【化38】



IIIa a

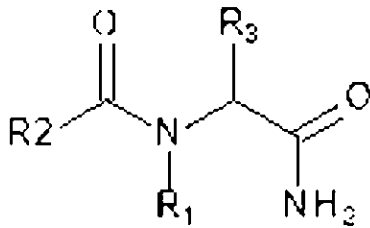
が利用可能であり、ここで、R₂は、式Iにおいて定義されている、A₁を含有する環、R_{2a}及びR_{2b}に対応し、ここで、C(O)OHは、A₁に対するパラ位において結合される。式III a aの化合物の特定の例は、R₂が、表Zにおいて定義されている場合で

50

あり；

・式VII-aの化合物

【化39】



10

VII-a

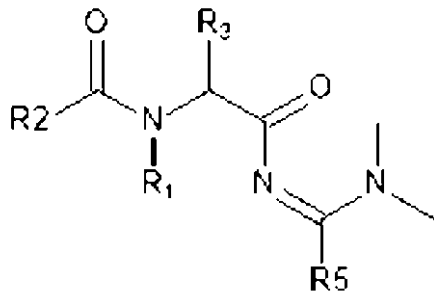
が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式Iにおいて定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 及び R_3 は式Iにおいて定義されるとおりである。式VII-aの化合物の特定の例は、(i) R_3 がメチルであり、 R_2 が、表Zにおいて定義されている1つの置換基であり、 R_1 が水素であり；(ii) R_3 がメチルであり、 R_2 が、表Zにおいて定義されて

20

あり；

・式IX-aの化合物

【化40】



30

IX-a

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式Iにおいて定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 、 R_3 及び R_5 は式Iにおいて定義されるとおりである。式IX-aの化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 、 R_2 及び R_5 が、表A-1~A-297中のいずれか

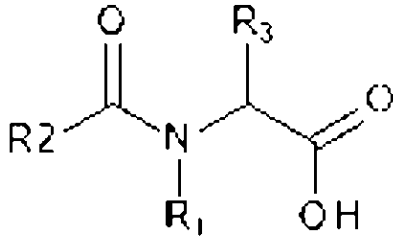
40

1つの化合物について定義されているとおりである場合であり；

・式XI-aの化合物

50

【化 4 1】



10

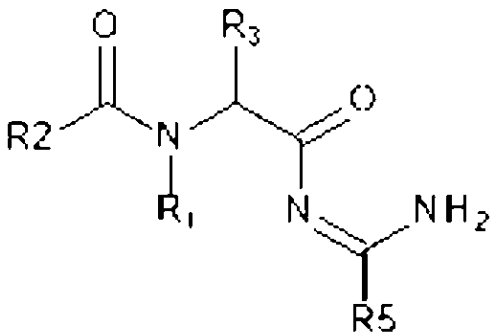
XI-a

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 及び R_3 は式 I において定義されるとおりである。式 I X - a の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 及び R_2 が、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 中のいずれか 1 つの化合物について定義されているとおりである場合であり；

・式 X I I I - a の化合物

20

【化 4 2】



30

XII-a

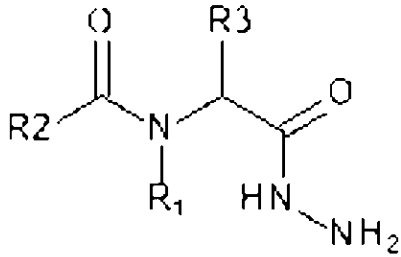
が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 、 R_3 及び R_5 は式 I において定義されるとおりである。式 X I I I - a の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 、 R_2 及び R_5 が、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 中のいずれか 1 つの化合物について定義されているとおりである場合であり；

・式 X I V - a の化合物

40

50

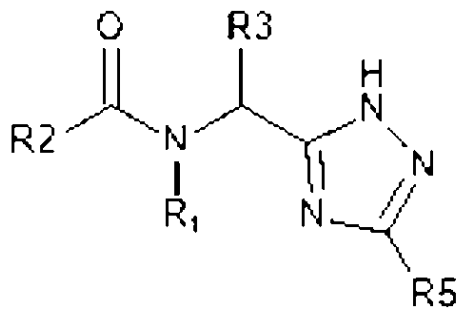
【化 4 3】

**XIV-a**

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 及び R_3 は式 I において定義されるとおりである。式 IX - a の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 及び R_2 が、表 A - 1 ~ A - 297 中のいずれか 1 つの化合物について定義されているとおりである場合であり；

・式 XV - a の化合物

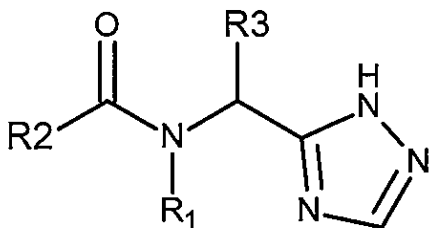
【化 4 4】

**XV-a**

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_1 、 R_3 及び R_5 は式 I において定義されるとおりである。式 XII I - a の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 、 R_2 及び R_5 が、表 A - 1 ~ A - 297 中のいずれか 1 つの化合物について定義されているとおりである場合であり；

・式 XVI I - a の化合物

【化 4 5】

**XVIII-a**

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、

10

20

30

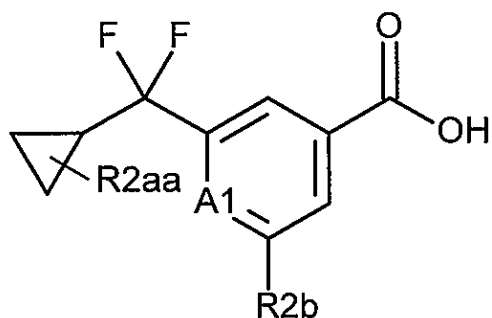
40

50

R_{2a}及びR_{2b}に対応し、ここで、C(O)は、A₁に対するパラ位において結合され；
R₁及びR₃は式Iにおいて定義されるとおりである。式IX-aの化合物の特定の例は、
R₃がメチルであり、R₁及びR₂が、表A-1~A-297中のいずれか1つの化合物
について定義されているとおりである場合であり；

・式XLIVの化合物

【化46】

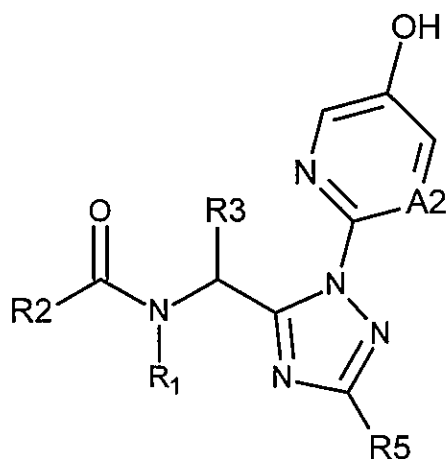


XLIV

が利用可能であり、ここで、R_{2b}及びA₁は式Iにおいて定義されるとおりであり、及
びR_{2aa}は、H、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、シアノ又はハロゲンであ
る。式XLIVの化合物の特定の例は、R_{2aa}が水素であり、A₁が、N又はCHであ
り、R_{2b}がCF₃である場合であり；

・式XLIX-aの化合物

【化47】



XLIX-a

が利用可能であり、ここで、R₂は、式Iにおいて定義されている、A₁を含有する環、
R_{2a}及びR_{2b}に対応し、ここで、C(O)は、A₁に対するパラ位において結合され；
及びR₁、R₃、R₅、及びA₂は式Iにおいて定義されるとおりである。式XLIX-a
の化合物の特定の例は、R₃がメチルであり、R₁、R₂及びR₅が、表A-1~A-29
7中のいずれか1つの化合物について定義されているとおりであり、A₂が、N又はCH
である場合であり；

・式LXV-aの化合物

10

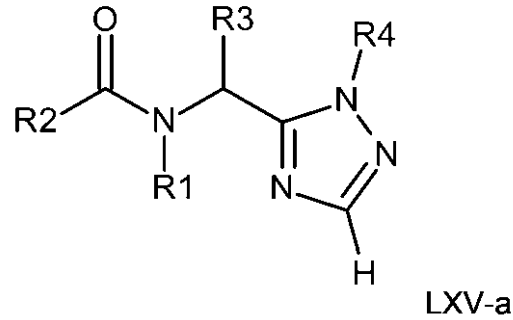
20

30

40

50

【化 4 8】



10

が利用可能であり、ここで、 R_2 は、式 I において定義されている、 A_1 を含有する環、 R_{2a} 及び R_{2b} に対応し、ここで、 $C(O)$ は、 A_1 に対するパラ位において結合され； R_4 は、式 I において定義されている、 A_2 を含有する環、及び R_{4a} に対応し； R_1 、及び R_3 は式 I において定義されるとおりである。式 LXV-a の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、 R_1 、 R_2 及び R_4 が、表 A-1 ~ A-297 中のいずれか 1 つの化合物について定義されているとおりである場合である。

【0442】

本発明に係る式 I の化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的に及び / 又は治療的に有益な有効成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類及び植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る有効成分は、昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表例などの通常の感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物のすべて又は個々の発育段階に対しても作用する。本発明に係る有効成分の殺虫又は殺ダニ活性は、直接、すなわち直ちに又はいくらかの時間が経過してから初めて、例えば脱皮中に起こる有害生物の破壊として又は間接的に、例えば減少した産卵及び / 又は孵化率として現れることがある。

20

【0443】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

ダニ目 (Acarina) から、例えばアカリツス属 (Acalitus spp)、アカルス属 (Aculus spp)、アカリカルス属 (Acaricalus spp)、アセリア属 (Aceria spp)、アシプトコナダニ (Acarus siro)、キララマダニ属 (Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属 (Argas spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.)、ブレビバルパス属 (Brevipalpus spp.)、ブリオビア属 (Bryobia spp)、カリピトリメルス属 (Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (Chorioptes spp.)、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス属 (Dermatophagoides spp)、エオテトラニカス属 (Eotetranychus spp)、エリオフィエス属 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属 (Hemitarsonemus spp)、イボマダニ属 (Hyalomma spp.)、タネガタマダニ属 (Ixodes spp.)、オリゴニクス属 (Olygonychus spp)、カズキダニ属 (Ornithodoros spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス (Polyphagotarsonella latus)、パノニクス属 (Panonychus spp.)、ミカンサビダニ (Phyllocoptruta oleivora)、フィトネムス属 (Phytonemus spp)、ポリファゴタロソネムス属 (Polyphagotarsonemus spp)、キュウセンヒゼンダニ属 (Psoroptes spp.)、コイタマダニ属 (Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属 (Sarcoptes spp.)、ステネオタルソネムス属 (Steneotarsonemus spp)、ホコリダニ属 (Ta

30

40

50

rsonemus spp.) 及びテトラニクス属 (Tetranychus spp.) ;

シラミ目 (Anoplura) から、例えばブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.) 及びフィロキセラ属 (Phylloxera spp.) ;

鞘翅目 (Coleoptera) から、例えばアグリオテス属 (Aagriotes spp.)、アンフィマロン・マジアレ (Amphimallon majale)、セマダラコガネ (Anomala orientalis)、アントノムス属 (Anthonomus spp.)、マグソコガネ属 (Aphodius spp.)、アスチラス・アトロマクラタス (Astylus atromaculatus)、アテニウス属 (Atenius spp.)、アトマリア・リネアリス (Atomaria linearis)、カエトクネマ・チビアリス (Chaetocnema tibialis)、セロトマ属 (Cerotoma spp.)、コノデルス属 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属 (Cosmopolites spp.)、コチニス・ニチダ (Cotinis nitida)、クルクリオ属 (Curculio spp.)、シクロセファラ属 (Cyclocephala spp.)、デルメステス属 (Dermestes spp.)、ジアブロチカ属 (Diabrotica spp.)、アブデルスツノカブトムシ (Diloboderus abderus)、エピラクナ属 (Epilachna spp.)、エレムヌス属 (Eremnus spp.)、ヘテロニクス・アラトル (Heteronychus arator)、コーヒーノミキウムシ (Hypothenemus hampei)、ラグリア・フィロサ (Lagria vilosa)、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata)、リツソルホプトルス属 (Lissorhopterus spp.)、リオゲニス属 (Liogenys spp.)、マエコラスピス属 (Maecolaspis spp.)、アカビロウドコガネ (Maladera castanea)、メガセリス属 (Megascelis spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、メロロンタ属 (Melolontha spp.)、マイオクロウス・アルマツス (Myochrous armatus)、オリカエフィルス属 (Orycaephilus spp.)、オチオリンクス属 (Otiorynchus spp.)、フィロファガ属 (Phyllophaga spp.)、フリクチヌス属 (Phlyctinus spp.)、ポピリア属 (Popillia spp.)、プシリオデス属 (Psylliodes spp.)、リソマツス・アウブチリス (Rhysomatus aubtilis)、リゾペルタ属 (Rhizophortha spp.)、コガネムシ科 (Scarabeidae)、シトフィルス属 (Sitophilus spp.)、シトルガ属 (Sitotroga spp.)、ソマチカス属 (Somaticus spp.)、スフェノフォラス属 (Sphenophorus spp.)、ステルネクススブ・シグナツス (Stenochus subsignatus)、ゴミュシダマシ属 (Tenebrio spp.)、トリボリウム属 (Tribolium spp.) 及びトロゴデルマ属 (Trogoderma spp.) ;

双翅目 (Diptera) から、例えばヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (Antherigona soccata)、オリーブミバエ (Bactrocea oleae)、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、ブラジシア属 (Bradysia spp.)、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、セラチチス属 (Ceratitis spp.)、オビキンバエ属 (Chrysomyia spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、クテレブラ属 (Cuterebra spp.)、ダクス属 (Dacus spp.)、デリア属 (Delia spp.)、キイロショウジョウバエ (Drosophila melanogaster)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ガストロフィラス属 (Gastrophilus sp

p.)、ゲオミザ・トリブクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属 (*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Lirio myza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) 及びガガンボ属 (*Tipula* spp.) ;

半翅目 (*Hemiptera*) から、例えばアcantコリス・スカブラトル (*Acant hocoris scabrator*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、プリサス属 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、エデッサ属 (*Edessa* spp.)、ユーキスツス属 (*Euchistus* spp.)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリス属 (*Leptocorisa* spp.)、メクラカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マルガロデス属 (*Margarodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus* spp.)、タバコカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara* spp.)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulans*)、オエバルス・インストラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma* spp.)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サーベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノファラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアント属 (*Thyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス (*Vatiga illudens*) ;

アシルトシウム・ピスム (*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属 (*Adalgas* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brassicae*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノンジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ワタアブラムシ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)

.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バク
 テリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属
 (*Bemisia* spp)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp)
 、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属
 (*Cacopsylla* spp)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella*
aegopodii Scop.)、セロプラスタ属 (*Ceroplaster* spp
 .)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidiu*
m)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyosper*
mi)、シカデラ属 (*Cicadella* spp)、シロオオヨコバイ (*Cofana*
spectra)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp)、シカデュリ 10
 ナ属 (*Cicadulina* spp)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus he*
speridum)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジア
 レウロデス属 (*Dialeurodes* spp)、ミカンキジラミ (*Diaphori*
na citri)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジ
 サフィス属 (*Dysaphis* spp)、エンボアスカ属 (*Empoasca* spp
 .)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythronaura*
spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp
 .)、グリカスピス・プリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblecom*
bei)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobr*
assicae)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp)、ヒペロミズ 20
 ス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバ
 イ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコピアスカ・リビカ (*Jacob*
iasca lybica)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)
 、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Le*
pidosaphes spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis er*
ysimi)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフ
 ム属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* s
 pp)、メタカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウス
 イロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズ
 ス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシブ 30
 テラ属 (*Neotoxoptera* sp)、ツماغロヨコバイ属 (*Nephotett*
ix spp.)、ニラパルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリ
 オアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats)、オドナスピス・ル
 タエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Oreg*
ma lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemis*
ia myricae)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza cock*
erelli)、バルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属
 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus ma*
ididis)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp)、ホップイボアブ
 ラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera* 40
 spp)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シュードウラカス
 ピス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Pseu*
dococcus spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis*
seriatus)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、ブルビナリア・エチオピカ
 (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズビジオツス属 (*Quad*
raspidiotus spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*
)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rho*
palosiphum spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、
 スカホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Schiz*
aphis spp.)、シトビオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウンカ 50

(*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス(*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ(*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属(*Toxoptera* spp)、トリアレウロデス属(*Trialeurodes* spp)、トリジスカス・スポロボリ(*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属(*Trionymus* spp)、ミカントガリキジラミ(*Trioza erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ(*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ(*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス(*Zyginidia scutellaris*) ;

膜翅目(*Hymenoptera*)から、例えばヒメハキリアリ属(*Acromyrme* x)、アルゲ属(*Arge* spp)、ハキリアリ属(*Atta* spp.)、セフス属(*Cephus* spp.)、ジプリオン属(*Diprion* spp.)、マツハバチ科(*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ(*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属(*Hoplocampa* spp.)、ケアリ属(*Lasius* spp.)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリオン属(*Neodiprion* spp.)、シュウカクアリ属(*Pogonomyrmex* spp)、スレノプシス・インビクタ(*Slenopsis invicta*)、ソレノプシス属(*Solenopsis* spp.)及びベスパ属(*Vespa* spp.) ;

等翅目(*Isoptera*)から、例えばコプトテルメス属(*Coptotermes* spp)、コルニテルネス・クムランス(*Cornitermes cumulans*)、インシシテルメス属(*Incisitermes* spp)、マクロテルメス属(*Macrotermes* spp)、マストテルメス属(*Mastotermes* spp)、ミクロテルメス属(*Microtermes* spp)、ヤマトシロアリ属(*Reticulitermes* spp.) ; ソレノプシス・ゲミナテ(*Solenopsis geminate*)

鱗翅目(*Lepidoptera*)から、例えばアクレリス属(*Acleris* spp.)、アドキソフィエス属(*Adoxophyes* spp.)、アエゲリア属(*Aegeria* spp.)、アグロティス属(*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillaceae*)、アミロイス属(*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属(*Archips* spp.)、アルギレスチア属(*Argyresthia* spp)、アルギロタエニア属(*Argyrotaenia* spp.)、アウトグラフィ属(*Autographa* spp.)、ブクラトリクス・ツルベリエラ(*Bucculatrix thurberiella*)、アフリカズイム(*Busselola fusca*)、スジマラダメイガ(*Cadra cautella*)、モモシンクイガ(*Carposina nipponensis*)、チロ属(*Chilo* spp.)、コリストネウラ属(*Choristoneura* spp.)、クリソテウチア・トピアリア(*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ(*Clysia ambiguella*)、クナファロクロシス属(*Cnaphalocrocis* spp.)、クネファシア属(*Cnephasia* spp.)、コチリス属(*Cochylis* spp.)、コレオフォラ属(*Coleophora* spp.)、コリアス・レスビア(*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ(*Cosmophila flava*)、クラムバス属(*Crambus* spp)、ケブカノメイガ(*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ(*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ベルスペクタリス(*Cydalima perspectalis*)、ジシア属(*Cydia* spp.)、ジアフニア・ベルスペクタリス(*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属(*Diatraea* spp.)、ジパロプシス・カスタネア(*Diparopsis castanea*)、エアリアス属(*Earias* spp.)、エルダ

ナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephes-
tia* spp.)、エピノチア属 (*Epinochia* spp.)、エスチグメネ・アク
 レア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma* spp.)、ブドウホソハマ
 キ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクチス属 (*Euproc-
tis* spp.)、ユークソア属 (*Euxoa* spp.)、フェルチア・ジャクリフ
 エリア (*Feltia jaculiferia*)、グラホリタ属 (*Grapholita* spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ (*Hedya nubiferana*)、ヘリ
 オティス属 (*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、ヘルペトグラマ属 (*Herpetogramma* spp.)、アメリ
 カシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Lasm
opalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocolletis* spp.)、
 ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ピフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria* spp.)、
 リオネチア属 (*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属 (*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコ
 スズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna* spp.)、
 ノクツア属 (*Noctua* spp.)、オペロフテラ属 (*Operophtera* sp
 p.)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ
 (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene* spp.)、
 パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flam-
mea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミム
 シ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Pe-
rileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*P-
seudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea
operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属
 (*Pieris* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プ
 レイス属 (*Prays* spp.)、シュードプルシア属 (*Pseudoplusia* 30
 spp.)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ
 (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* s
 pp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属 (*Sparga-
nothis* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、シレ
 プタ・デロガテ (*Sylepta derogate*)、シナンテドン属 (*Synant-
hedon* spp.)、タウメトポエア属 (*Thaumetopoea* spp.)、
 トルトリックス属 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichop-
lusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*) 及びスガ属 (*Ypo-
nomeuta* spp.) ;
 食毛目 (*Mallophaga*) から、例えばダマリネア属 (*Damalinae* sp 40
 p.) 及びケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;
 直翅目 (*Orthoptera*) から、例えばゴキブリ属 (*Blatta* spp.)、
 チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.)、ケラ属 (*Gryllotalp-
a* spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマ
 バッタ属 (*Locusta* spp.)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ (*Neocur-
tilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta*
 spp.)、スカプテリスカス属 (*Scapteriscus* spp) 及びコオロギ属
 (*Schistocerca* spp.) ;
 チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えばリポセリス属 (*Liposcel-
is* spp.) ;

ノミ目 (Siphonaptera) から、例えばナガノミ属 (Ceratomyllus spp.)、イヌノミ属 (Ctenocephalides spp.) 及びケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis) ;

総翅目 (Thysanoptera) から、例えばカリオトリプス・ファセオリ (Calliothrips phaseoli)、ハナアザミウマ属 (Frankliniella spp.)、ヘリオトリプス属 (Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス属 (Hercinothrips spp.)、パルテノトリプス属 (Parthenothrips spp.)、シルトトリプス・アウランチイ (Scirtothrips aurantii)、ダイズアザミウマ (Sericothrips variabilis)、タエニオトリプス属 (Taeniothrips spp.)、アザミウマ属 (Thrips spp.) ;

シミ目 (Thysanura) から、例えばセイヨウシミ (Lepisma saccharina)。

【0444】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎又は根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

【0445】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ又はソルガムなどの穀物；テンサイ又は飼料用ビートなどのビート；果実、例えばリンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ又は液果類、例えばイチゴ、ラズベリー又はブラックベリーなどの仁果類、核果類又は柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ又はダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオ又はアメリカホドイモ (ground nut) などの油脂作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻又はジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの柑橘類の果物；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモン又はショウノウなどのクスノキ科 (Lauraceae) の植物；及びさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物及びラテックス植物である。

【0446】

本発明の組成物及び/又は方法は、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び/又は野菜作物でも用いられ得る。

【0447】

例えば、本発明は、以下の観賞用種：アゲラタム属の種 (Ageratum spp.)、アロンソア属の種 (Alonsoa spp.)、アネモネ属の種 (Anemone spp.)、アニソドンテアカプセニシス (Anisodonteacapsensis)、アンテムス属の種 (Anthemis spp.)、アンチルリヌム属の種 (Antirrhinum spp.)、アステル属の種 (Aster spp.)、ベゴニア属の種 (Begonia spp.) (例えば、B. エラチオール (B. elatior)、B. セムペルフロレンス (B. semperflorens)、B. チュベレウクス (B. tubereux))、ブーゲンビレア属の種 (Bougainvillea spp.)、ブラキコメ属の種 (Brachycome spp.)、ブラシカ属の種 (Brassica spp.) (観賞用)、カルセオラリア属の種 (Calceolaria spp.)、トウガラシ (Capsicum annuum)、ニチニチソウ (Catharanthus roseus)、カンナ属の種 (Canna spp.)、ヤグルマギク属の種 (Centauraea spp.)、キク属の種 (Chrysanth

10

20

30

40

50

emum spp.)、シネラリア属の種 (Cineraria spp.) (C. マリチメ (C. maritime))、コレオプシス属の種 (Coreopsis spp.)、クラッスラコッキネア (Crassula coccinea)、タバコソウ (Cuphea ignea)、ダリア属の種 (Dahlia spp.)、デルフィニウム属の種 (Delphinium spp.)、ケマンソウ (Dicentra spectabilis)、ドロテアーツス属の種 (Dorotheantus spp.)、トルコギキョウ (Eustoma grandiflorum)、レンギョウ属の種 (Forsythia spp.)、フクシア属の種 (Fuchsia spp.)、ゼラニウムグナファリウム (Geranium gnaphalium)、ガーベラ属の種 (Gerbera spp.)、センニチコウ (Gomphrena globosa)、ヘリオトロピウム属の種 (Heliotropium spp.)、ヘリアンツス属の種 (Helianthus spp.)、ハイビスカス属の種 (Hibiscus spp.)、ホルテンシア属の種 (Hortensia spp.)、ハイドランジア属の種 (Hydrangea spp.)、ヒポエステスフィロスタシア (Hypoestes phyllostachya)、インパチエンス属の種 (Impatiens spp.) (アフリカハウセンカ (I. Walleriana))、イレスネス属の種 (Iresine spp.)、カランコエ属の種 (Kalanchoe spp.)、ランタナ (Lantana camara)、ハナアオイ (Lavatera trimestris)、カエンキセワタ (Leonotis leonurus)、ユリ属の種 (Lilium spp.)、メセンムリアンテマム属の種 (Mesembryanthemum spp.)、ミムラス属の種 (Mimulus spp.)、ヤグルマハッカ属の種 (Monarda spp.)、ネメシア属の種 (Nemesia spp.)、タゲテス属の種 (Tagetes spp.)、ダイアンサス属の種 (Dianthus spp.) (カーネーション)、カンナ属の種 (Canna spp.)、オキザリス属の種 (Oxalis spp.)、ベリス属の種 (Bellis spp.)、ペラルゴニウム属の種 (Pelargonium spp.) (アイビーゼラニウム (P. peltatum)、モンテンジクアオイ (P. Zonale))、スミレ属の種 (Viola spp.) (パンジー)、ペチュニア属の種 (Petunia spp.)、フロックス属の種 (Phlox spp.)、プレクトランツス属の種 (Plecthranthus spp.)、ポインセチア属の種 (Poinsettia spp.)、パルテノキスス属の種 (Parthenocissus spp.) (アメリカツタ (P. quinquefolia)、ツタ (P. tricuspidata))、プリムラ属の種 (Primula spp.)、キンボウゲ属 (Ranunculus spp.)、ツツジ属の種 (Rhododendron spp.)、バラ属の種 (Rosa spp.) (バラ)、ルドベキア属の種 (Rudbeckia spp.)、アフリカスミレ属の種 (Saintpaulia spp.)、サルビア属の種 (Salvia spp.)、スカエボラアエモラ (Scaevola aemola)、シザンサスウィセトネンシス (Schizanthus wisetonensis)、セダム属の種 (Sedum spp.)、ナス属の種 (Solanum spp.)、スルフィニア属の種 (Surfinia spp.)、タゲテス属の種 (Tagetes spp.)、ニコチニア属の種 (Nicotiana spp.)、バーベナ属の種 (Verbena spp.)、ヒヤクニチソウ属の種 (Zinnia spp.) 及び他の花壇用植物のいずれかにおいて用いられ得る。

【0448】

例えば、本発明は、以下の野菜種：ネギ属の種 (Allium spp.) (ニンニク (A. sativum)、タマネギ (A. cepa)、エシャロット (A. oschaninii)、リーキ (A. Porrum)、ワケギ (A. ascalonicum)、ネギ (A. fistulosum)、チャービル (Anthriscus cerefolium)、セロリ (Apium graveolus)、アスパラガス (Asparagus officinalis)、ビート (Beta vulgarus)、ブラシカ属の種 (Brassica spp.) (ヤセイカンラン (B. Oleracea)、ハク

サイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、チコルム属の種 (*Cichorium spp.*) (チコリー (*C. intybus*)、エンダイブ (*C. endivia*))、スイカ (*Citrillus lanatus*)、ククミス属の種 (*Cucumis spp.*) (サフラン (*C. sativus*)、メロン (*C. melo*))、ククルビタ属の種 (*Cucurbita spp.*) (ペポカボチャ (*C. pepo*)、西洋カボチャ (*C. maxima*))、シアナラ属の種 (*Cyanara spp.*) (アーティチョーク (*C. scolymus*)、カルドン (*C. cardunculus*))、ニンジン (*Daucus carota*)、フェネル (*Foeniculum vulgare*)、オトギリソウ属の種 (*Hypericum spp.*)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属の種 (*Lycopersicon spp.*) (トマト (*L. esculentum*)、トマト (*L. lycopersicum*))、ハッカ属の種 (*Mentha spp.*)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属の種 (*Phaseolus spp.*) (ムシトリスミレ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*))、エンドウ (*Pisum sativum*)、ダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属の種 (*Rosemarinus spp.*)、サルビア属の種 (*Salvia spp.*)、キバナバラモンジン (*Scorzonerahispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、バレリアネラ属の種 (*Valerianella spp.*) (ノヂシャ (*V. locusta*)、*V. エリオカルパ* (*V. eriocarpa*)) 及びソラマメ (*Vicia faba*) のいずれかにおいて用いられ得る。

【0449】

好ましい観賞用種としては、セントポーリア、ペゴニア、ダリア、ガーベラ、アジサイ、クマツツラ、バラ属 (*Rosa*)、カラコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア、アスター、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、キンケイギク属 (*Coreopsis*)、ヒエンソウ属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、ルドベキア属 (*Rudbeckia*)、セダム属 (*Sedum*)、ペチュニア、ビオラ属 (*Viola*)、ホウセンカ、ゼラニウム、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア、サルビア、セイヨウアジサイ、ローズマリー、セージ、セイヨウトウガラシ、ミント、シシトウガラシ、トマト及びキュウリが挙げられる。

【0450】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアプロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に特に好適である。

【0451】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアプロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis vi*

rescens)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分はさらに、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilosupressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に特に好適である。

【0452】

さらなる態様において、本発明はまた、植物寄生性線虫 (内部寄生性 -、半内部寄生性 - 及び外部寄生性線虫)、特に、根こぶ線虫、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) 種; シスト形成線虫、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種; ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、及び他のシストセンチュウ属 (*Heterodera*) 種; シードガル (*Seed gall*) 線虫、アングイナ属 (*Anguina*) 種; クキセンチュウ及びハガレセンチュウ、アフレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) 種; 刺毛線虫 (*Sting nematode*)、ベロノライムスロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) 及び他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) 種; マツザイ線虫、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 及び他のブルサフェレンクス属 (*Bursaphelenchus*) 種; ワセンチュウ、クリコネマ (*Criconema*) 種、クリコネメラ (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス (*Criconemoides*) 種、メソクリコネマ (*Mesocriconema*) 種; 茎及び鱗茎線虫、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、クキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 及び他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) 種; キリセンチュウ、ドリコドルス (*Dolichodoros*) 種; ラセンセンチュウ、ヘリオコチレンクスムルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) 及び他のヘリオコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) 種; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種及びヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoides*) 種; ヒルスマンニエラ属 (*Hirshmanniella*) 種; ヤリセンチュウ、ホプロアイムス属 (*Hoploaimus*) 種; ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) 種; ハリセンチュウ、ロンギドルスエロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロンギドルス属 (*Longidorus*) 種; ピンセンチュウ、ネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) 種; ネグサレセンチュウ、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、ブラチレンクスクルピタツス (*Pratylenchus curvitatatus*)、ブラチレンクスグーデイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) 種; ネモグリセンチュウ、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のネモグリセンチュウ属 (*Radopholus*) 種; ニセフクロセンチュウ、ロチレンクスロブスツス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクスレニホルミス (*Rotylenchus renifolius*)

r mis) 及び他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種; スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種; ユミハリ線虫、トリコドルスピリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種; イシュクセンチュウ、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコルヒンクスドゥビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコルヒンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種; ミカンネセンチュウ、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種; オオハリセンチュウ、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫; 並びに、スバングイナ属の種 (*Subanguina* spp.)、ヒブソペリネ属の種 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属の種 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属の種 (*Melinius* spp.)、プンクトデラ属の種 (*Punctodera* spp.)、及びキニスルシウス属の種 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物及びその一部に対する損害を防止する方法に關し得る。

10

【0453】

本発明の化合物はまた、軟体動物に対しても活性を有し得る。その例としては、例えば、スクミリングガイ科 (*Ampullariidae*); アリオン属 (*Arion*) (コウラクロナメクジ (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプトス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーフアス* (*A. rufus*)); オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (*ブラジバエナフルチクム* (*Bradybaena fruticum*)); オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (*ニワノオウシュウマイマイ* (*C. hortensis*)、*モリマイマイ* (*C. nemoralis*)); オクロジナ (*Ochlodina*); デロセラス属 (*Deroceras*) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiropicorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*)); ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*)); ユーオムファリア属 (*Euomphalia*); ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルククラタ* (*G. trunculata*)); ヘリセリア属 (*Helicelina*) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*)); マイマイ科 (*Helicidae*) (*ヘリシゴナルブストルム* (*Helicigona arbustorum*)); ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*); ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*)); リマックス属 (*Limax*) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ* (*L. flavus*)、*チャコウラナメクジ* (*L. marginatus*)、*マダラコウラナメクジ* (*L. maximus*)、*L. テネルス* (*L. tenellus*)); モノアライガイ属 (*Lymnaea*); ミラックス属 (*Milax*) (*ニワコウラナメクジ* (*M. gates*)、*M. マルギナツス* (*M. marginatus*)、*M. ソウエルバイ* (*M. sowerbyi*)); オペアス属 (*Opeas*); リングガイ属 (*Pomacea*) (*スクミリングガイ* (*P. canaticulata*)); ミジンマイマイ属 (*Vallonia*) 及びザニトイデス属 (*Zanitoides*) が挙げられる。

20

30

40

【0454】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特にバチルス属 (*Bacillus*) の細菌に由来する公知のような1つ又は複数の選択的に作用する毒素を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

【0455】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) 又はバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質; 又は - エンドトキシン、例えば Cr

50

y 1 A b、Cry 1 A c、Cry 1 F、Cry 1 F a 2、Cry 2 A b、Cry 3 A、Cry 3 B b 1 又は Cry 9 C など、バチルス・チューリングシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質 (Vip)、例えば Vip 1、Vip 2、Vip 3 又は Vip 3 A；又は細菌コロニー形成線虫、例えばフォトラバダス・ルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、キセノラバダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などのフォトラバダス属 (*Photobacterium spp.* 又はキセノラバダス属 (*Xenorhabdus spp.*) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素；ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パバイン阻害剤などのプロテイナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポリン又はプリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP)；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

10

20

【0456】

本発明に関して、-エンドトキシンは、例えば、Cry 1 A b、Cry 1 A c、Cry 1 F、Cry 1 F a 2、Cry 2 A b、Cry 3 A、Cry 3 B b 1 又は Cry 9 C 又は植物性殺虫タンパク質 (Vip)、例えば Vip 1、Vip 2、Vip 3 又は Vip 3 A、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素及び改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより産生される (例えば、国際公開第 02/15701 号を参照されたい)。切断毒素、例えば切断 Cry 1 A b が公知である。改変毒素の場合、天然毒素の 1 つ又は複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えば Cry 3 A 055 の場合、カテプシン-G-認識配列が、Cry 3 A 毒素に挿入される (国際公開第 03/018810 号を参照されたい)。

30

【0457】

このような毒素又はこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第 0374753 号明細書、国際公開第 93/07278 号、国際公開第 95/34656 号、欧州特許出願公開第 0427529 号明細書、欧州特許出願公開第 451878 号明細書及び国際公開第 03/052073 号に開示されている。

【0458】

このようなトランスジェニック植物の調製の方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。Cry I 型のデオキシリボ核酸及びそれらの調製は、例えば、国際公開第 95/34656 号、欧州特許出願公開第 0367474 号明細書、欧州特許出願公開第 0401979 号明細書及び国際公開第 90/13651 号から公知である。

40

【0459】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫 (鞘翅目 (*Coleoptera*))、双翅昆虫 (双翅目 (*Diptera*)) 及び蛾 (鱗翅目 (*Lepidoptera*)) において特に一般的に見られる。

【0460】

50

殺虫剤耐性 (insecticidal resistance) をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかは市販されている。このような植物の例は、YieldGard (登録商標) (Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm (登録商標) (Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus (登録商標) (Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種); Starlink (登録商標) (Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種); Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2毒素及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現するトウモロコシ品種); NuCOTN 33B (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種); Bollgard I (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種); Bollgard II (登録商標) (Cry1Ac及びCry2Ab毒素を発現するワタ品種); VipCot (登録商標) (Vip3A及びCry1Ab毒素を発現するワタ品種); NewLeaf (登録商標) (Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標)、Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11アワノメイガ (CB) 形質) 及び Protecta (登録商標) である。

【0461】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France) 製のBt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

【0462】

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France) 製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

【0463】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France) 製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。改変Cry3A毒素のトランスジェニック発現により、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-G-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号に記載されている。

【0464】

4. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のMON 863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON 863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

【0465】

5. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

【0466】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B - 1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目(Lepidoptera)昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1F及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

10

【0467】

7. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium) 製のNK603 x MON 810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603及びMON 810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603 x MON 810トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属(Agrobacterium sp.) 菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS及びヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目(Lepidoptera) に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

20

【0468】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>) にも記載されている。

【0469】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい) など、選択的作用を有する抗病原性物質を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95/33818号及び欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。

30

【0470】

作物は、真菌(例えば、フザリウム属(Fusarium)、炭疽病又はフィトフトラ属(Phytophthora)、細菌(例えば、シュードモナス属(Pseudomonas)) 又はウイルス(例えば、ジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス) 病原体に対する耐性を高めるためにも改良され得る。

40

【0471】

作物は、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものも含む。

【0472】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は当技術分野において公知である他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

【0473】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例

50

例えばウイルス性 K P 1、K P 4 又は K P 6 毒素；スチルベンシターゼ；ピベンジルシターゼ；キチナーゼ；グルカナナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」（P R P；例えば、欧州特許出願公開第 0 3 9 2 2 2 5 号明細書を参照されたい）；微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質又は複素環式抗生物質（例えば、国際公開第 9 5 / 3 3 8 1 8 号を参照されたい）又は植物病原体防御に関与するタンパク質又はポリペプチド因子（国際公開第 0 3 / 0 0 0 9 0 6 号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

【 0 4 7 4 】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料（木材及び織物など）、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

10

【 0 4 7 5 】

本発明は、治療において用いられる第 1 の態様の化合物を提供する。本発明は、動物内又は上の寄生生物の防除に用いられる第 1 の態様の化合物を提供する。本発明は、動物上の外寄生生物の防除に用いられる第 1 の態様の化合物をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害の予防及び / 又は処置において用いられる第 1 の態様の化合物をさらに提供する。

【 0 4 7 6 】

本発明は、動物内又は上における寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び / 又は処置するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。

20

【 0 4 7 7 】

本発明は、動物内又は上における寄生生物の防除における第 1 の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物の防除における第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。

【 0 4 7 8 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「防除する」という用語は、有害生物若しくは寄生生物の数の低減、有害生物若しくは寄生生物の駆除及び / 又はさらなる有害生物若しくは寄生生物侵襲の予防を指す。

30

【 0 4 7 9 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「処置する」という用語は、既存の症状又は病害の進行又は重症度の抑制、遅延、停止又は退行を指す。

【 0 4 8 0 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「予防する」という用語は、動物内において進展する症状又は病害の回避を指す。

【 0 4 8 1 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「動物」という用語は、哺乳類及び鳥又は魚などの非哺乳類を指し得る。哺乳類の場合、これは、ヒト又は非ヒト哺乳類であり得る。非ヒト哺乳類としては、これらに限定されないが、家畜動物及び伴侶動物が挙げられる。家畜動物としては、これらに限定されないが、ウシ、ラクダ科 (c a m e l l i d s)、ブタ、ヒツジ、ヤギ及びウマが挙げられる。伴侶動物としては、これらに限定されないが、イヌ、ネコ及びウサギが挙げられる。

40

【 0 4 8 2 】

「寄生生物」は、宿主動物内又は上で生存し、宿主動物を犠牲にしてもたらされる栄養分によって利する有害生物である。「内寄生生物」は、宿主動物の体内に生存している寄生生物である。「外寄生生物」は、宿主動物上に生存している寄生生物である。外寄生生物としては、これらに限定されないが、コナダニ、昆虫及び甲殻類（例えば、フナムシ）が挙げられる。ダニ目 (A c a r i) (又はダニ目 (A c a r i n a)) 亜綱は、マダニ類

50

及びダニを含む。マダニ類としては、これらに限定されないが、以下の属の構成員：コイタマダニ属 (*Rhipicaphalus*)、例えばオウシマダニ (*Rhipicaphalus (Boophilus) microplus*) 及びクリロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)；キラマダニ属 (*Amblyomma*)；カクマダニ属 (*Dermacentor*)；チマダニ属 (*Haemaphysalis*)；イボマダニ属 (*Hyalomma*)；マダニ属 (*Ixodes*)；リピセントール属 (*Rhipicentor*)；マルガロプス属 (*Margaropus*)；ナガヒメダニ属 (*Argas*)；オトビウス属 (*Otobius*)；及びカズキダニ属 (*Ornithodoros*) が挙げられる。ダニとしては、これらに限定されないが、以下の属の構成員：ショクヒヒゼンダニ属 (*Choriotptes*)、例えばウシショクヒヒゼンダニ (*Choriotptes bovis*)；キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes*)、例えばヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)；ツメダニ属 (*Cheyletiella*)；デルマニッスス属 (*Dermanyssus*)；例えばワクモ (*Dermanyssus gallinae*)；イエダニ属 (*Ornithonyssus*)；ニキビダニ属 (*Demodex*)、例えばイヌニキビダニ (*Demodex canis*)；サルコプテス属 (*Sarcoptes*)、例えばヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)；及びヒツジツメダニ属 (*Psorergates*) が挙げられる。昆虫としては、これらに限定されないが、以下の目の構成員：ノミ目 (*Siphonaptera*)、双翅目 (*Diptera*)、咀嚼目、鱗翅目 (*Lepidoptera*)、鞘翅目 (*Coleoptera*) 及び同翅目 (*Homoptera*) が挙げられる。ノミ目 (*Siphonaptera*) の構成員としては、これらに限定されないが、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) 及びイヌノミ (*Ctenocephalides canis*) が挙げられる。双翅目 (*Diptera*) の構成員としては、これらに限定されないが、イエバエ属の種 (*Musca spp.*)；ウマバエ、例えばウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*) 及びヒツジバエ (*Oestrus ovis*)；サシバエ；アブ、例えばゴマフアブ属の種 (*Haematopota spp.*) 及びタブヌス属の種 (*Tabanus spp.*)；ヘマトビア属 (*haematobia*)、例えばノサシバエ (*haematobia irritans*)；サシバエ属 (*Stomoxys*)；ギンバエ属 (*Lucilia*)；ユスリカ；並びに蚊が挙げられる。咀嚼目の構成員としては、これらに限定されないが、吸血シラミ及び刺咬性のシラミ、例えばヒツジハジラミ (*Bovicola Ovis*) 及びウシハジラミ (*Bovicola Bovis*) が挙げられる。

【0483】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「有効量」という用語は、本発明又はその塩の化合物の量又は投与量であって、動物への一回又は複数回の投与量において動物内又は上で所望の効果が得られるものを指す。有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者としての担当の診断医によって容易に判定され得る。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、哺乳類の種；そのサイズ、年齢及び一般的な健康状態；防除される寄生生物及び侵襲の程度；関連する特定の病害又は障害；病害又は障害の程度又は合併症又は重症度；固体の応答；投与される特定の化合物；投与モード；投与される調製物のバイオアベイラビリティ特徴；選択される投与量投与計画；併用薬の使用；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が担当の診断医によって考慮される。

【0484】

本発明の化合物は、特に、これらに限定されないが、局部、経口、非経口及び皮下を含む、所望の効果を有するいずれかの経路によって動物に投与され得る。局部投与が好ましい。局部投与に好適な配合物としては、例えば、溶液、エマルジョン及び懸濁液が挙げられ、ポアオン、スポットオン、スプレーオン、スプレーレース又はディップの形態であり得る。代わりに、本発明の化合物は、耳標又はカラーによって投与され得る。

【0485】

本発明の化合物の塩形態は、農芸化学的に許容可能な塩と異なり得る薬学的に許容可能な塩及び獣医学的に許容可能な塩の両方を含む。薬学的及び獣医学的に許容可能な塩並びにこれらを調製するための一般的な方法論は、当技術分野において周知である。例えば、Gould, P. L., "Salt selection for basic drugs", *International Journal of Pharmaceutics*, 33:201-217 (1986); Bastin, R. J., et al. "Salt Selection and Optimization Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities", *Organic Process Research and Development*, 4:427-435 (2000); 及び Berge, S. M., et al., "Pharmaceutical Salts", *Journal of Pharmaceutical Sciences*, 66:1-19, (1977) を参照されたい。本発明の化合物は、当業者に周知である技術及び条件を用いて、塩酸塩などの塩に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを合成の当業者は理解するであろう。加えて、合成の当業者は、本発明の化合物が、対応する塩から対応する遊離塩基に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを理解するであろう。

【0486】

本発明は、有害生物（蚊及び他の病原媒介動物など；http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/ も参照されたい）を防除する方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除する方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面のIRS（屋内残留噴霧）施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

【0487】

一実施形態において、このような有害生物を防除する方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面又は基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井又は床面などの表面におけるIRS施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

【0488】

処理される不織布、布帛又は網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布若しくは羊毛などの天然繊維又はポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号又は国際公開第2007/090739号から公知である。

【0489】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

【0490】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）及び鞘翅目（Coleoptera）の木材穿孔性（wood-boring）

g) 昆虫、特に以下の表 A 及び B に列挙される木材穿孔性昆虫 (wood borer) に対して特に好適である。

【 0 4 9 1 】

【 表 2 】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アオナガタマムシ (<i>Agrilus planipennis</i>)	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	アノプルラ・グラブリペンニス (<i>Anoplura glabripennis</i>)	広葉樹
キクイムシ科 (Scolytidae)	サクキクイムシ (<i>Xylosandrus crassiusculus</i>)	広葉樹
	クスノキオオキクイムシ (<i>X. mutilatus</i>)	広葉樹
	マツノキクイムシ (<i>Tomicus piniperda</i>)	針葉樹

10

20

【 0 4 9 2 】

30

40

50

【表 3 - 1】

表B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルス・ポリツス (<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>)	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、 サーブスベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカ エデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニ レ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セ イヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナ ナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナ シ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マル メロ、アメリカハナズオウ、サーブス ベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナ ギ
テキサニア・カンペストリス(<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、ス ズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ	
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエス・プルベルレンツス(<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤ ナギ、クロガシワ、アメリカキレハガ シワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、ス ズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>)	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス(<i>Neolytus acuminatus</i>)	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オー ク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、 イースタンホップホーンビーム (Eastern hophornbeam)、ハナミズ キ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイ ラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカ サイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハ リグワ、サッサfras、ライラック、マ ウンテン・マホガニー、セイヨウナ シ、サクランボ、プラム、モモ、リン ゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ
	ネオプチコデス・トリリネツス (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、 ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)
	オベレア・オセラータ(<i>Oberea ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨ ウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
オベレア・トリプンクタータ(<i>Oberea tripunctata</i>)	ハナミズキ、ガマズミ属(<i>Viburnum</i>)、 ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、 シヤクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプ ラ、ヤナギ、クワ	
オンシデレス・シングラータ (<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワ ーウッド、シナノキ、アメリカサイカ チ、ハナミズキ、ユーカリ属	

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
		(Eucalyptus)、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サベルダ・カルカラタ (<i>Saperda calcarata</i>)	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス(<i>Strophiona nitens</i>)	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルテルス・コロンビアヌス(<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ(<i>Dryocoetes betulae</i>)	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリブス・リミナリス (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プルイノスス (<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム(Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランズ(<i>Paranthrene simulans</i>)	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス(<i>Sannina uroceriformis</i>)	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属(<i>Viburnum</i>)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリスチフォルミス(<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

10

20

30

40

【0493】

本発明は、例えば、甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ(ground pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ(southern chinch bug)及び地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0494】

特に、本発明は、地虫(コガネカブト属(*Cyclocephala* spp.))(例え

50

ば、マスクドコガネムシ (*masked chafer*)、*C. lurida* (*C. lurida*)、リゾトログス属 (*Rhizotrogus spp.*) (例えば、ヨーロッパコガネムシ、*R. majalis*)、コチヌス属 (*Cotinus spp.*) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属 (*Popillia spp.*) (例えば、マメコガネ (*Japanese beetle*)、*P. japonica*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga spp.*) (例えば、コガネムシ (*May/June beetle*))、アテニウス属 (*Ataenius spp.*) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (*Black turfgrass ataenius*)、*A. sprretulus*)、マラデラ属 (*Maladera spp.*) (例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea*) 及びトマルス属 (*Tomarus spp.*) など)、ワタフキカイガラムシ (マルガロデス属 (*Margarodes spp.*))、ケラ (タウニー (*tawny*)、サウザン (*southern*) 及び短翅型; スカプテリスクス属 (*Scapteriscus spp.*))、ケラ (*Gryllotalpa africana*) 及びレザージャケット (*leather jacket*) (ヨーロッパクレーンフライ (*European crane fly*))、ガガンボ属 (*Tipula spp.*)) を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

10

【0495】

本発明は、ヨトウムシ (ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) 及び一般的なヨトウムシ (*common armyworm*) (プセウダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*) など)、ネキリムシ、ゾウムシ (スフェノホルス属 (*Sphenophorus spp.*))、シバオサゾウムシ (*S. venatus verstitus*) 及び *S. parvulus*) など) 及びソッドウェブワーム (*sod webworm*) (クラムブス属 (*Crambus spp.*)) 及び熱帯ソッドウェブワーム (*tropical sod webworm*)、ケナシクロオビクロノメイガ (*Herpetogramma phaeopteralis*) など) を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

20

【0496】

本発明は、ヒメコガネナガカメムシ (サウザンキンクバグ、ブリスス・インストラリス (*Blissus insularis*) など)、ギョウギシバ (*Bermudagrass*) のダニ (エリオフィエス・シノドニエンシス (*Eriophyes cynodonensis*))、アフリカヒゲシバ (*rhodesgrass*) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (*Antonina graminis*))、2本線のあるアワフキムシ (*two-lined spittlebug*) (プロサピア・ビシンクタ (*Prospapia bicincta*))、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (*Noctuidae*)) 及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

30

【0497】

本発明は、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (*Solenopsis invicta*) など、芝草の他の有害生物を防除するのにも使用され得る。

40

【0498】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (*hard tick*)、ヒメダニ (*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (*licking*) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

【0499】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目 (*Anoplurida*) のうち、ブタジラミ属 (*Haematopinus*

50

spp.)、ホソジラミ属 (*Linognathus* spp.)、ペディクルス属 (*Pediculus* spp.) 及びケジラミ属 (*Phtirus* spp.)、ソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0500】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) のうち、トリメノポン属 (*Trimenopon* spp.)、タンカクハジラミ属 (*Menopon* spp.)、トリノトン属 (*Trinoton* spp.)、ボビコラ属 (*Bovicola* spp.)、ウエルネツキエラ属 (*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属 (*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属 (*Damalina* spp.)、トリコデクテス属 (*Trichodectes* spp.) 及びフェリコラ属 (*Felicola* spp.)。 10

【0501】

双翅目 (*Diptera*) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) 及び短角亜目 (*Brachycerina*) のうち、例えばヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、ブヨ属 (*Simulium* spp.)、ツノマユブユ属 (*Eusimulium* spp.)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus* spp.)、ルツオミヤ属 (*Lutzomyia* spp.)、キュリコイデス属 (*Culicoide*s spp.)、メクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra* spp.)、キイロアブ属 (*Atylotus* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、ゴマフアブ属 (*Haematopota* spp.)、フィリボミア属 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属 (*Braula* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、トゲアシメマトイ属 (*Hydrotaea* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、ヘマトピア属 (*Haematobia* spp.)、モレリア属 (*Morellia* spp.)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、オオクロバエ属 (*Calliphora* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp.)、ニクバエ属 (*Sarcophaga* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp.)、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp.)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp.) 及びヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。 20 30

【0502】

ノミ目 (*Siphonapterida*) のうち、例えばヒトノミ属 (*Pulex* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.)、ネズミノミ属 (*Xenopsylla* spp.)、ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)。

【0503】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えばトコジラミ属 (*Cimex* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。 40

【0504】

ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (*Blattia orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 及びスベラ属 (*Supella* spp.)。

【0505】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) 並びにマダニ亜目 (*Metastigmata*) 及び中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えばナガヒメダニ属 (*A* 50

rgas spp.）、カズキダニ属 (*Ornithodorus* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Hae mophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Derma nyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Railletia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Stern ostoma* spp.) 及びバロア属 (*Varroa* spp.)。

【0506】

ダニ目 (*Actinedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) 及びカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えばアカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属 (*Trombic ula* spp.)、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp.)、コナダニ属 (*Acarus* spp.)、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属 (*Hypo dectes* spp.)、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キ 20 ュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (*Ch orioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp.)、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp.)、シヨウセンコウヒゼンダニ属 (*Not oedres* spp.)、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.) 及びラミノシオプテス属 (*Lam inosioptes* spp.)。

【0507】

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適である。

【0508】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chl orophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium ruf o villosum*)、プチリヌスペクチコルニス (*Ptilinuspecticorn is*)、デンドロビウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Pri obium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキ 40 クイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyct us linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテス ルギコリス (*Minthesrugicollis*)、キシルボルス属種 (*Xylebo rus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシン ス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sino xy lon spec.*) 及びチビタケナガシンクイムシ (*Dinoderus min utus*) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (*Sirex juvenicus*)、モ 50

10

20

30

40

50

ミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) 及びウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (hymenopteran) 並びにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kalotermes flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heterotermes indicola*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastrotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) 及びイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、科：ヤガ科 (*Noctuidae*)、クチブサガ科 (*Plutellidae*)、ハムシ科 (*Chrysomelidae*)、アザミウマ科 (*Thripidae*)、カメムシ科 (*Pentatomidae*)、ハマキガ (*Tortricidae*)、ウンカ科 (*Delphacidae*)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ヤガ科 (*Noctuidae*)、ツトガ科 (*Crambidae*)、ロイドギネ科 (*Meloidogynidae*) 及びシストセンチュウ科 (*Heteroderidae*) から選択される 1 種以上の有害生物の防除に特に好適である。各態様の好ましい実施形態において、化合物 TX (ここで、「TX」という略語は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P に定義される化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) は、科：ヤガ科 (*Noctuidae*)、クチブサガ科 (*Plutellidae*)、ハムシ科 (*Chrysomelidae*)、アザミウマ科 (*Thripidae*)、カメムシ科 (*Pentatomidae*)、ハマキガ (*Tortricidae*)、ウンカ科 (*Delphacidae*)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ヤガ科 (*Noctuidae*)、ツトガ科 (*Crambidae*)、ロイドギネ科 (*Meloidogynidae*) 及びシストセンチュウ科 (*Heteroderidae*) から選択される 1 種以上の有害生物を防除する。

【0509】

式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、属：スポドプテラ属の種 (*Spodoptera* spp)、プルテラ属の種 (*Plutella* spp)、ハナアザミウマ属の種 (*Frankliniella* spp)、トリプス属の種 (*Thrips* spp)、ユースキスツス属の種 (*Euschistus* spp)、シジア属の種 (*Cydia* spp)、ニラバルバタ属の種 (*Nilaparvata* spp)、ミズス属の種 (*Myzus* spp)、ワタアブラムシ属の種 (*Aphis* spp)、ジアブロチカ属の種 (*Diabrotica* spp)、ロパロシフム属の種 (*Rhopalosiphum* spp)、シュードブルシア属の種 (*Pseudoplusia* spp) 及びキ口属の種 (*Chilo* spp) から選択される 1 種以上の有害生物の防除に特に好適である。各態様の好ましい実施形態において、化合物 TX (ここで、「TX」という略語は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P に定義される化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) は、属：スポドプテラ属の種 (*Spodoptera* spp)、プルテラ属の種 (*Plutella* spp)、ハナアザミウマ属の種 (*Frankliniella* spp)、トリプス属の種 (*Thrips* spp)、ユースキスツス属の種 (*Euschistus* spp)、シジア属の種 (*Cydia* spp)、ニラバルバタ属の種 (*Nilaparvata* spp)、ミズス属の種 (*Myzus* spp)、ワタアブラムシ属の種 (*Aphis* spp)、ジアブロチカ属の種 (*Diabrotica* spp)、ロパロシフム属の種 (*Rhopalosiphum* spp)、シュードブルシア属の種 (*Pseudoplusia* spp) 及びキ口属の種 (*Chilo* spp) から選択される 1 種以上の有害生物を防除する。

【0510】

式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*)、コドリング (*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス (*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウムパディ (*Rhopalosiphum padi*) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) の 1 種以上の防除に特に好適である。 10

【0511】

各態様の好ましい実施形態において、化合物 TX (ここで、「TX」という略語は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P に定義される化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) は、エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*)、コドリング (*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス (*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウムパディア (*Rhopalosiphum Padia*) 並びにエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) + TX などのニカメイガ (*Chilo suppressalis*) ; ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) + TX、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*) + TX、ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) + TX、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) + TX、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) + TX、クリソデイキスインクルデンス (*Chrysodeixis includens*) + TX、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*) + TX、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) + TX、ロパロシフウムパディ (*Rhopalosiphum Padi*) + TX 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) + TX の 1 種以上を防除する。 20 30

【0512】

各態様の一実施形態において、表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P に定義される化合物から選択される 1 種の化合物は、綿、野菜、トウモロコシ、穀類、イネ及びダイズ作物における、エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*)、コドリング (*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス (*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウムパディア (*Rhopalosiphum Padia*) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) の防除に好適である。 40

【0513】

一実施形態において、表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P に定義される化合物から選択される 50

1種の化合物は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に好適である。

【0514】

本発明に係る化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの生物学的活性又は農芸化学的有効成分として用いられるための優れた特性 (例えば、高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル (地上及び地下の非標的生物 (魚類、鳥類及びハチ類など) に対して、向上した物理化学的特性又は高い生分解性) を含むいずれかの数の有益性を有し得る。特に、特定の式 (I) の化合物は、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者といった非標的節足動物に対して有利な安全性プロファイルを示し得ることが意外なことに見出された。最も具体的には、セイヨウミツバチ (*Apis mellifera*) である。

10

【0515】

本発明に係る化合物は、未変性の形態で殺有害生物剤として使用可能であるが、これらは、一般に、種々の方法でキャリア、溶剤及び表面活性物質などの配合助剤を用いて組成物に配合される。配合物は、例えば、散粉粉末、ゲル、水和剤、水分散性顆粒、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油型エマルジョン、油性フロアブル、水性分散体、油性分散体、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化性顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮物 (キャリアとして水又は水和性の有機溶剤を含む)、含浸ポリマーフィルムの形態又は例えば *the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010)* から公知である他の形態といった種々の物理的形態であり得る。このような配合物は、直接用いられるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量元素、生物学的生体、油又は溶剤により行うことが可能である。

20

【0516】

配合物は、例えば、微細固形分、顆粒、溶液、分散体又はエマルジョンの形態で組成物を得るために、有効成分を配合助剤と混合することにより調製可能である。有効成分は、微細固形分、鉱油、植物性油若しくは動物性油、植物性変性油若しくは動物性変性油、有機溶剤、水、表面活性物質又はこれらの組み合わせなどの他の補助剤とも配合可能である。

30

【0517】

有効成分は、きわめて微細なマイクロカプセル中にも含まれ得る。マイクロカプセルは、多孔性キャリア中に有効成分を含有する。これにより、有効成分を、制御された量 (例えば、緩効性) で環境中に放出させることが可能である。マイクロカプセルは、通常、0.1 ~ 500 ミクロンの直径を有する。これらは、有効成分をカプセル重量基準で約 25 ~ 95 重量% の量で含有する。有効成分は、一塊の固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微細な粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入メンブランは、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン又は化学変性ポリマー及びキサントゲン酸デンプン又は当業者に公知である他のポリマーを含むことが可能である。代わりに、きわめて微細なマイクロカプセルは、基剤の固体マトリックス中に微細粒子の形態で有効成分を含有して形成され得るが、マイクロカプセル自体は、封入されていない。

40

【0518】

本発明に係る組成物の調製に好適である配合助剤は、それら自体公知である。液体キャリアとしては、水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチル

50

ケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、ブチレンカーボネート、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチル-ホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロールアセテート、グリセロールジアセテート、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、プロピル乳酸塩、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチル-2-ピロリドンなどの高分子量アルコール等が用いられ得る。

10

20

【0519】

好適な固体キャリアは、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、石灰岩、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿殻、コムギ粉、ダイズ粉、軽石、木粉、粉碎したクルミの殻、リグニン及び同様の物質である

30

【0520】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方において、特に使用前にキャリアで希釈可能である配合物で有利に用いられ得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子であり得、これらは、乳化剤、湿潤剤若しくは懸濁剤として又は他の目的のために用いられ得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ジエタノールアンモニウムラウリルスルフェートなどのアルキルスルフェートの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアールスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール/アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール/アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどのセッケン；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホネートの塩；ジ(2-エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレアートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノ-及びジ-アルキルホスフェートエステルの塩；並びに例えば *McCUTCHEON'S Detergents and Emulsifiers Annual*, M C Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載のさらなる物質が挙げられ

40

50

る。

【0521】

有害生物防除配合物において用いられ得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁剤、染料、抗酸化剤、発泡剤、吸光剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、芳香剤、湿潤剤、取り込み増強剤、微量元素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられる。

【0522】

本発明に係る組成物は、植物性油又は動物性油、鉱油、このような油のアルキルエステル又はこのような油及び油誘導体の混合物を含む添加剤を含むことが可能である。本発明に係る組成物における油添加剤の量は、一般に、適用される混合物に基づいて0.01~10%である。例えば、油添加剤は、噴霧混合物が調製された後、噴霧タンク中に所望の濃度で添加することが可能である。好ましい油添加剤は、鉱油又は例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油といった植物性油、乳化植物油、例えばメチル誘導体といった植物性油のアルキルエステル又は魚油若しくは牛脂などの動物性油を含む。好ましい油添加剤は、C₈~C₂₂脂肪酸のアルキルエステル、特にC₁₂~C₁₈脂肪酸のメチル誘導体であり、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル(それぞれラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル)を含む。多くの油誘導体は、*the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010*から公知である。

【0523】

本発明の組成物は、一般に、0.1~99重量%、特に0.1~95重量%の本発明の化合物と、1~99.9重量%の配合助剤(これは、0~25重量%の表面活性物質を含むことが好ましい)とを含む。商業用の製品は、濃縮物として配合されることが好ましいことがあり得るが、エンドユーザーは、通常、希釈配合物を利用することとなる。

【0524】

適用量は、幅広い範囲内で様々であり、土壌の性質、適用方法、作物植物、防除される有害生物、主な気象条件並びに適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。一般的なガイドラインのとおり、化合物は、1~2000l/ha、特に10~1000l/haの量で適用され得る。

【0525】

好ましい配合物は、以下の組成(重量%)を有することが可能である。

乳化性濃縮物:

有効成分: 1~95%、好ましくは60~90%

表面活性薬剤: 1~30%、好ましくは5~20%

液体キャリア: 1~80%、好ましくは1~35%

【0526】

粉剤:

有効成分: 0.1~10%、好ましくは0.1~5%

固体キャリア: 99.9~90%、好ましくは99.9~99%

【0527】

懸濁液濃縮物:

有効成分: 5~75%、好ましくは10~50%

水: 94~24%、好ましくは88~30%

表面活性薬剤: 1~40%、好ましくは2~30%

【0528】

水和剤:

有効成分: 0.5~90%、好ましくは1~80%

表面活性薬剤: 0.5~20%、好ましくは1~15%

10

20

30

40

50

固体キャリア：5～95%、好ましくは15～90%

【0529】

顆粒：

有効成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体キャリア：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0530】

以下の例は、本発明をさらに例示するが、限定するものではない。

【0531】

【表4】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分	25%	50%	75%
リグノスルホン酸ナトリウム	5%	5%	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3%	-	5%
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	-	6%	10%
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7~8 mol のエチレンオキシド)	-	2%	-
高分散ケイ酸	5%	10%	10%
カオリン	62%	27%	-

10

20

【0532】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤を得る。

【0533】

【表5】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分	25%	50%	75%
軽油	5%	5%	5%
高分散ケイ酸	5%	5%	-
カオリン	65%	40%	-
タルカム	-	-	20%

30

【0534】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接利用することが可能である粉末を得る。

【0535】

40

50

【表 6】

乳化性濃縮物	
有効成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4~5 molのエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ひまし油ポリグリコールエーテル(35 molのエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

10

【0536】

植物の保護に使用可能である、いずれかの必要とされる希釈度のエマルジョンは、水で希釈することによりこの濃縮物から入手が可能である。

【0537】

【表 7】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	-	--
カオリン	-	94 %	-
無機充填材	-	-	96 %

20

【0538】

直ちに使用可能な粉剤は、複合物をキャリアと混合し、この混合物を好適なミル中において粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いることができる。

【0539】

【表 8】

押出し顆粒	
有効成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

30

【0540】

複合物を補助剤と混合及び粉砕し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで空気流中において乾燥させる。

40

【0541】

【表 9】

被覆顆粒	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(mol. wt. 200)	3 %
カオリン	89 %

50

【0542】

ミキサ中において、微細に粉碎した複合物を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉塵を発生させないコーティングされた顆粒がこれにより得られる。

【0543】

【表10】

懸濁液濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 molのエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油(水中の75%エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

10

【0544】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することによりいずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いて、生存している植物及び植物繁殖体を、吹付け、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による外寄生に対して処理及び保護することが可能である。

20

【0545】

【表11】

種子処理用のフロアブル濃縮物

活性成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノール PO/EO	2 %
10~20 モルの EO を含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

30

【0546】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

40

【0547】

緩効性カプセル懸濁液

28部の複合物を2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化する。このエマルジョンに5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することによ

50

り安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中型カプセルの直径は、8~15ミクロンである。得られる配合物を、この目的に好適である装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0548】

配合タイプとしては、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性フロアブル(OF)、油混和性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、可溶性顆粒(SG)又は農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

10

【実施例】

【0549】

調製例：

LCMS法：

方法1：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50l/h、脱溶剤ガス流：650l/h、質量範囲：100~900Da)を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分光計)並びにWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8μm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210~500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：1.2分間で10~100%のB；流れ(ml/分)0.85。

20

【0550】

方法2：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン)、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50l/h、脱溶剤ガス流：650l/h、質量範囲：100~900Da)を備えるWater製の質量分析計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分析計)並びにWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8μm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210~500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：2.7分間で10~100%のB；流れ(ml/分)0.85。

30

【0551】

方法3：

質量分析計：Waters SQ Detector 2質量分析計

HPLC：Quaternary Gradientを備えたUPLC「H」クラス

最適化された質量パラメータ：-

イオン化方法：エレクトロスプレー(ESI)

極性：陽及び陰極性スイッチ

スキャンタイプ：全スキャン

キャピラリ(kV)：3.00

コーン電圧(V)：41.00

ソース温度()：150

40

50

脱溶剤ガス流 (L / H r) : 1 0 0 0

脱溶剤温度 () : 5 0 0

ガス流@コーン (L / H r) : 5 0

質量範囲 : 1 1 0 ~ 8 0 0 D a

最適化されたクロマトグラフィパラメータ : -

勾配条件 :

溶剤 A : 0 . 1 % のギ酸を含む水 : アセトニトリル : : 9 5 : 5 v / v

溶剤 B : 0 . 0 5 % のギ酸を含むアセトニトリル

時間 (分) A (%) B (%) 流量 (m l / 分)

0 9 0 1 0 0 . 6

0 . 2 5 0 5 0 0 . 6

0 . 7 0 1 0 0 0 . 6

1 . 3 0 1 0 0 0 . 6

1 . 4 9 0 1 0 0 . 6

1 . 6 9 0 1 0 0 . 6

P D A 波長範囲 : 2 0 0 ~ 4 0 0 n m

カラム : A c q u i t y U P L C H S S T 3 C 1 8

カラム長さ : 3 0 m m

カラムの内径 : 2 . 1 m m

粒径 : 1 . 8 μ

カラムオープン温度 : 4 0

【 0 5 5 2 】

方法 4 :

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性 : 陽イオン又は陰イオン、M S 2 スキャン、キャピラリ : 4 . 0 0 k V、フラグメンタ : 1 0 0 V、脱溶剤温度 3 5 0 、ガス流 : 1 1 L / 分、ネブライザガス : 4 5 p s i、質量範囲 : 1 1 0 ~ 1 0 0 0 D a) を備える A g i l e n t T e c h n o l o g i e s 製の質量分析計 (6 4 1 0 トリプル四重極質量分析計) 並びに A g i l e n t 製の 1 2 0 0 S e r i e s H P L C : クォータナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード - アレイ検出器で記録した。カラム : K I N E T E X E V O C 1 8、2 . 6 μ m、5 0 × 4 . 6 m m、温度 : 4 0、D A D 波長範囲 (n m) : 2 1 0 ~ 4 0 0、溶剤勾配 : A = 水 + 5 % アセトニトリル + 0 . 1 % H C O O H、B = アセトニトリル + 0 . 1 % H C O O H : 勾配 : 0 分間 0 % の B、1 0 0 % の A ; 0 . 9 ~ 1 . 8 分間 1 0 0 % の B ; 流れ (m L / 分) 1 . 8。

【 0 5 5 3 】

実施例 1 : N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P 2 0) の調製

10

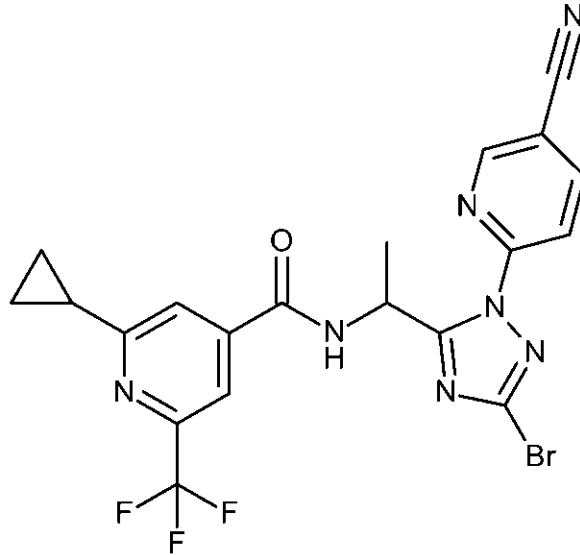
20

30

40

50

【化 4 9】



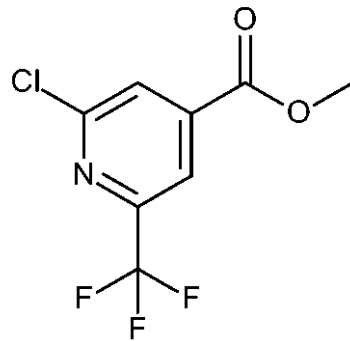
(P20)

10

ステップ A 1 : メチル 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (中間体 I 1) の調製

20

【化 5 0】



(I1)

30

硫酸 (2 . 4 6 m L 、 4 4 . 3 m m o l 、 1 . 0 0 当量) を、メタノール (2 6 6 m L) 中の 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボン酸 (C A S 7 9 6 0 9 0 - 2 3 - 8 、 1 0 . 0 g 、 4 4 . 3 m m o l) の溶液に、室温で滴下して添加した。反応混合物を 6 5 まで加熱し、一晩攪拌した。室温に冷却した後、反応混合物を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、水性相をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、所望の生成物 (1 0 . 2 g 、 4 2 . 7 0 m m o l) を得て、これをさらに精製せずに用いた。

$^1\text{H NMR}$ (4 0 0 M H z 、 クロロホルム - d) p p m : 4 . 0 4 (s , 3 H) 8 . 1 1 (s , 1 H) 8 . 1 7 (d , J = 1 . 1 0 H z 、 1 H) .

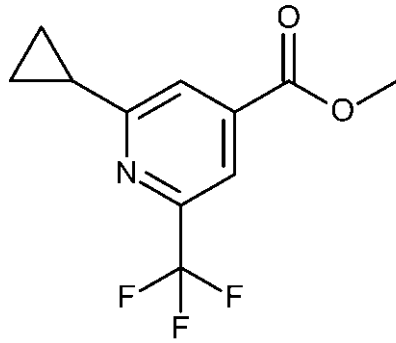
40

【 0 5 5 4】

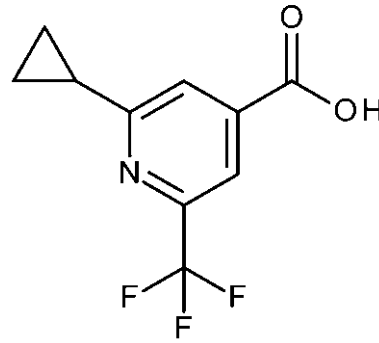
ステップ A 2 : メチル 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (中間体 I 2) 及び 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボン酸 (中間体 I 3) の調製

50

【化 5 1】



(12)



(13)

10

シクロプロピルボロン酸 (1.43 g、16.7 mmol、2.00 当量) 及び炭酸水素ナトリウム (2.10 g、25.1 mmol、3.00 当量) を、1,4-ジオキサン (20.9 mL) 及び水 (8.35 mL) 中のメチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (上記のとおり調製された中間体 I 1) (2.00 g、8.35 mmol) の溶液に添加し、得られた懸濁液を、10 分間にわたってアルゴンでフラッシュした。[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) (0.322 g、0.417 mmol、0.05 当量) を添加し、得られた懸濁液を、アルゴン下で 1 時間にわたって 100 で攪拌した。室温に冷却した後、反応混合物を水でクエンチし、酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、第 1 の粗材料を得て、これは、シリカゲル (シクロヘキサン中の酢酸エチル) におけるフラッシュクロマトグラフィによる精製の後、所望の中間体 I 2 (0.706 g、2.88 mmol) を生じた。

20

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.04 - 1.23 (m, 4H) 2.14 - 2.28 (m, 1H) 4.00 (s, 3H) 7.88 (s, 1H) 7.95 (d, $J = 1.47$ Hz, 1H).

LC-MS (方法 4): 保持時間 1.12 分、 m/z 246 [M+H]⁺。

【0555】

pH 1 までの酸性化の後、水性層を、酢酸エチルで再度 2 回抽出し、組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、第 2 の粗材料を得て、これは、シリカゲル (ジクロロメタン中のメタノール) におけるフラッシュクロマトグラフィによる精製後、中間体 I 3 (0.166 g、0.718 mmol) を生じた。

30

^1H NMR (400 MHz、ジメチルスルホキシド-d₆) ppm: 0.94 - 1.03 (m, 2H) 1.06 - 1.15 (m, 2H) 2.37 - 2.46 (m, 1H) 7.88 (d, $J = 1.10$ Hz, 1H) 8.05 (d, $J = 0.73$ Hz, 1H) 13.89 - 14.33 (m, 1H).

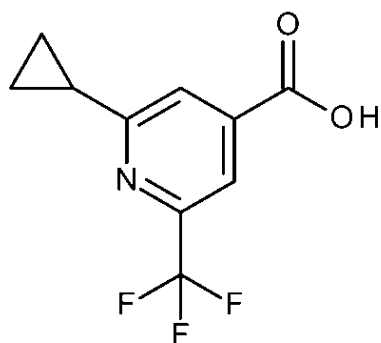
LC-MS (方法 4): 保持時間 0.94 分、 m/z 232 [M+H]⁺。

【0556】

ステップ A 3: 2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸 (中間体 I 3) の調製

40

【化52】



(13)

10

水酸化リチウム一水和物 (0.147 g、3.43 mmol、1.20 当量) を、3 : 1 テトラヒドロフラン / 水混合物 (24.5 mL) 中のメチル 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (上記のとおり調製された中間体 I 2) の溶液に添加した。室温で 2 時間攪拌した後、反応混合物を濃縮し、残っている水性相を、1 M の塩酸水溶液 (3.43 mL) の添加によって pH 1 になるまで酸性化した。水性層を、酢酸エチルで 3 回抽出し、組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させる過し、濃縮して、2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボン酸を得た。

20

^1H NMR (400 MHz、ジメチルスルホキシド - d_6) ppm : 0.96 - 1.02 (m, 2H) 1.07 - 1.15 (m, 2H) 2.40 (tt, $J_1 = 8.12$ Hz、 $J_2 = 4.72$ Hz、1H) 7.88 (d, $J = 1.10$ Hz、1H) 8.04 (s, 1H) 13.90 - 14.36 (m, 1H)

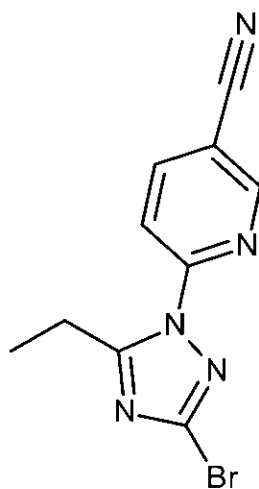
LC - MS (方法 4) : 保持時間 0.94 分、 m/z 232 [M + H]⁺。

【0557】

ステップ B 1 : 6 - (3 - ブロモ - 5 - エチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 3 - カルボニトリル (中間体 I 4) の調製

【化53】

30



(14)

40

アルゴン下で、水素化ナトリウムをバイアルに入れ、乾燥ジメチルホルムアミド (20 mL) を添加した。乾燥ジメチルホルムアミド (6.0 mL) 中の 3 - ブロモ - 5 - エチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール (CAS : 15777 - 58 - 9、1.00 g、5.68 mmol) の溶液を、室温で少しずつ添加した。反応混合物を室温で 30 分間攪拌してから、6 - ブロモピリジン - 3 - カルボニトリル (CAS : 139585 - 70 - 9、

50

1.25 g、6.82 mmol)を添加し、得られた混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、有機層を、水(5×20 mL)、塩水で1回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、6-(3-プロモ-5-エチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-カルボニトリルを得た。

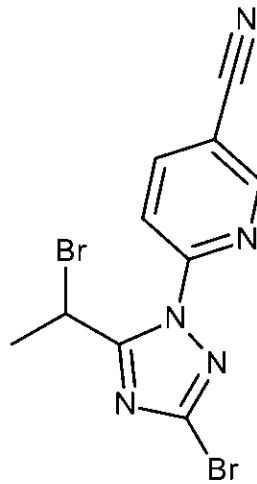
$^1\text{H NMR}$ (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.43 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 3.37 (q, J = 7.58 Hz, 2H) 8.07 - 8.12 (m, 1H) 8.12 - 8.19 (m, 1H) 8.76 - 8.83 (m, 1H).

LC-MS (方法4): 保持時間 0.93分、m/z 280 [M+H⁺].

【0558】

ステップB2: 6-[3-プロモ-5-(1-プロモエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル(中間体I5)の調製

【化54】



(15)

アセトニトリル(12 mL)中の6-(3-プロモ-5-エチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-カルボニトリル(0.98 g、3.52 mmol)、N-ブロモスクシンイミド(1.94 g、10.6 mmol、3.01当量)及び過酸化ベンゾイル(0.014 g、0.056 mmol、0.016当量)の混合物を、14時間にわたって密閉バイアル中で加熱還流させた。N-ブロモスクシンイミド(0.323 g、1.76 mmol、0.50当量)及び過酸化ベンゾイル(0.029 g、0.112 mmol、0.032当量)を再度添加し、バイアルをアルゴンでパージし、閉じ、さらに2時間にわたって80℃まで加熱した。反応混合物を減圧下で濃縮し、次に、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、6-[3-プロモ-5-(1-プロモエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリルを得た。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 2.22 (d, J = 6.97 Hz, 3H) 6.37 (q, J = 6.97 Hz, 1H) 8.08 - 8.14 (m, 1H) 8.16 - 8.23 (m, 1H) 8.84 (d, J = 1.47 Hz, 1H).

LC-MS (方法4): 保持時間 1.02分、m/z 356 - 358 - 360 [M+H⁺].

【0559】

ステップB3: 6-[5-(1-アミノエチル)-3-プロモ-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル臭化水素酸塩(中間体I6)の調製

10

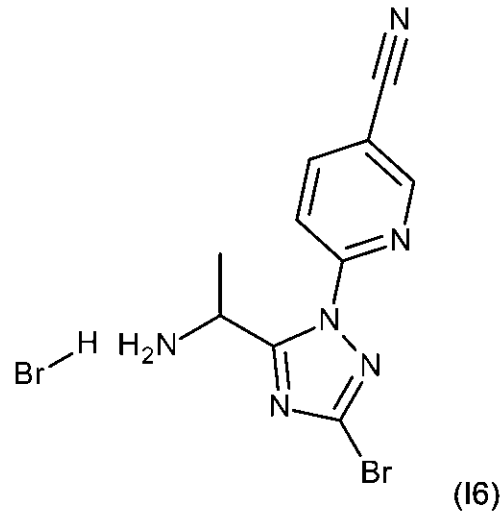
20

30

40

50

【化 5 5】



10

アンモニア溶液（メタノール中 7 M、2.9 mL）中の 6 - [3 - ブロモ - 5 - (1 - ブロモエチル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル (0.57 g、1.596 mmol) の混合物を室温で 15 時間攪拌した。反応混合物を蒸発させ、粗生成物として次のステップに使用した。

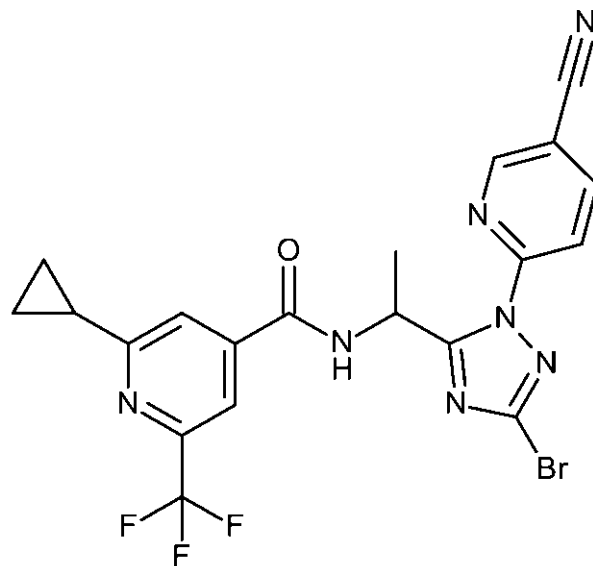
20

LC - MS (方法 4) : 保持時間 0.66 分、 m/z 293 [M + H⁺] (臭化水素酸塩を含まない)。

【 0 5 6 0 】

ステップ C : N - [1 - [5 - ブロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P 2 0) の調製

【化 5 6】



30

40

N - エチル - N - イソプロピル - プロパン - 2 - アミン (0.130 mL、0.746 mmol) を、アセトニトリル (2.49 mL) 中の 6 - [5 - (1 - アミノエチル) - 3 - ブロモ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル臭化水素酸塩 (中間体 I 6、0.093 g、0.249 mmol、1.00 当量) の溶液に添加した。室温で 10 分間攪拌した後、2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピ

50

リジン - 4 - カルボン酸 (中間体 I 3、0.063 g、0.274 mmol、1.10 当量) を添加し、続いて H A T U (0.127 g、0.323 mmol、1.30 当量) を添加した。得られた混合物を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を冷水に注ぎ、水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキサミドを得た。

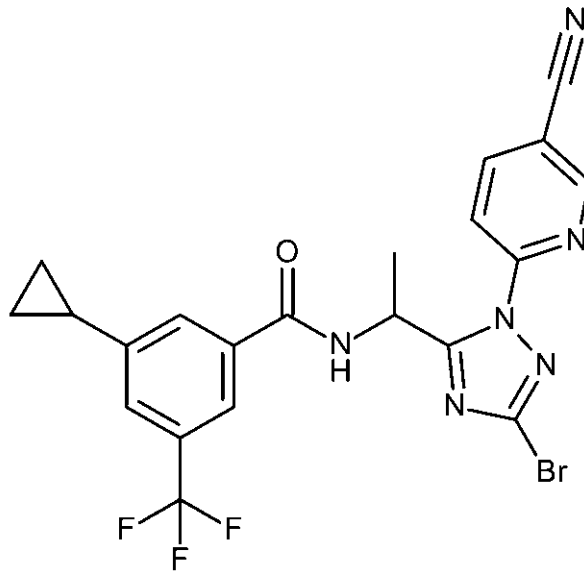
^1H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm: 1.05 - 1.22 (m, 4H) 1.76 (d, J = 6.97 Hz、3H) 2.13 - 2.23 (m, 1H) 6.39 - 6.51 (m, 1H) 7.37 (br d, J = 8.07 Hz、1H) 7.66 (s, 1H) 7.71 (d, J = 1.47 Hz、1H) 8.14 (dd, $J_1 = 8.44$ Hz、 $J_2 = 0.73$ Hz、1H) 8.19 - 8.26 (m, 1H) 8.88 (dd, J = 2.20、0.73 Hz、1H) .

LC - MS (方法 4) : 保持時間 1.13 分、m/z 506 - 508 [M + H]⁺ .

【0561】

実施例 2 : N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 19) の調製

【化 57】



(P19)

ステップ 1 : メチル 3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (中間体 I 7) の調製

10

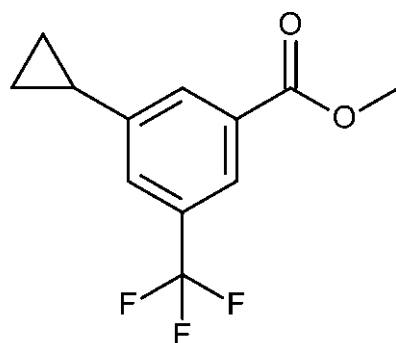
20

30

40

50

【化58】



(17)

10

トルエン中の臭化プロパルギルの溶液（80重量%、0.89g、0.67mL）を、アルゴン下で26mLの乾燥テトラヒドロフラン中の9-BBN二量体（3.0g、12mmol）の白色の懸濁液に添加して、淡黄色の溶液を得た。混合物を2時間にわたって還流させ、次に、室温に冷却した。予め脱気した水酸化ナトリウムの4M水溶液（4.4mL、18mmol）を添加して、濁った無色の溶液を得た。得られた混合物を、アルゴン下で、室温で1時間攪拌した。次に、得られた非常に淡い黄色の溶液を、52mLの乾燥テトラヒドロフラン中のメチル3-プロモ-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエート（187331-46-0、1.5g、5.2mmol）及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)（0.30g、0.26mmol）の予め脱気した淡黄色の溶液に添加して、淡黄色の溶液を得た。得られた混合物を還流しながら19時間攪拌した。混合物を室温で冷却し、酢酸エチルで希釈し、水(+数滴の塩水)でクエンチし、水性層を酢酸エチルで2回抽出した。有機層を組み合わせ、塩水で1回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、60℃で、減圧下で蒸発させた。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエートを無色の液体として得た。

20

^1H NMR (400MHz、クロロホルム-d) ppm: 0.76-0.85 (m, 2H) 1.06-1.15 (m, 2H) 2.03 (tt, $J_1=8.39\text{Hz}$, $J_2=5.00\text{Hz}$, 1H) 3.96 (s, 3H) 7.52 (s, 1H) 7.91 (s, 1H) 8.08 (d, $J=0.73\text{Hz}$, 1H).

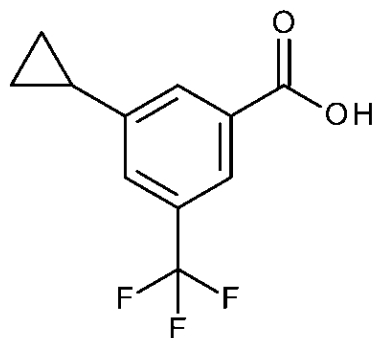
30

^{19}F NMR (377MHz、クロロホルム-d) ppm: -62.75 (s, 3F).

【0562】

ステップ2: 3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸(中間体I8)の調製

【化59】



(18)

40

メチル3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエート(7.00g、28.7mmol)を、テトラヒドロフラン(57.3mL)及び水(28.7mL)に溶

50

解させた。次に、水酸化リチウム (1.21 g、28.7 mmol) を添加し、得られた淡黄色の濁った溶液を、室温で4時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル及び水で希釈した。有機相を水で2回洗浄した。組み合わせた水性層を、1 Nの塩酸水溶液で、pH 1~2になるまで酸性化し、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で1回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、60℃で、減圧下で濃縮して、3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸を得て、これをさらに精製せずに用いた。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz、ジメチルスルホキシド- d_6) ppm: 0.79 - 0.85 (m, 2H) 1.03 - 1.10 (m, 2H) 2.12 - 2.22 (m, 1H) 7.70 (s, 1H) 7.88 (s, 1H) 7.93 (s, 1H) 13.47 (br s, 1H) .

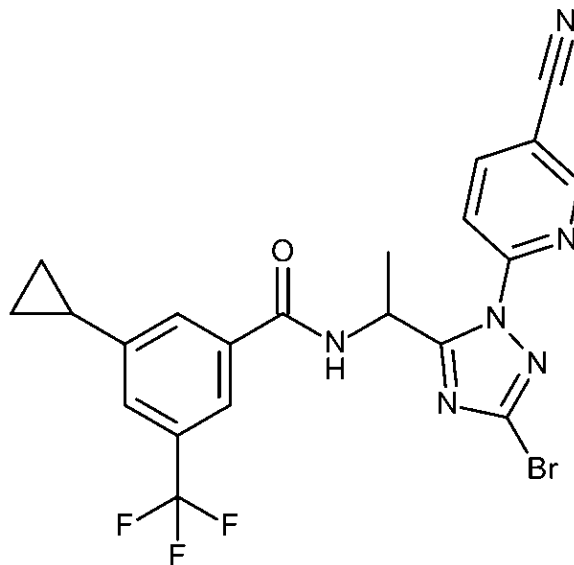
10

LC-MS (方法4) : 保持時間 0.99分、 m/z 229 [M-H]⁻。

【0563】

ステップ3 : N-[1-[5-プロモ-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P19)の調製

【化60】



20

30

(P19)

所望の生成物を、実施例1のステップCに記載される条件を用いて調製して、N-[1-[5-プロモ-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを得た。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz、クロロホルム- d) ppm: 0.57 - 0.90 (m, 2H) 0.91 - 1.24 (m, 2H) 1.76 (br d, $J = 6.60$ Hz, 3H) 1.90 - 2.21 (m, 1H) 6.23 - 6.64 (m, 1H) 7.09 - 7.25 (m, 1H) 7.36 - 7.54 (s, 1H) 7.60 - 7.72 (s, 1H) 7.74 - 7.88 (s, 1H) 8.01 - 8.16 (m, 1H) 8.17 - 8.35 (m, 1H) 8.73 - 9.10 (s, 1H) .

40

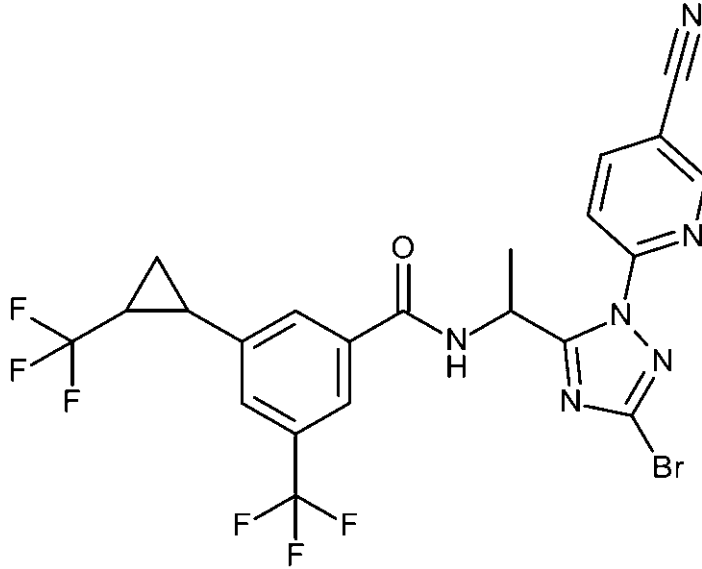
LC-MS (方法4) : 保持時間 1.15分、 m/z 505 - 507 [M+H]⁺。

【0564】

実施例3 : N-[1-[5-プロモ-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド(化合物P16)の調製

50

【化 6 1】



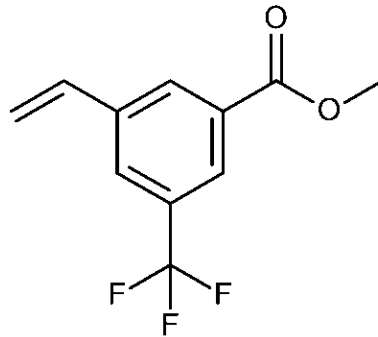
(P16)

10

ステップ 1 : メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - ビニル - ベンゾエート (中間体 I 9) の調製

20

【化 6 2】



(I9)

30

アルゴン下で、三口フラスコ中で、メチル 3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (CAS : 187331-46-0、20 g、69.24 mmol) を、トルエン (312 mL) に溶解させた。次に、トリブチル (ビニル) スズ (25.56 mL、83.09 mmol) を添加し、得られた溶液を、10 分間にわたってアルゴンで脱気した。テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (0.816543 g、0.69 mmol) を添加し、得られた混合物を 110 で 2 時間攪拌した。室温で冷却した後、混合物を酢酸エチル (100 mL) で希釈し、セライトのパッドに通してろ過し、酢酸エチルで洗浄し、ろ液を減圧下で濃縮した。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - ビニル - ベンゾエートを得た。

40

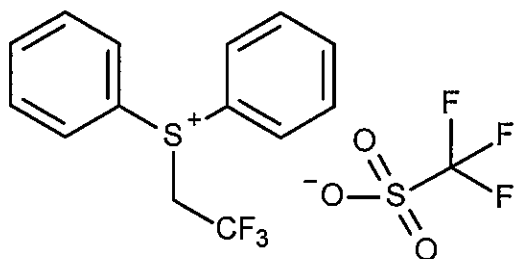
¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm : 3.98 (s, 3H) 5.47 (d, J = 11.00 Hz, 1H) 5.93 (d, J = 17.61 Hz, 1H) 6.79 (dd, J₁ = 17.42 Hz, J₂ = 10.82 Hz, 1H) 7.82 (s, 1H) 8.19 (s, 1H) 8.24 - 8.29 (m, 1H) .

【0565】

ステップ 2 : ジフェニル (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) スルホニウムトリフルオロメタン スルホネートの調製

50

【化 6 3】



10

オートクレーブ中で、硫化ジフェニル (36.43 mL、211.1 mmol) 及び 2, 2, 2 - トリフルオロエチルトリフルオロメタンスルホネート (6.207 mL、42.22 mmol) を混合した。混合物を室温で2分間攪拌し、次に、オートクレーブを閉め、150 で20時間加熱した。反応物を室温で冷却し、白色の沈殿物が形成された。75 mL のジエチルエーテルを添加し、次に、白色の固体をろ過した。それを30 mL のジエチルエーテルで4回洗浄し、次に、減圧下で乾燥させた。

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm: 5.78 (d, $J = 8.80$ Hz、2H) 7.89 (d, $J = 8.07$ Hz、4H) 7.93 - 8.00 (m, 2H) 8.37 (dd, $J_1 = 8.62$ Hz、 $J_2 = 1.28$ Hz、4H) .

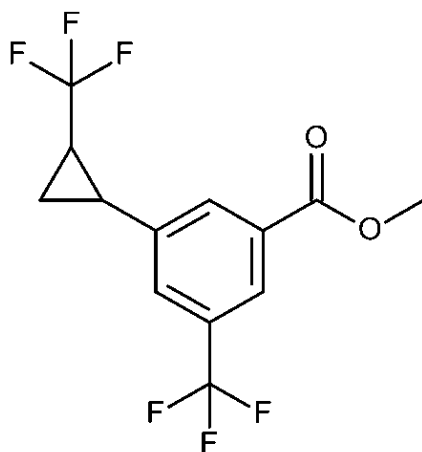
^{19}F NMR (377 MHz、クロロホルム - d) ppm: -78.91 (s, 3F) - 61.26 (s, 3F) .

20

【0566】

ステップ3: メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - [2 - (トリフルオロメチル) シクロプロピル] ベンゾエート (中間体 I 10) の調製

【化 6 4】



30

(I10)

アルゴン下で、バイアル中で、3 - (トリフルオロメチル) - 5 - ビニル - ベンゾエート (1.9 g、8.3 mmol) 及びフッ化セシウム (1.5 g、9.9 mmol) を、ジメチルアセトアミド (33 mL) に溶解させて、無色の溶液を得て、それを、20分間にわたってアルゴン下で脱気した。5, 10, 15, 20 - テトラフェニル - 21H, 23H - ポルフィン鉄 (III) クロリド (0.31 g、0.41 mmol) を添加した。反応物は、緑色の懸濁液になり、ジフェニル (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) スルホニウムトリフルオロメタンスルホン酸 (3.8 g、9.1 mmol) も少しずつ添加した。反応物を室温で一晩攪拌した。得られた混合物をジクロロメタンで希釈し、次に、水を添加した。有機層を水で4回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、160 mbar 下で、40 で、減圧下で濃縮した。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - [2 - (トリフルオロメチル) シクロプロピル] ベンゾエート (中間体 I 10) を得た。

40

50

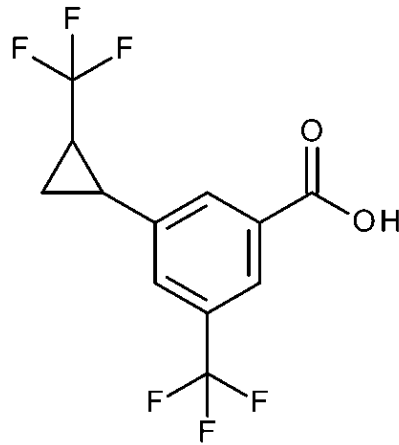
ル)シクロプロピル]ベンゾエートを得た。

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.25 - 1.34 (m, 1H) 1.48 - 1.55 (m, 1H) 1.88 - 2.00 (m, 1H) 2.46 - 2.53 (m, 1H) 3.98 (s, 3H) 7.60 (s, 1H) 7.98 (s, 1H) 8.19 (s, 1H) .

【0567】

ステップ4: 3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸(I11)の調製

【化65】



(I11)

3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンゾエート(1.43 g、3.80 mmol)を、テトラヒドロフラン(11.4 mL)及び水(7.60 mL)に溶解させた。水酸化リチウム-水和物(0.322 g、7.60 mmol)を添加し、得られた混合物を室温で3時間30分攪拌した。反応混合物を0に冷却し、次に、それを2 Mの塩酸溶液で酸性化した。水性層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸を得た。

^1H NMR (400 MHz、ジメチルスルホキシド-d6) ppm 1.40 - 1.47 (m, 2H) 2.53 - 2.60 (m, 1H) 2.72 (td, $J_1 = 7.70$ Hz, $J_2 = 4.77$ Hz, 1H) 7.87 (s, 1H) 8.02 (s, 1H) 8.05 - 8.08 (m, 1H) 13.54 (br s, 1H) .

LC-MS (方法4): 保持時間1.04分、 m/z 297 [M-H]⁻ .

【0568】

ステップ5: N-[1-[5-プロモ-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド(化合物P16)の調製

10

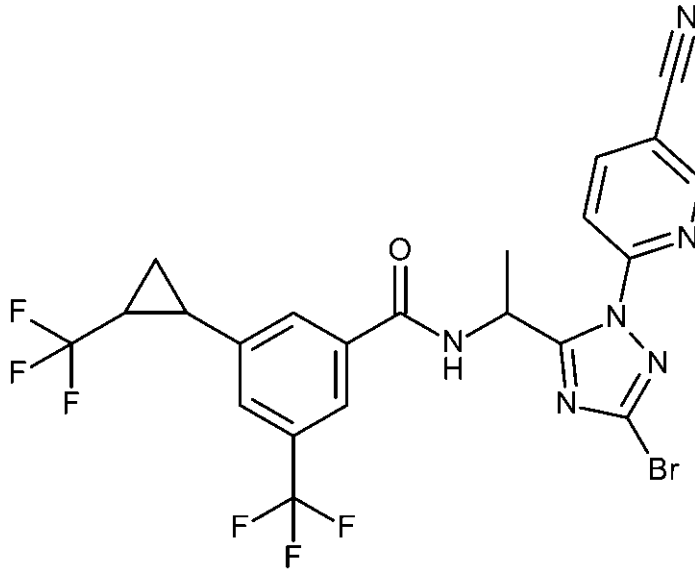
20

30

40

50

【化 6 6】



10

所望の生成物を、実施例 1 のステップ C に記載される条件を用いて調製して、N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - [2 - (トリフルオロメチル) シクロプロピル] ベンズアミドを得た。

20

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm : 1 . 24 - 1 . 33 (m , 1 H) 1 . 48 - 1 . 56 (m , 1 H) 1 . 77 (d , J = 7 . 0 Hz、3 H) 1 . 87 - 1 . 99 (m , 1 H) 2 . 45 - 2 . 53 (m , 1 H) 6 . 40 - 6 . 50 (m , 1 H) 7 . 16 (br d , J = 8 . 1 Hz、1 H) 7 . 53 (s , 1 H) 7 . 76 (s , 1 H) 7 . 88 (s , 1 H) 8 . 11 - 8 . 16 (m , 1 H) 8 . 22 (dd , J₁ = 8 . 4 Hz、J₂ = 2 . 2 Hz、1 H) 8 . 88 (dd , J₁ = 2 . 2 Hz、J₂ = 0 . 7 Hz、1 H)

LC - MS (方法 4) : 保持時間 1 . 18 分、m / z 573 - 575 [M + H]⁺。

30

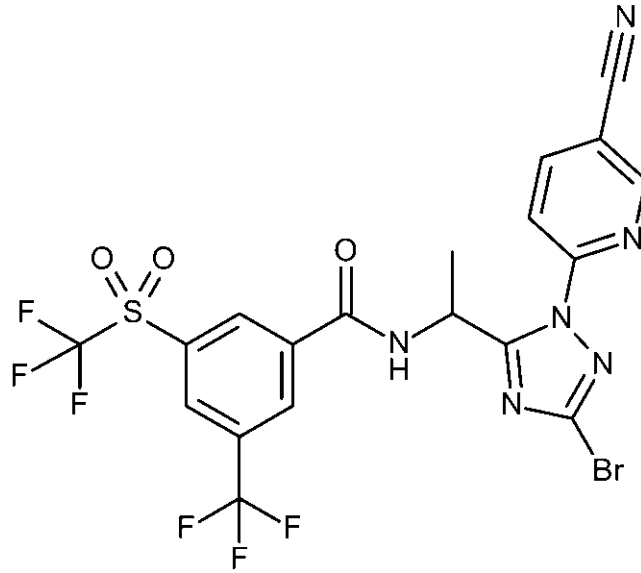
【 0 5 6 9】

実施例 4 : N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンズアミド (化合物 P 17) の調製

40

50

【化 6 7】

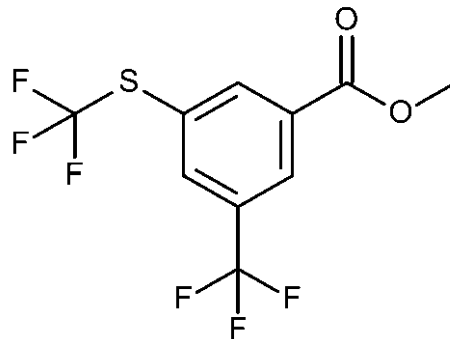


10

ステップ 1 : メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンゾエート (中間体 I 1 2) の調製

20

【化 6 8】



30

(2, 2' - ビピリジン) (トリフルオロメタンチオラト) 銅 (CAS 1413732 - 47 - 4) (3.9 g、12 mmol、2.0 当量) を、アルゴン下でアセトニトリル (18 mL) 中のメチル 3 - ヨード - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (2.0 g、6.1 mmol) の溶液に添加した。反応混合物を 90 °C まで加熱し、一晩攪拌した。室温に冷却した後、反応混合物をセライトのパッドでろ過し、濃縮した。粗材料を、シリカゲル (シクロヘキサン中の酢酸エチル) における 2 回のフラッシュクロマトグラフィによって精製して、所望の生成物を黄色のガム (1.5 g、4.9 mmol) として得た。

40

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz、クロロホルム - d) ppm : 4.02 (s, 3H)、8.11 (s, 1H)、8.44 (s, 1H)、8.53 (s, 1H)。

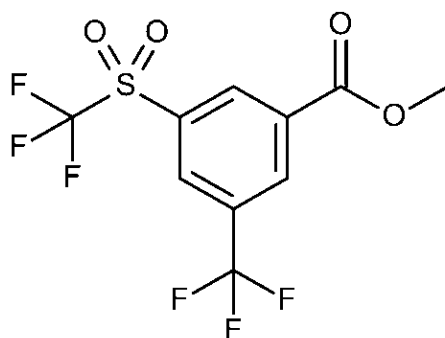
LC - MS (方法 4) : 保持時間 1.21 分、m/z 279 [M - MeO + H]⁺。

【0570】

ステップ 2 : メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾエート (中間体 I 1 3) の調製

50

【化69】



(I13)

10

3 - クロロ過安息香酸 (2 . 3 g 、 1 1 m m o l 、 2 . 1 当量) を、ジクロロメタン (1 6 m L) 中のメチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンゾエート (上記のとおり調製された中間体 I 1 3) (1 . 8 g 、 5 . 3 m m o l) の 0 の冷却溶液に少しずつ添加した。室温で 1 時間攪拌した後、さらなる 3 - クロロ過安息香酸 (2 . 3 g 、 1 1 m m o l 、 2 . 1 当量) を添加し、反応混合物を一晩攪拌した。形成された沈殿物をろ過した。ろ液を、チオ硫酸ナトリウムの 1 0 % の水溶液及び N a H C O ₃ 飽和溶液で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾエートを得た。

20

¹H NMR (4 0 0 M H z 、 クロロホルム) p p m 4 . 0 7 (s , 3 H) 8 . 4 3 - 8 . 5 1 (m , 1 H) 8 . 7 0 - 8 . 8 0 (m , 1 H) 8 . 8 4 - 8 . 9 1 (m , 1 H) .

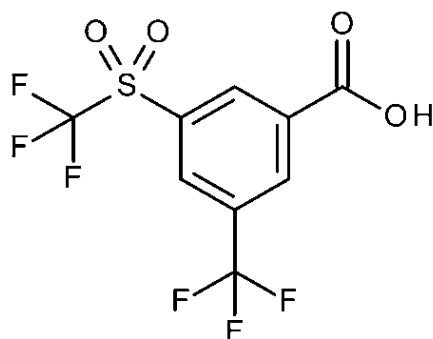
¹⁹F NMR (3 7 7 M H z 、 クロロホルム - d) p p m : - 7 7 . 4 9 (s , 3 F) - 6 2 . 9 6 (s , 3 F)

【0571】

ステップ 3 : 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) 安息香酸 (I 1 4) の調製

30

【化70】



(I14)

40

メチル 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾエート (1 . 8 g 、 5 . 4 m m o l) を、フラスコに充填し、テトラヒドロフラン (1 6 m L) 及び水 (1 1 m L) に溶解させた。この混合物に、水酸化リチウム - 水和物 (0 . 2 6 g 、 1 1 m m o l) を添加し、反応物を、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を 1 M の塩酸で酸性化し、水性相を酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次に、濃縮して、3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルホニル) 安息香酸を得て、これをさらに精製せずに用いた。

¹H NMR (4 0 0 M H z 、 ジメチルスルホキシド - d 6) p p m : 8 . 6 8 (s

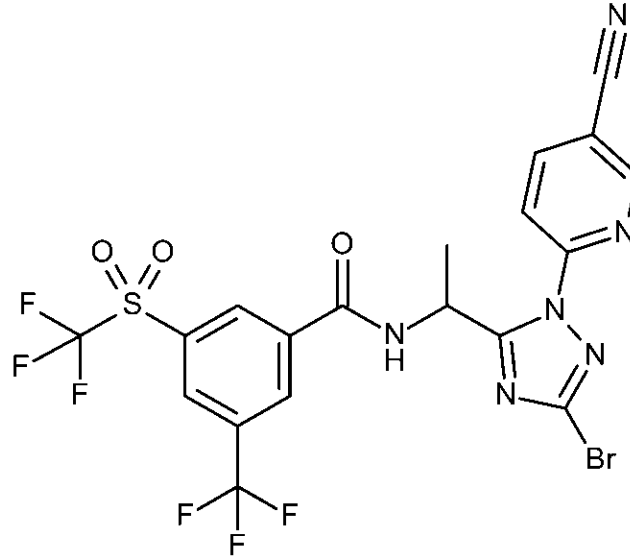
50

, 2 H) 8.71 - 8.76 (m, 1 H) 13.33 - 15.22 (m, 1 H).

【0572】

ステップ4：N-[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド(化合物P17)の調製

【化71】



(P17)

所望の生成物を、実施例1のステップCに記載される条件を用いて調製して、N-[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミドを得た。

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.80 (d, J = 6.60 Hz, 3 H) 6.37 - 6.59 (m, 1 H) 7.42 - 7.64 (m, 1 H) 8.12 - 8.20 (m, 1 H) 8.19 - 8.30 (m, 1 H) 8.34 - 8.49 (s, 1 H) 8.49 - 8.59 (s, 1 H) 8.59 - 8.73 (s, 1 H) 8.84 - 8.98 (s, 1 H).

LC-MS (方法4)：保持時間 1.15分、m/z 597 - 599 [M+H]⁺。

【0573】

実施例5：N-[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-[シクロプロピル(ジフルオロ)メチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P21)の調製

10

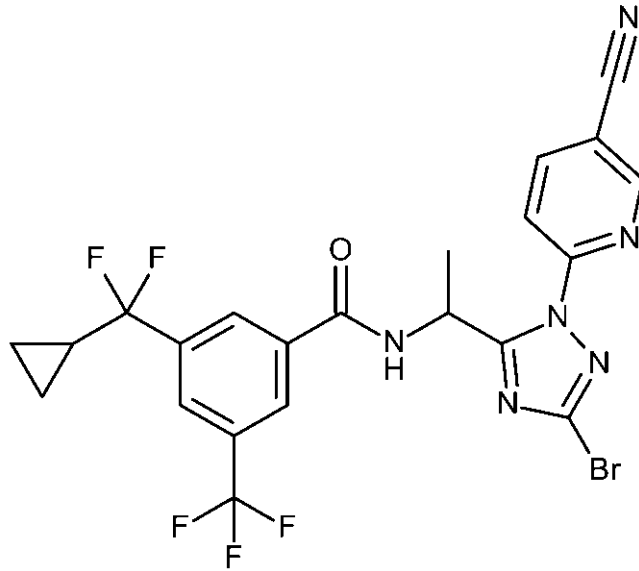
20

30

40

50

【化 7 2】

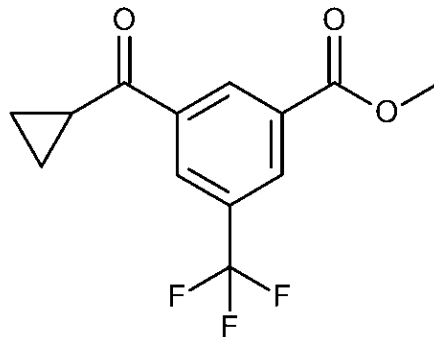


10

ステップ 1 : メチル 3 - (シクロプロパンカルボニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (中間体 I 15) の調製

20

【化 7 3】



30

メチル 3 - ヨード - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (10 g、28.78 mmol) を、アルゴン下で、テトラヒドロフラン (115 mL) に取り込んだ。得られた薄茶色の溶液を、ドライアイス/アセトン浴を用いて -78 に冷却した。テトラヒドロフラン溶液中のターボ・グリニャール 1.3 M (31 mL、40.29 mmol) を、20 分間にわたってシリンジで滴下して添加して、温度を -65 未満に維持しながら、暗色の溶液を直接得た。得られた混合物を -78 で 15 分間攪拌した。シアン化第一銅 (3.125 g、34.5 mmol) 及び無水塩化リチウム (1.479 g、34.5 mmol) を一度に同時に添加して、暗色の懸濁液を得た。得られた混合物を、-78 で 15 分間、再度攪拌した。シクロプロパンカルボニルクロリド (5.340 mL、57.5 mmol) を、最後に、5 分間にわたって滴下して添加した (温度は、最高で -68 に達した)。得られた混合物を -78 で 1 時間攪拌し、室温に温め、30 分間攪拌して、茶色の懸濁液を得た。反応混合物を -78 に冷却し、20 mL のメタノールでゆっくりとクエンチした。得られた混合物を室温に到達させ、得られた懸濁液をセライトでろ過した。飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを、ろ液に添加した。水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、40 で、減圧下で濃縮した。粗材料を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 3 - (シクロプロパンカルボニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエートを得た。

40

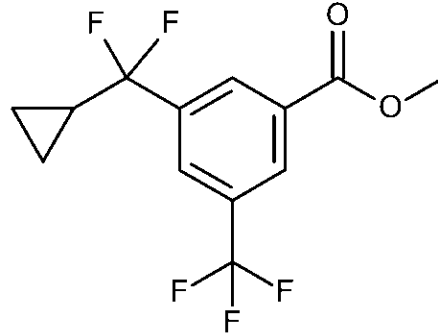
50

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.16 - 1.22 (m, 2H) 1.35 (quin, $J = 3.76$ Hz、2H) 2.74 (tt, $J_1 = 7.84$ Hz、 $J_2 = 4.45$ Hz、1H) 4.02 (s, 3H) 8.45 (d, $J = 0.73$ Hz、1H) 8.51 (d, $J = 0.73$ Hz、1H) 8.86 (s, 1H).

【0574】

ステップ2: メチル 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (中間体 I 16) の調製

【化74】



(I16)

メチル 3 - (シクロプロパンカルボニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエート (5.5 g、20 mmol) を、アルゴン下で、2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ジメチル - イミダゾリジン (36 mL、280 mmol) に取り込んで、淡黄色の溶液を得た。得られた混合物を 110 で 5 時間攪拌して、薄茶色の溶液を得た。反応混合物を室温に冷却し、0 の 1.0 L の激しく攪拌された飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に滴下して添加した (温度を、10 未満に維持した)。次に、得られた混合物 (pH 8 ~ 9) を酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、50 で、減圧下で濃縮した。粗材料を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾエートを得た。

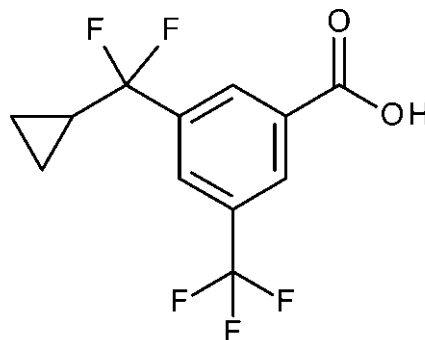
^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 0.73 - 0.79 (m, 2H) 0.82 - 0.89 (m, 2H) 1.47 - 1.60 (m, 1H) 8.00 (d, $J = 0.73$ Hz、1H) 8.39 (s, 1H) 8.42 (s, 1H).

^{19}F NMR (377 MHz、クロロホルム-d) ppm: -98.40 (s, 3F) -62.81 (s, 2F).

【0575】

ステップ3: 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸 (I 17) の調製

【化75】



(I17)

メチル 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) ベン

10

20

30

40

50

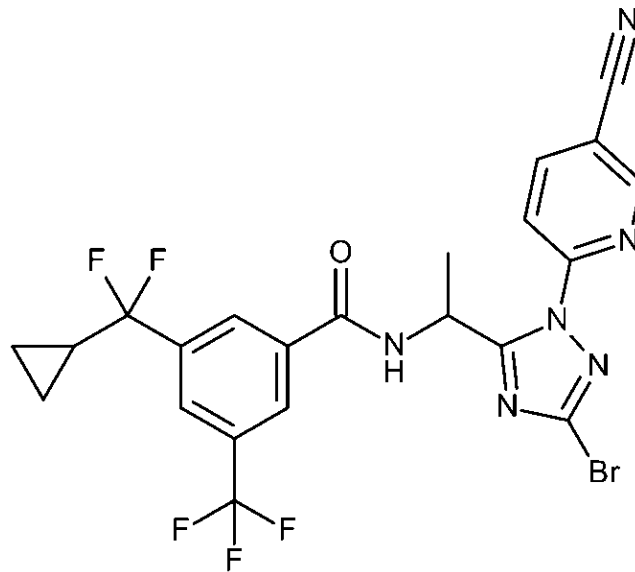
ゾエート (4.45 g、15.1 mmol) を、テトラヒドロフラン (30.3 mL) 及び水 (15.1 mL) に取り込んだ。水酸化リチウム水和物 (0.833 g、19.7 mmol) を添加し、得られた無色の濁った溶液を、室温で1時間攪拌した。反応混合物を、酢酸エチル及び水で希釈した。有機相を水で2回洗浄した。組み合わせた水性層を、1 Nの塩酸水溶液で pH 1 ~ 2 になるまで酸性化し、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で1回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、60 °C で、減圧下で濃縮して、3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸を得て、これをさらに精製せずに用いた。

^1H NMR (400 MHz、ジメチルスルホキシド - d_6) ppm: 0.62 - 0.84 (m, 4H) 1.65 - 1.97 (m, 1H) 7.93 - 8.23 (m, 1H) 8.23 - 8.51 (m, 2H) 13.24 - 14.48 (m, 1H).
LC-MS (方法4): 保持時間 1.03分、 m/z 279 [M-H]⁻.

【0576】

ステップ4: N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P21) の調製

【化76】



(P21)

所望の生成物を、実施例1のステップCに記載される条件を用いて調製して、N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 3 - [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドを得た。

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm: 0.70 - 0.80 (m, 2H) 0.81 - 0.91 (m, 2H) 1.47 - 1.60 (m, 1H) 1.78 (d, $J = 6.60$ Hz, 3H) 6.36 - 6.58 (m, 1H) 7.30 - 7.40 (m, 1H) 7.89 - 7.99 (s, 1H) 8.08 - 8.18 (m, 3H) 8.18 - 8.27 (m, 1H) 8.77 - 8.96 (s, 1H).

LC-MS (方法4): 保持時間 1.17分、 m/z 555 - 557 [M+H]⁺.

【0577】

実施例6: N - [1 - [5 - プロモ - 2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] エチル] - 2 - (1 - シアノシクロプロピル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P2) の調製

10

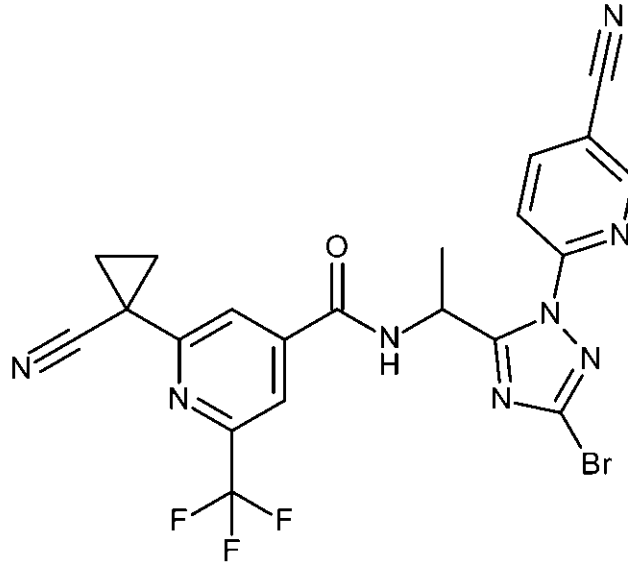
20

30

40

50

【化 7 7】

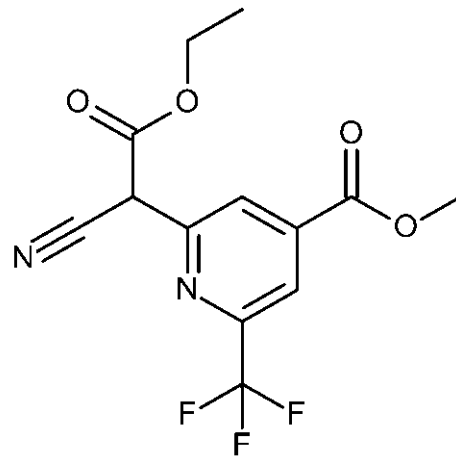


(P2)

10

ステップ 1 : メチル 2 - (1 - シアノ - 2 - エトキシ - 2 - オキソ - エチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (中間体 I 1 8) の調製
【化 7 8】

20



(I18)

30

メチル 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (1 . 0 5 g 、 4 . 4 0 m m o l) を、ジメチルスルホキシド (1 3 . 2 m L) に溶解させた。次に、2 - シアノ酢酸エチル (0 . 7 0 2 m L 、 6 . 6 0 m m o l)、炭酸カリウム (1 . 5 3 5 g 、 1 1 . 0 0 m m o l) 及びテトラブチルアンモニウムブロミド (0 . 1 4 5 g 、 0 . 4 4 0 m m o l) を室温で連続して添加した。得られた懸濁液を 9 0 ° で 1 時間 40 攪拌し、次に、室温で一晩攪拌させた。反応生成量を、5 0 m L の水及び 1 0 0 m L の酢酸エチルで希釈し、0 ~ 1 0 ° に冷却し、滴下漏斗を介して 1 N の塩酸で pH 3 になるまでゆっくりとクエンチした。水性相を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、5 0 ° で、減圧下で濃縮した。粗材料を、シクロヘキサン中の酢酸エチルを用いたシリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、メチル 2 - (1 - シアノ - 2 - エトキシ - 2 - オキソ - エチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレートを得た。

^1H NMR (4 0 0 M H z 、 クロロホルム - d) p p m : 1 . 3 6 - 1 . 4 3 (m , 3 H) 4 . 0 1 (s , 3 H) 4 . 3 4 (q , J = 7 . 5 8 H z 、 2 H) 7 . 3 4 (s , 1 H) 8 . 0 6 (s , 1 H) 1 4 . 4 6 - 1 4 . 6 7 (m , 1 H) .

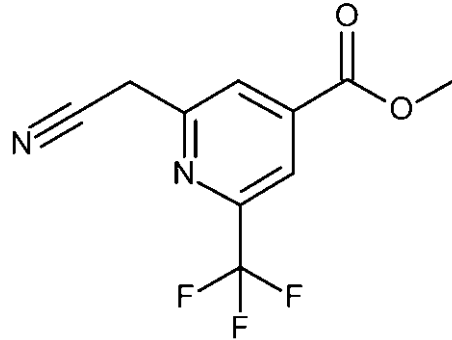
50

LC - MS (方法4) : 保持時間 1.01分、 m/z 317 [M + H]⁺。

【0578】

ステップ2 : メチル 2 - (シアノメチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (I19) の調製

【化79】



(I19)

10

ジメチルスルホキシド (20 mL) 中のメチル 2 - (1 - シアノ - 2 - エトキシ - 2 - オキソ - エチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (0.800 g、2.53 mmol) の溶液に、水 (10 mL) 中の塩化ナトリウム (0.299 g、5.06 mmol) を添加した。得られた混合物を 95 で 4 時間攪拌した。室温に冷却した後、反応混合物を水 (50 mL) で希釈し、酢酸エチル (3 * 50 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、メチル 2 - (シアノメチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレートを得て、これをさらに精製せずに用いた。

20

¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm : 4.05 (s, 3H) 4.13 (s, 2H) 8.24 (s, 1H) 8.26 (s, 1H) .

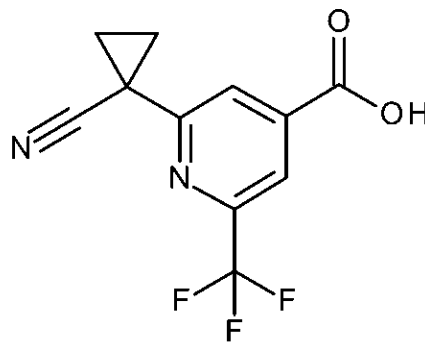
LC - MS (方法4) : 保持時間 0.89分、 m/z 243 [M - H]⁻。

【0579】

ステップ3 : 2 - (1 - シアノシクロプロピル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボン酸 (I20) の調製

30

【化80】



(I20)

40

メチル 2 - (シアノメチル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - カルボキシレート (0.05 g、0.20 mmol) を、ジメチルホルムアミド (2 mL) に溶解させた。水素化ナトリウム (24 mg、0.61 mmol) を室温で添加し、無色の溶液が、濃い紫色の懸濁液になった。10分後、1, 2 - ジブロモエタン (0.02 mL、0.24 mmol) を添加し、得られた懸濁液を室温で 15 分間攪拌した。反応混合物を、0 ~ 5 で、飽和塩化アンモニウム溶液でクエンチし、酢酸エチルで希釈した。水性層を、1 N の塩酸を用いて pH 2 ~ 3 になるまで酸性化し、酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物を逆相

50

クロマトグラフィによって精製して、2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸を得た。

^1H NMR (400 MHz、ジメチルスルホキシド-d₆) ppm: 1.76 - 1.83 (m, 2H) 1.96 - 2.03 (m, 2H) 8.07 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 8.17 (s, 1H) 13.35 - 15.45 (m, 1H).

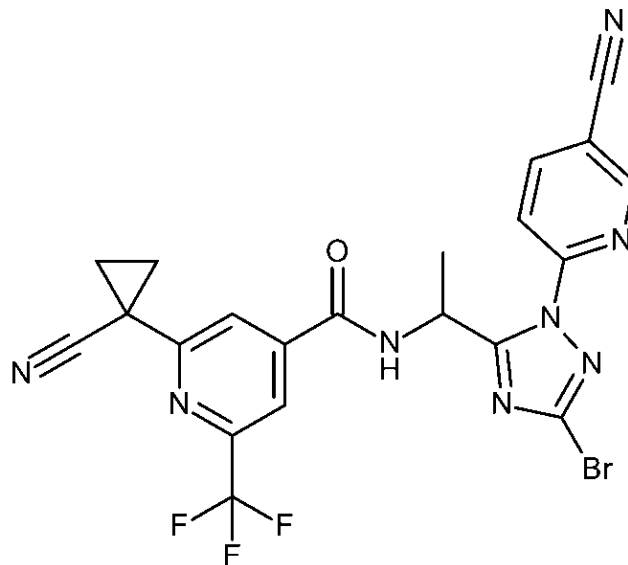
LC-MS (方法4): 保持時間 0.89分、m/z 255 [M-H]⁻.

【0580】

ステップ4: N-[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド(化合物P2)の調製

【化81】

10



(P2)

20

2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸(中間体I3、0.097g、0.321mmol、0.80当量)を、N-エチル-N-イソプロピル-プロパン-2-アミン(0.206mL、1.20mmol、3.00当量)と共にジメチルホルムアミド(2.41mL)中の6-[5-(1-アミノエチル)-3-ブromo-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル臭化水素酸塩(中間体I6、0.150g、0.401mmol、1.00当量)の溶液に添加した。室温で5分間攪拌した後、HATU(0.229g、0.602mmol、1.50当量)を添加し、得られた混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、水性層を酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機層を、水で4回、塩水で1回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、シリカゲルにおけるクロマトグラフィによって精製して、N-[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドを得た。

30

40

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム-d) ppm: 1.79 (d, J = 6.97 Hz, 3H) 1.84 - 1.90 (m, 2H) 1.92 - 1.98 (m, 2H) 6.47 (dd, J₁ = 7.70 Hz, J₂ = 6.97 Hz, 1H) 7.50 - 7.62 (m, 1H) 7.90 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 8.13 - 8.17 (m, 1H) 8.19 - 8.21 (m, 1H) 8.21 - 8.26 (m, 1H) 8.90 (dd, J₁ = 2.20 Hz, J₂ = 0.73 Hz, 1H).

LC-MS (方法4): 保持時間 1.09分、m/z 531 - 533 [M+H]⁺.

【0581】

50

【表 1 2 - 1】

表 P: 式 I の化合物の例

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P1	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(6-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					104 - 106
P2	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(6-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド		1.10	531	1	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 2】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P3	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.05	587	3	98 - 100
P4	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド		1.05	586	1	

10

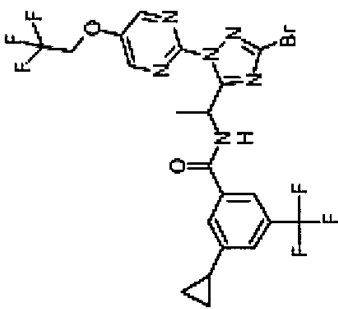
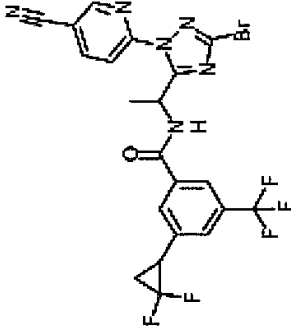
20

30

40

50

【表 1 2 - 3】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P5	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.16	580	3	94 - 96
P6	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					162 - 164

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 4】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P7	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					78 - 80
P8	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	598	3	97 - 98

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 5】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P9	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド]		1.18	630	3	193 - 195
P10	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.09	606	3	108 - 110

10

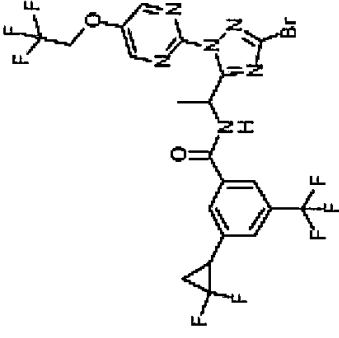
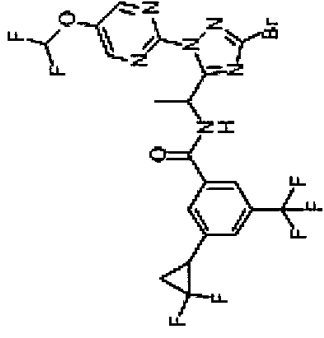
20

30

40

50

【表 1 2 - 6】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P11	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.13	616	3	99 - 101
P12	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					164 - 166

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 7】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P13	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド		1.14	629	1	
P14	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド		1.08	562	1	86 - 88
P15	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.13	611	1	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 8】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P16	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド		1.18	575	1	
P17	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド		1.15	599	1	
P18	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	563	1	149 - 151

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 9】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P19	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.15	505	1	
P20	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド		1.13	508	1	
P21	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)メチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.17	555	1	

10

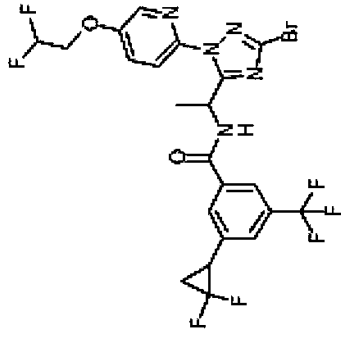
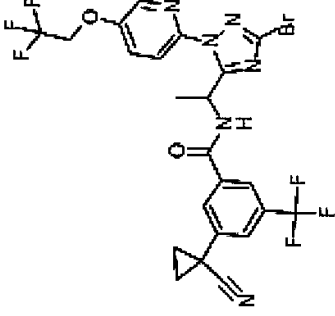
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 0】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P22	N-[1-[5-プロモ-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					149 - 151
P23	N-[1-[5-プロモ-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					179 - 181

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 1】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P24	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド		1.11	655	1	190 - 191
P25	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					138 - 140

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 2】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P26	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロピロル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					95 - 100
P27	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロピロル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					170 - 172

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 3】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P28	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					155 - 157
P29	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					152 - 154

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 4】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P30	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド					152 - 154
P31	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					140 - 142

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 5】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C	
P32	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド						147 - 149
P33	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド						82 - 84

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 6】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P34	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド					157 - 159
P35	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					171 - 173

10

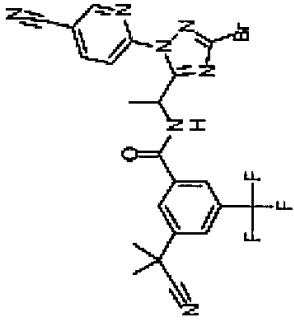
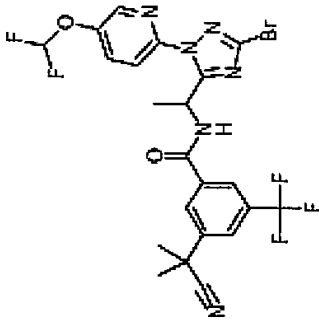
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 7】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P36	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-(6-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					110 - 112
P37	<i>N</i> -[1-[5-プロモ-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					74 - 76

10

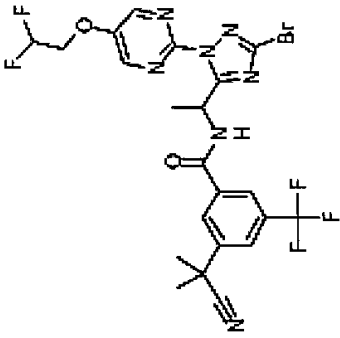
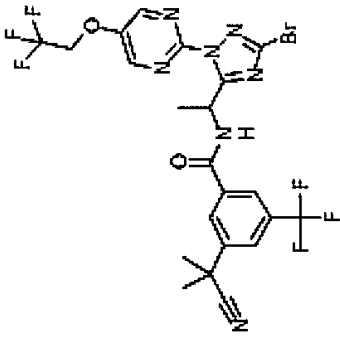
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 8】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P38	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.07	589	3	106 - 108
P39	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.11	607	3	106 - 108

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 1 9】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
P40	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					147 ~ 149
P41	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					150 ~ 152

10

20

30

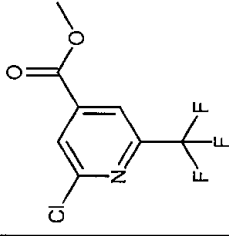
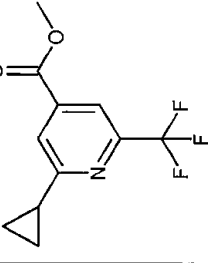
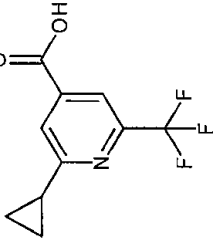
40

【 0 5 8 2】

50

【表 1 3 - 1】

表 Q: 中間体の表

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
11	メチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 4.04 (s, 3 H) 8.11 (s, 1 H) 8.17 (d, J = 1.10 Hz, 1 H).
12	メチル 2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート		1.12	246 [M+H] ⁺	1	
13	2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸		0.94	232 [M+H] ⁺	1	

10

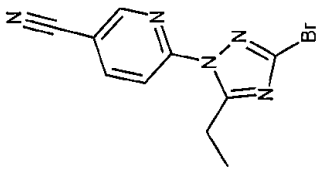
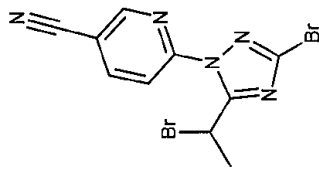
20

30

40

50

【表 1 3 - 2】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
14	6-(3-プロモ-5-エチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-カルボニトリル		0.93	280	1	
15	6-[3-プロモ-5-(1-プロモエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル		1.02	356-358-360 [M+H] ⁺	1	

10

20

30

40

50

【表 13 - 3】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
I6	6-[5-(1-アミノエチル)-3-プロモ-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニルヒドロプロモミド		0.66	293 [M+H] ⁺ (臭化水素酸塩を含まない)		
I7	メチル 3-シクロプロピルピロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 0.76 - 0.85 (m, 2 H) 1.06 - 1.15 (m, 2 H) 2.03 (tt, J = 8.39 Hz, J ₂ = 5.00 Hz, 1 H) 3.96 (s, 3 H) 7.52 (s, 1 H) 7.91 (s, 1 H) 8.08 (d, J = 0.73 Hz, 1 H). ¹⁹ F NMR (377 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: -62.75 (s, 3 F).

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 4】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
18	3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.99	229 [M-H] ⁻	1	
19	メチル 3-(トリフルオロメチル)-5-ビニルベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 3.98 (s, 3 H) 5.47 (d, J = 11.00 Hz, 1 H) 5.93 (d, J = 17.61 Hz, 1 H) 6.79 (dd, J = 17.42 Hz, J = 10.82 Hz, 1 H) 7.82 (s, 1 H) 8.19 (s, 1 H) 8.24 - 8.29 (m, 1 H).
110	メチル 3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 1.25 - 1.34 (m, 1 H) 1.48 - 1.55 (m, 1 H) 1.88 - 2.00 (m, 1 H) 2.46 - 2.53 (m, 1 H) 3.98 (s, 3 H) 7.60 (s, 1 H) 7.98 (s, 1 H) 8.19 (s, 1 H).

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 5】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
I11	3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸		1.04	297 [M-H] ⁻	1	
I12	メチル 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニアニル)ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 4.02 (s, 3 H), 8.11 (s, 1 H), 8.44 (s, 1H), 8.53 (s, 1 H).
I13	メチル 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm 4.07 (s, 3 H) 8.43 - 8.51 (m, 1 H) 8.70 - 8.80 (m, 1 H) 8.84 - 8.91 (m, 1 H). ¹⁹ F NMR (377 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: -77.49 (s, 3 F) -62.96 (s, 3 F).

10

20

30

40

50

【表 13 - 6】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
I14	3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸					¹ H NMR (400 MHz, ジメチルスルホキシド-d6) δ ppm: 8.68 (s, 2 H) 8.71 - 8.76 (m, 1 H) 13.33 - 15.22 (m, 1 H).
I15	メチル 3-(シクロプロピル)ベンザルボニル)-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 1.16 - 1.22 (m, 2 H) 1.35 (quin, J = 3.76 Hz, 2 H) 2.74 (tt, J ₁ = 7.84 Hz, J ₂ = 4.45 Hz, 1 H) 4.02 (s, 3 H) 8.45 (d, J = 0.73 Hz, 1 H) 8.51 (d, J = 0.73 Hz, 1 H) 8.86 (s, 1 H).
I16	メチル 3-(シクロプロピル)ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンゾエート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 0.73 - 0.79 (m, 2 H) 0.82 - 0.89 (m, 2 H) 1.47 - 1.60 (m, 1 H) 8.00 (d, J = 0.73 Hz, 1 H) 8.39 (s, 1 H) 8.42 (s, 1 H). ¹⁹ F NMR (377 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: -98.40 (s, 3 F) -62.81 (s, 2 F).

10

20

30

40

50

【表 13 - 7】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	NMR
117	3-[シクロプロピル(ジフルオロ)メチル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.03	279 [M-H] ⁻	1	
118	メチル 2-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート		1.01	317 [M+H] ⁺	1	
119	メチル 2-(シアノメチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート					¹ H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 4.05 (s, 3 H) 4.13 (s, 2 H) 8.24 (s, 1 H) 8.26 (s, 1 H).

10

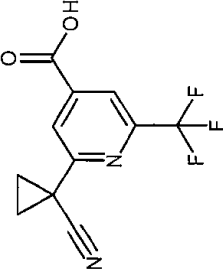
20

30

40

50

【表 1 3 - 8】

項目	IUPAC 名	構造	RT (min)	m/z (実測値)	方法	MMR
120	2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸		0.89	255 [M-H] ⁻	1	

10

20

30

40

【0583】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的、殺ダニ的及び/又は殺真菌的に活性な成分を加えることによってかなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式 I の化合物と、他の殺虫的、殺ダニ的及び/又は殺真菌的に活性な成分との混合物が、より広い意味で相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること又はそれらの製造中、例えば粉碎若しくは混合中、それらの貯蔵中又はそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【0584】

50

本明細書における有効成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の有効成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

【0585】

式Iの化合物と、有効成分との以下の混合物が好ましい(「TX」という略語は、「表A-1~A-297及び表Pに定義される化合物から選択される1つの化合物」を意味する)：

石油(代替名)(628)+TXからなる物質の群から選択される補助剤、
 アバメクチン+TX、アセキノシル+TX、アセタミプリド+TX、アセトプロール+TX、
 アクリナトリン+TX、アシノナピル+TX、アフィドピロペン+TX、アフォキサ
 ラナル+TX、アラニカルブ+TX、アレトリン+TX、
 -シベルメトリン+TX、
 メトリン+TX、アミドフルメト+TX、アミノカルブ+TX、アゾシクロチン+TX、
 ベンサルタップ+TX、ベンゾキメート+TX、ベンズピリモキサン+TX、
 シフルトリン+TX、
 -シベルメトリン+TX、ピフェナゼート+TX、ピフェントリン+TX
 、ピナバクリル+TX、ピオアレトリン+TX、ピオアレトリンS)-シクロペンチルア
 イソマー+TX、ピオレスメトリン+TX、ピストリフルロン+TX、プロフラニリド+
 TX、プロフルトリネート+TX、プロモホス-エチル+TX、ブプロフェジン+TX、
 ブトカルボキシム+TX、カズサホス+TX、カルバリル+TX、カルボスルファン+TX
 X、カルタップ+TX、CAS番号：1472050-04-6+TX、CAS番号：1
 632218-00-8+TX、CAS番号：1808115-49-2+TX、CAS
 番号：2032403-97-5+TX、CAS番号：2044701-44-0+TX
 、CAS番号：2128706-05-6+TX、CAS番号：2249718-27-
 0+TX、クロラントラニリプロール+TX、クロルダン+TX、クロルフェナピル+T
 X、クロロブラレトリン+TX、クロマフェノジド+TX、クレンピリン+TX、クロエ
 トカルブ+TX、クロチアニジン+TX、2-クロロフェニルN-メチルカルバメート(
 CPMC)+TX、シアノフェンホス+TX、シアントラニリプロール+TX、シクラニ
 リプロール+TX、シクロブトリフルラム+TX、シクロプロトリン+TX、シクロキサ
 プリド+TX、シクロキサプリド+TX、シエノピラフェン+TX、シエトプラフェン(
 又はエトピラフェン)+TX、シフルメトフェン+TX、シフルトリン+TX、シハロジ
 アミド+TX、シハロトリン+TX、シベルメトリン+TX、シフェノトリン+TX、シ
 ロマジン+TX、デルタメトリン+TX、ジアフェンチウロン+TX、ジアリホス+TX
 、ジブロム+TX、ジクロロメゾチアズ+TX、ジフロヴィダジン+TX、ジフルベンズ
 ロン+TX、ジメプロピリダズ+TX、ジナクチン+TX、ジノカップ+TX、ジノテフ
 ラン+TX、ジオキサベンゾホス+TX、エマメクチン+TX、エムペントリン+TX、
 -モンフルオロトリン+TX、
 -メトフルトリン+TX、エスフェンバレレート+TX
 X、エチオン+TX、エチプロール+TX、エトフェンブロックス+TX、エトキサゾー
 ル+TX、ファンファー+TX、フェナザキン+TX、フェンフルトリン+TX、フェニ
 トロチオン+TX、フェノブカルブ+TX、フェノチオカルブ+TX、フェノキシカルブ
 +TX、フェンプロパトリン+TX、フェンプロキシメート+TX、フェンスルホチオン
 +TX、フェンチオン+TX、フェンチンアセテート+TX、フェンバレレート+TX、
 フィプロニル+TX、フロメトキン+TX、フロニカミド+TX、フルアクリピリム+T
 X、フルアザインドリジン+TX、フルアズロン+TX、フルベンジアミド+TX、フル
 ベンジミン+TX、フルシトリネート+TX、フルシクロクスロン+TX、フルシトリネ
 ート+TX、フルエンシルホン+TX、フルフェネリム+TX、フルフェンブロックス+
 TX、フルフィプロール+TX、フルヘキサホン+TX、フルメトリン+TX、フルオピ
 ラム+TX、フルペンチオフェノックス+TX、フルピラジフロン+TX、フルピリミン
 +TX、フルララナー+TX、フルバリネート+TX、フルキサメタミド+TX、ホスチ

10

20

30

40

50

アゼート+TX、 -シハロトリン+TX、ゴシッブルア(商標)+TX、グアジピル+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェンブックス+TX、ヘブタフルトリン+TX、ヘキシチアゾクス+TX、ヒドラメチルノン+TX、イミシアホス+TX、イミダクロプリド+TX、イミプロトリン+TX、インドキサカルブ+TX、ヨードメタン+TX、イプロジオン+TX、イソシクロセラム+TX、イソチオエート+TX、イベルメクチン+TX、 -ピフェントリン+TX、 -テフルトリン+TX、ラムダ-シハロトリン+TX、レピメクチン+TX、ルフェヌロン+TX、メタフルミゾン+TX、メタアルデヒド+TX、メタム+TX、メソミル+TX、メトキシフェノジド+TX、メトフルトリン+TX、メトルカルブ+TX、メキサカルベート+TX、ミルベメクチン+TX、モンフルオロトリン+TX、ニコロミアミド+TX、ニテンピラム+TX 10
 、ニチアジン+TX、オメトエート+TX、オキサミル+TX、オキサゾスフィル+TX、パラチオン-エチル+TX、ペルメトリン+TX、フェノトリン+TX、ホスホカルブ+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピリミカーブ+TX、ピリミホス-エチル+TX、多角体ウイルス+TX、プラレトリン+TX、プロフェノホス+TX、プロフェノホス+TX、プロフルトリン+TX、プロパルギット+TX、プロベタムホス+TX、プロボキスル+TX、プロチオホス+TX、プロトリフェンブト+TX、ピフルブミド+TX、ピメトロジン+TX、ピラクロホス+TX、ピラフルプロール+TX、ピリダベン+TX、ピリダリル+TX、ピリフルキナゾン+TX、ピリミジフェン+TX、ピリモストロピン+TX、ピリプロール+TX、ピリプロキシフェン+TX、レスメスリン+TX、サロラネル+TX、セラメクチン+TX、シラフルオフエン+TX、スピネトラム+TX、ス 20
 ピノサド+TX、スピロジクロフェン+TX、スピロメシフェン+TX、スピロピジオン+TX、スピロテトラマト+TX、スルホキサフロル+TX、テブフェノジド+TX、テブフェンピラド+TX、テブピリミホス+TX、テフルトリン+TX、テメホス+TX、テトラクロラニリプロール+TX、テトラジホン+TX、テトラメトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX、テトラナクチン+TX、テトラニリプロール+TX、 -シベルメトリン+TX、チアクロプリド+TX、チアメトキサム+TX、チオシクラム+TX、チオジカルブ+TX、チオファノックス+TX、チオメトン+TX、チオスルタップ+TX、チオキサザフェン+TX、トルフェンピラド+TX、トキサフェン+TX、トラロメトリン+TX、トランスフルトリン+TX、トリアザメート+TX、トリアゾホス+TX、トリクロルホン+TX、トリクロロネート+TX、トリクロロホン+TX、トリフル 30
 メゾピリン+TX、チクロピラゾフロル+TX、 -シベルメトリン+TX、海草抽出物及びメラッセ由来の発酵生成物+TX、海草抽出物及び尿素を含むメラッセ由来の発酵生成物+TX、アミノ酸+TX、カリウム及びモリブデン及びEDTA-キレート化マンガ ン+TX、海草抽出物及び発酵植物生成物+TX、海草抽出物及び植物ホルモンを含む発酵植物生成物+TX、ビタミン+TX、EDTA-キレート化銅+TX、亜鉛+TX、及び鉄+TX、アザジラクチン+TX、バチルス属アイザワイ(*Bacillus aizawai*)+TX、バチルスキチノスポルス(*Bacillus chitinosporus*)AQ746(NRRL受入番号B-21618)+TX、バチルスフィルムス(*Bacillus firmus*)+TX、バチルス属クルスターキ(*Bacillus kurstaki*)+TX、バチルスマイコイデス(*Bacillus mycoi 40
 des*)AQ726(NRRL受入番号B-21664)+TX、バチルスプミルス(*Bacillus pumilus*)(NRRL受入番号B-30087)+TX、バチルスプミルス(*Bacillus pumilus*)AQ717(NRRL受入番号B-21662)+TX、バチルス属の種(*Bacillus sp.*)AQ178(ATCC受入番号53522)+TX、バチルス属の種(*Bacillus sp.*)AQ175(ATCC受入番号55608)+TX、バチルス属の種(*Bacillus sp.*)AQ177(ATCC受入番号55609)+TX、バチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)不特定の+TX、バチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)AQ153(ATCC受入番号55614)+TX、バチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)AQ30002(NRRL受入番号B-50 50

421) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ30004 (NRRL受入番号B-50455) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ713 (NRRL受入番号B-21661) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ743 (NRRL受入番号B-21665) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) AQ52 (NRRL受入番号B-21619) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BD#32 (NRRL受入番号B-21530) + TX、バチルスチューリングエンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subspec. kurstaki*) BMP123 + TX、ベアウベリアバツシアナ (*Beauveria bassiana*) + TX、D-リモネン + TX、グラニューウイルス + TX、ハルピン + TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多核体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多核体ウイルス + TX、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 核多核体ウイルス + TX、ヘリオチスプンクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多核体ウイルス + TX、メタリジウム属の種 (*Metarhizium spp.*) + TX、ムスコドルアルブス (*Muscodor albus*) 620 (NRRL受入番号30547) + TX、ムスコドルロセウス (*Muscodor roseus*) A3-5 (NRRL受入番号30548) + TX、ニームツリー (*Neem tree*) 系生成物 + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、パエシロマイセスリラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) + TX、パスツリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、パスツリアペネトランス (*Pasteuria penetrans*) + TX、パスツリアラモサ (*Pasteuria ramosa*) + TX、パスツリアソルネイ (*Pasteuria thornei*) + TX、パスツリアウスガエ (*Pasteuria usgae*) + TX、P-シメン + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) グラニューシスウイルス + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多核体ウイルス + TX、多角体ウイルス + TX、ジョチュウギク + TX、QRD420 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD452 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD460 (テルペノイドブレンド) + TX、キラヤサボナリア (*Quillaja saponaria*) + TX、ロドコッカスグロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) AQ719 (NRRL受入番号B-21663) + TX、スポドプテラフルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多核体ウイルス + TX、ストレプトマイセスガルブス (*Streptomyces galbus*) (NRRL受入番号30232) + TX、ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces spp.*) (NRRL受入番号B-30145) + TX、テルペノイドブレンド + TX、及びベルチシリウム属の種 (*Verticillium spp.*) から選択される昆虫防除有効物質、

ベトキサジン [CCN] + TX、ジオクタン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、硫酸銅 (172) + TX、シプトリン [CCN] + TX、ジクロン (1052) + TX、ジクロロフェン (232) + TX、エンドタール (295) + TX、フェンチン (347) + TX、消石灰 [CCN] + TX、ナーバム (566) + TX、キノクラミン (714) + TX、キノナミド (1379) + TX、シマジン (730) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX からなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) + TX、クルホマー (1011) + TX、シクロブトリフルラム + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エブリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ピペラジン [CCN] + TX

、セラメクチン（代替名）[CCN]+TX、スピノサド（737）及びチオファネート（1435）+TXからなる物質の群から選択される駆虫剤、

クロラロース（127）+TX、エンドリン（1122）+TX、フェンチオン（346）+TX、ピリジン-4-アミン（IUPAC名）（23）及びストリキニーネ（745）+TXからなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+TX、プロノポール（97）+TX、ジオクタン酸銅（IUPAC名）（170）+TX、水酸化銅（IUPAC名）（169）+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン（232）+TX、ジピリチオン（1105）+TX、ドジシン（1112）+TX、フェナミノスルフ（1144）+TX、ホルムアルデヒド（404）+TX、ヒドラルガフェン（代替名）[CCN]+TX、カスガマイシン（483）+TX、塩酸カスガマイシン水和物（483）+TX、ニッケルビス（ジメチルジチオカルバメート）（IUPAC名）（1308）+TX、ニトラピリン（580）+TX、オクチリノン（590）+TX、オキシリン酸（606）+TX、オキシテトラサイクリン（611）+TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+TX、プロベナゾール（658）+TX、ストレプトマイシン（744）+TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン（744）+TX、テクロフタラム（766）+TX及びチオメルサル（代替名）[CCN]+TXからなる物質の群から選択される殺菌剤、

コカクモンハマキ（*Adoxophyes orana*）GV（代替名）（12）+TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター（*Agrobacterium radiobacter*）（代替名）（13）+TX、ムチカブリダニ属（*Amblyseius spp.*）（代替名）（19）+TX、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapta falciifera*）NPV（代替名）（28）+TX、アナグルス・アトムス（*Anagrus atomus*）（代替名）（29）+TX、アフエリヌス・アブドミナリス（*Aphelinus abdominalis*）（代替名）（33）+TX、アフィジウス・コレマニ（*Aphidius colemani*）（代替名）（34）+TX、アフィドレテス・アフィジミザ（*Aphidoletes aphidimyza*）（代替名）（35）+TX、オートグラファ・カリフォルニカ（*Autographa californica*）NPV（代替名）（38）+TX、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）（代替名）（48）+TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ（*Bacillus sphaericus Neide*）（学名）（49）+TX、バチルス・チューリングゲンシス・ベルリナー（*Bacillus thuringiensis Berliner*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種アイザワイ（*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエシス（*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種ジャポネシス（*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種クルスターキ（*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス（*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*）（学名）（51）+TX、ビューベリア・バシアナ（*Beauveria bassiana*）（代替名）（53）+TX、ビューベリア・ブロングニアルティ（*Beauveria brongniartii*）（代替名）（54）+TX、クリソペラ・カルネア（*Chrysoperla carnea*）（代替名）（151）+TX、ツマアカオオテントウムシ（*Cryptolaemus montrouzieri*）（代替名）（178）+TX、コドリングア（*Cydia pomonella*）GV（代替名）（191）+TX、ハモグリコマユバチ（D

10

20

30

40

50

acnusa sibirica) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Retmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabdus bacteriophora*) 及び H. メギディス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィカス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 多カブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・カルポカブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・グラッセル (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravensis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びバーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤、アフォレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘンパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアフォレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘンパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される不妊化剤、(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート及び (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール

(I U P A C 名) (5 4 1) + T X、(E , Z) - テトラデカ - 4 , 1 0 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 7 9) + T X、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 5) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 1 - エナル (I U P A C 名) (4 3 6) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 1 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (4 3 7) + T X、(Z) - ヘキサデカ - 1 3 - エン - 1 1 - イン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (4 3 8) + T X、(Z) - イコサ - 1 3 - エン - 1 0 - オン (I U P A C 名) (4 4 8) + T X、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (I U P A C 名) (7 8 2) + T X、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (I U P A C 名) (7 8 3) + T X、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 4) + T X、(7 E , 9 Z) - ドデカ - 7 , 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 3) + T X、(9 Z , 1 1 E) - テトラデカ - 9 , 1 1 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 0) + T X、(9 Z , 1 2 E) - テトラデカ - 9 , 1 2 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 1) + T X、1 4 - メチルオクタデカ - 1 - エン (I U P A C 名) (5 4 5) + T X、4 - メチルノナン - 5 - オール及び 4 - メチルノナン - 5 - オン (I U P A C 名) (5 4 4) + T X、
 - マルチストリアチン (代替名) [C C N] + T X、プレビコミン (代替名) [C C N] + T X、コドレリア (代替名) [C C N] + T X、コドレモン (代替名) (1 6 7) + T X、キュールア (代替名) (1 7 9) + T X、ディスパールア (2 7 7) + T X、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 6) + T X、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 7) + T X、ドデカ - 8 + T X、
 1 0 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (2 8 4) + T X、ドミニカルア (代替名) [C C N] + T X、4 - メチルオクタ酸エチル (I U P A C 名) (3 1 7) + T X、オイゲノール (代替名) [C C N] + T X、フロンタリン (代替名) [C C N] + T X、ゴシッブルア (代替名) (4 2 0) + T X、グランドルア (4 2 1) + T X、グランドルア I (代替名) (4 2 1) + T X、グランドルア I I (代替名) (4 2 1) + T X、グランドルア I I I (代替名) (4 2 1) + T X、グランドルア I V (代替名) (4 2 1) + T X、ヘキサルア [C C N] + T X、イブスジエノール (代替名) [C C N] + T X、イブセノール (代替名) [C C N] + T X、ジャポニルア (代替名) (4 8 1) + T X、リネアチン (代替名) [C C N] + T X、リトルア (代替名) [C C N] + T X、ルーブルア (代替名) [C C N] + T X、メドルア [C C N] + T X、メガトモ酸 (代替名) [C C N] + T X、メチルオイゲノール (代替名) (5 4 0) + T X、ムスカルア (5 6 3) + T X、オクタデカ - 2 , 1 3 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (5 8 8) + T X、オクタデカ - 3 , 1 3 - ジエン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (5 8 9) + T X、オルフラルア (代替名) [C C N] + T X、オリクタールア (代替名) (3 1 7) + T X、オストラモン (代替名) [C C N] + T X、シグルア [C C N] + T X、ソルジジン (代替名) (7 3 6) + T X、スルカトール (代替名) [C C N] + T X、テトラデカ - 1 1 - エン - 1 - イルアセテート (I U P A C 名) (7 8 5) + T X、トリメドルア (8 3 9) + T X、トリメドルア A (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア B₁ (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア B₂ (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア C (代替名) (8 3 9) 及びトランク - コール (t r u n c - c a l l) (代替名) [C C N] + T X からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、
 ビス (トリブチルスズ) オキシド (I U P A C 名) (9 1 3) + T X、プロモアセトアミド [C C N] + T X、ヒ酸カルシウム [C C N] + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X、硫酸銅 (1 7 2) + T X、フェンチン (3 4 7) + T X、リン酸第二鉄 (I U P A C 名) (3 5 2) + T X、メタアルデヒド (5 1 8) + T X、メチオカルブ (5 3 0) + T X、ニクロサミド (5 7 6) + T X、ニクロサミド - オールアミン (5 7 6) + T X、ペンタクロロフェノール (6 2 3) + T X、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (6 2 3) + T X、タジムカルブ (1 4 1 2) + T X、チオジカルブ (7 9 9) + T X、酸化トリブチルスズ (9 1 3) + T X、トリフェンモルフ (1 4 5 4) + T X、トリメタカルブ (8 4 0) + T X、酢酸トリフェニルスズ (I U P A C

10

20

30

40

50

名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730-71-3] + TX からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

AKD-3088 (化合物コード) + TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1045) + TX、1,2-ジクロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1062) + TX、1,2-ジクロロプロパン及び1,3-ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1,3-ジクロロプロペン (233) + TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1065) + TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン (IUPAC名) (980) + TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸 (IUPAC名) (1286) + TX、6-イソペンテニルアミノプリン (代替名) (210) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (945) + TX、カルボスルファン (119) + TX、クロロピクリン (141) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、シクロブトリフルラム + TX、サイトカイニン (代替名) (210) + TX、ダゾメット (216) + TX、DBC P (1045) + TX、DCIP (218) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジクロフェンチオン (1051) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、二臭化エチレン (316) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フルフラール (代替名) [CCN] + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタム-カリウム (代替名) (519) + TX、メタム-ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフェン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX、フルオピラム + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、

エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物質の群から選択される硝化阻害剤、

アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、

2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、4-

10

20

30

40

50

(キノキサリン - 2 - イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX、
 - クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、
 アンチュ (ant u) (880) + TX、三酸化ニヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム
 (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX
 、プロマジオロン (91) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、
 クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、
 コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、
 クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、
 ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジフ
 アシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン 10
 (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、
 フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、
 - HCH (430) + TX、
 HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC
 名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC
 名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、
 ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、
 ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリ
 ヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN]
] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) +
 TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン 20
 (851) 及びリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、
 2 - (2 - ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート (IUPAC名) (934) + TX
 、5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エ
 ノン (IUPAC名) (903) + TX、ファルネソール及びネロリドール (代替名) (324) + TX、
 MB - 599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発
 コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1
 343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724)
) + TX、セサメクス (1393) + TX、セサモリン (1394) 及びスルホキシド (1406) + TX
 からなる物質の群から選択される共力剤、
 アントラキノン (32) + TX、クロラロース (127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] 30
] + TX、オキシ塩化銅 (171) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジシクロペン
 タジエン (化学名) (1069) + TX、グアザチン (422) + TX、酢酸グアザチン
 (422) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ピリジン - 4 - アミン (IUPAC
 名) (23) + TX、チラム (804) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、ナフ
 テン酸亜鉛 [CCN] 及びジラム (856) + TX からなる物質の群から選択される動物
 忌避剤、
 イマニン (代替名) [CCN] 及びリバピリン (代替名) [CCN] + TX からなる物質
 の群から選択される殺ウイルス剤、
 酸化第二水銀 (512) + TX、オクチリノン (590) 及びチオファネート - メチル (802) + TX
 からなる物質の群から選択される傷保護剤、及び 40
 1, 1 - ビス (4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール + TX、2, 4 - ジクロ
 ロフェニルベンゼンスルホネート + TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - シンナム
 アルデヒド + TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホン + TX、アセトプロール + TX
 、アルドキシカルブ + TX、アミジチオン + TX、アミドチオエート + TX、アミトン +
 TX、シュウ酸水素アミトン + TX、アミトラズ + TX、アラマイト + TX、三酸化ヒ素
 + TX、アゾベンゼン + TX、アゾトエート + TX、ベノミル + TX、ベノキサホス + TX
 X、ベンジル安息香酸塩 + TX、ピキサフェン + TX、プロフェンバレレート + TX、ブ
 ロモシクレン + TX、プロモホス + TX、プロモプロピレート + TX、ププロフェジン +
 TX、プトカルボキシム + TX、プトキシカルボキシム + TX、プチルピリダベン + TX
 、多硫酸カルシウム + TX、カンフェクロール + TX、カルバノレート + TX、カルボフ 50

ン+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド+TX、8-
 硫酸ヒドロキシキノリン+TX、プロノポール+TX、水酸化銅+TX、クレゾール+TX
 X、ジピリチオン+TX、ドジチン+TX、フェナミノスルフ+TX、ホルムアルデヒド
 +TX、ヒドラルガフェン+TX、カスガマイシン+TX、カスガマイシンヒドロクロリ
 ド水和物+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)+TX、ニトラピリン+
 TX、オクチリノン+TX、オキソリン酸+TX、オキシテトラサイクリン+TX、硫酸
 ヒドロキシキノリンカリウム+TX、プロベナゾール+TX、ストレプトマイシン+TX
 、ストレプトマイシンセスキスルフェート+TX、テクロフタラム+TX、チオメルサー
 ル+TX、リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)GV+TX、
 アグロバクテリウムラジオバクター(*Agrobacterium radiobact* 10
er)+TX、アムブリセイウス属の種(*Amblyseius spp.*)+TX、
 アナグラファファルシフェラ(*Anagrapta falcifera*)NPV+TX
 、アングルサアトムス(*Anagrus atomus*)+TX、アブラコバチ(*Aph*
elinus abdominalis)+TX、コレマンアブラバチ(*Aphidiu*
s colemani)+TX、ショクガタマバエ(*Aphidoletes aphid*
imyza)+TX、オートグラファカリホルニカ(*Autographa cali*
fornica)NPV+TX、バチルススファエリクス(*Bacillus spha*
ericus Neide)+TX、ベアウベリアブロングニアルチイ(*Beauver*
ia brongniartii)+TX、ヤマトクサカゲロウ(*Chrysoperl*
a carnea)+TX、ツマアカオオヒメテントウ(*Cryptolaemus m* 20
ontrouzieri)+TX、コドリング(*Cydia pomonella*)GV
 +TX、ハモグリコマユバチ(*Dacnusa sibirica*)+TX、イサエアヒ
 メコバチ(*Diglyphus isaea*)+TX、オンシツツヤコバチ(*Encar*
ssia formosa)+TX、サバクツヤコバチ(*Eretmocerus ere*
micus)+TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ(*Heterorhabdit*
is bacteriophora)及びH.メギジス(*H. megidis*)+TX、
 ヒポダミアコンベルゲンス(*Hippodamia convergens*)+TX、フ
 ジコナヒゲナガトビコバチ(*Leptomastix dactylopii*)+TX、
 マクロロフスカリジノサス(*Macrolophus caliginosus*)+TX
 、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)NPV+TX、メタフィクスヘル 30
 ボルス(*Metaphycus helvolus*)+TX、メタリジウムアニソプリエ
 変種アクリヅム(*Metarhizium anisopliae var. acrid*
um)+TX、メタリジウムアニソプリエ変種アニソプリエ(*Metarhizium*
anisopliae var. anisopliae)+TX、マツノキハバチ(*Ne*
odiprion sertifer)NPV及びN.レコンティ(*N. leconte*
i)NPV+TX、ヒメハナカメムシ属の種(*Orius spp.*)+TX、パエシロ
 マイセスフモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)+T
 X、チリカブリダニ(*Phytoseiulus persimilis*)+TX、ステ
 イネルネマビビオニス(*Steinernema bibionis*)+TX、ステイネ
 ルネマカルボカプサエ(*Steinernema carpocapsae*)+TX、ス 40
 テイネルネマフェルチアエ(*Steinernema feltiae*)+TX、ステ
 イネルネマグラセリ(*Steinernema glaseri*)+TX、ステイネルネマ
 リオブラエb(*Steinernema riobrave*)+TX、ステイネルネマリ
 オブラビス(*Steinernema riobraviss*)+TX、ステイネルネマス
 カプテリスキ(*Steinernema scapterisci*)+TX、ステイネル
 ネマ属の種(*Steinernema spp.*)+TX、トリコグラマ属の種(*Tri*
chogramma spp.)+TX、チフロドロムスオクシデンタリス(*Typhl*
odromus occidentalis)+TX、ベルチシリウムレカニイ(*Ver*
ticillium lecanii)+TX、アホレート+TX、ピサジル+TX、ブ
 スルファン+TX、ジマチフ+TX、ヘメル+TX、ヘムパ+TX、メテパ+TX、メチ 50

オテパ + TX、メチルアホレート + TX、モルジド + TX、ペンフルロン + TX、テパ + TX、チオヘムパ + TX、チオテパ + TX、トレタミン + TX、ウレデパ + TX、(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートと (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナル + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アル + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールと 4 - メチルノナン - 5 - オン + TX、 - ムルチストリアチン + TX、プレビコミン + TX、コドレルレ + TX、コドレモン + TX、クエルレ + TX、ジスパールア + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、ドミニカルア + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート + TX、オイゲノール + TX、フロンタリン + TX、グランドルア + TX、グランドルア I + TX、グランドルア II + TX、グランドルア III + TX、グランドルア IV + TX、ヘキサルア + TX、イプスジエノール + TX、イプセノール + TX、ジャボニルア + TX、リネアチン + TX、リトルア + TX、ルーブルア + TX、メドルア + TX、メガトモ酸 + TX、メチルオイゲノール + TX、ムスカルア + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オルフラルア + TX、オリクタールア + TX、オストラモン + TX、シグルア + TX、ソルジジン + TX、スルカトール + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、トリメドルア + TX、トリメドルア A + TX、トリメドルア B₁ + TX、トリメドルア B₂ + TX、トリメドルア C + TX、トランク - コール (trunc - call) + TX、2 - (オクチルチオ)エタノール + TX、ブタピロノキシル + TX、プトキシ (ポリプロピレングリコール) + TX、ジブチルアジペート + TX、フタル酸ジブチル + TX、ジブチルコハク酸塩 + TX、ジエチルトルアミド + TX、ジメチルカルベート + TX、ジメチルフタレート + TX、エチルヘキサンジオール + TX、ヘキサミド + TX、メトキン - ブチル + TX、メチルネオデカンアミド + TX、オキサメート + TX、ピカリジン + TX、1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル)エタン + TX、1, 2 - ジクロロプロパンと 1, 3 - ジクロロプロペン + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル)酢酸エチル + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸塩 + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)フェニルジメチルカルバメート + TX、2 - (2 - プトキシエトキシ)エチルチオシアネート + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル)フェニルメチルカルバメート + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ)エタノール + TX、2 - クロロビニルジエチルリン酸塩 + TX、2 - イミダゾリドン + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン + TX、2 - メチル (プロブ - 2 - イニル)アミノフェニルメチルカルバメート + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート + TX、3 - プロモ - 1 - クロロプロブ - 1 - エン + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート + TX、4 - メチル (プロブ - 2 - イニル)アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート + TX、アセチオン + TX、アクリロニトリル + TX、アルドリン + TX、アロサミジン + TX、アリキシカルブ + TX、 - エクジソン + TX、リン化アルミニウム + TX、アミノカルブ + TX、アナバシン + TX、アチ

10

20

30

40

50

ダチオン+TX、アザメチホス+TX、バチルスチューリングシス(Bacillus
 thuringiensis) エンドトキシン+TX、バリウムヘキサフルオロシリケ
 ート+TX、バリウムポリスルフィド+TX、バルトリン+TX、バイエル22/190
 +TX、バイエル22408+TX、-シフルトリン+TX、-シペルメトリン+T
 X、バイオエタノメトリン+TX、ピオパーメトリン+TX、ビス(2-クロロエチル)
 エーテル+TX、ホウ酸ナトリウム+TX、ブロムフェンビンホス+TX、プロモ-DD
 T+TX、プフェンカルブ+TX、ブタカルブ+TX、ブタチオホス+TX、プトネート
 +TX、ヒ酸カルシウム+TX、シアン化カルシウム+TX、二硫化炭素+TX、四塩化
 炭素+TX、カルタップヒドロクロリド+TX、セバジン+TX、クロルピシクレン+T
 X、クロルダン+TX、クロルデコン+TX、クロロホルム+TX、クロルピクリン+T
 X、クロルホキシム+TX、クロルプラゾホス+TX、シス-レスメスリン+TX、シス
 メトリン+TX、クロシトリン+TX、アセト亜ヒ酸銅+TX、ヒ酸銅+TX、オレイン
 酸銅+TX、クミトエート+TX、氷晶石+TX、CS708+TX、シアノフェンホス
 +TX、シアノホス+TX、シクレトリン+TX、シチオエート+TX、d-テトラメト
 リン+TX、DAEP+TX、ダゾメット+TX、デカルボフラン+TX、ジアミダホス
 +TX、ジカプトン+TX、ジクロロフェンチオン+TX、ジクレシル+TX、ジシクラ
 ニル+TX、ディルドリン+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルリン酸塩+
 TX、ジロール+TX、ジメフルトリン+TX、ジメタン+TX、ジメトリン+TX、ジ
 メチルビンホス+TX、ジメチラン+TX、ジノプロブ+TX、ジノサム+TX、ジノセ
 ブ+TX、ジオフェノラン+TX、ジオキサベンゾホス+TX、ジチクロホス+TX、D
 SP+TX、エクジステロン+TX、EI 1642+TX、EMPC+TX、EPBP
 +TX、エタホス+TX、エチオフェンカルブ+TX、ギ酸エチル+TX、エチレンジブ
 ロミド+TX、ジクロロエタン+TX、エチレンオキシド+TX、EXD+TX、フェン
 クロルホス+TX、フェネタカルブ+TX、フェニトロチオン+TX、フェノキサクリム
 +TX、フェンピリトリン+TX、フェンスルホチオン+TX、フェンチオン-エチル+
 TX、フルコフロン+TX、ホスメチラン+TX、ホスピレート+TX、ホスチエタン+
 TX、フラチオカルブ+TX、フレトリン+TX、グアザチン+TX、グアザチン酢酸塩
 +TX、ナトリウムテトラチオカルボネート+TX、ハルフェンプロクス+TX、HCH
 +TX、HEOD+TX、ヘプタクロール+TX、ヘテロホス+TX、HHDN+TX、
 シアン化水素+TX、ヒキンカルブ+TX、IPSP+TX、イサゾホス+TX、イソベ
 ンザン+TX、イソドリン+TX、イソフェンホス+TX、イソラン+TX、イソプロチ
 オラン+TX、イソキサチオン+TX、幼虫ホルモンI+TX、幼虫ホルモンII+TX
 、幼虫ホルモンIII+TX、ケレバン+TX、キノプレン+TX、砒酸鉛+TX、レプ
 トホス+TX、リリムホス+TX、リチダチオン+TX、m-クメニルメチルカルバメー
 ト+TX、リン化マグネシウム+TX、マジドクス+TX、メカルホン+TX、メナゾン
 +TX、塩化第一水銀+TX、メスルフェンホス+TX、メタム+TX、メタム-カリウ
 ム+TX、メタム-ナトリウム+TX、メタンフッ化スルホニル+TX、メトクロトホス
 +TX、メトプレン+TX、メトトリン+TX、メトキシクロル+TX、メチルイソチオ
 シアネート+TX、メチルクロロホルム+TX、塩化メチレン+TX、メトキサジアゾン
 +TX、ミレックス+TX、ナフタロホス+TX、ナフタレン+TX、NC-170+T
 X、ニコチン+TX、ニコチンスルフェート+TX、ニチアジン+TX、ノルニコチン+
 TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート+T
 X、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロ
 チオネート+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イル
 ホスホロチオネート+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェー
 ト+TX、オレイン酸+TX、パラ-ジクロロベンゼン+TX、パラチオン-メチル+T
 X、ペンタクロロフェノール+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル+TX、PH 6
 0-38+TX、フェンカプトン+TX、ホスニクロル+TX、ホスフィン+TX、ホキ
 シム-メチル+TX、ピリメタホス+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体+T
 X、亜ヒ酸カリウム+TX、カリウムチオシアネート+TX、プレコセンI+TX、プレ

10

20

30

40

50

コセンII + TX、プレコセンIII + TX、ピリミドホス + TX、プロフルトリン + TX、
 プロメカルブ + TX、プロチオホス + TX、ピラゾホス + TX、ピレスメトリン + TX、
 カシア + TX、キナルホス - メチル + TX、キノチオン + TX、ラホキサニド + TX、
 レスメスリン + TX、ロテノン + TX、カデトリン + TX、リアニア + TX、リアノ
 ジン + TX、サバジラ) + TX、シュラダン + TX、セブホス + TX、SI - 0009 +
 TX、チアプロニル + TX、亜ヒ酸ナトリウム + TX、シアン化ナトリウム + TX、ナト
 リウムフッ化物 + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム + TX、ペンタクロロフェノキ
 シドナトリウム塩 + TX、セレン酸ナトリウム + TX、チオシアン酸ナトリウム + TX、
 スルコフロン + TX、スルコフロン - ナトリウム + TX、スルフリルフッ化物 + TX、ス
 ルプロホス + TX、タール油 + TX、チオナジン + TX、TDE + TX、テブピリムホス
 + TX、テメホス + TX、テラレスリン + TX、テトラクロロエタン + TX、チクロホス
 + TX、チオシクラム + TX、チオシクラム水素オキサレート + TX、チオナジン + TX
 、チオスルタップ + TX、チオスルタップ - ナトリウム + TX、トラロメトリン + TX、
 トランスパーメトリン + TX、トリアザメート + TX、トリクロルメタホス - 3 + TX、
 トリクロロナト + TX、トリメタカルブ + TX、トルプロカルブ + TX、トリクロピリカ
 ルブ + TX、トリプレン + TX、ベラトリジン + TX、ベラトリン + TX、XMC + TX
 、メトリン + TX、亜鉛ホスフィド + TX、ゾラプロホス + TX、及びメベルフルトリ
 ン + TX、テトラメチルフルトリン + TX、ビス(トリブチルスズ)オキシド + TX、
 プロモアセタミド + TX、第二鉄リン酸塩 + TX、ニコロアミド - オラミン + TX、酸
 化トリブチルスズ + TX、ピリモルフ + TX、トリフェンモルフ + TX、1, 2 - ジプロ
 モ - 3 - クロロプロパン + TX、1, 3 - ジクロロプロペン + TX、3, 4 - ジクロロテ
 トラヒドロチオフエン1, 1 - ジオキシド + TX、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メ
 チルロダニン + TX、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナン - 3 - イ
 ル酢酸 + TX、6 - イソペンテニルアミノプリン + TX、2 - フルオロ - N - (3 - メト
 キシフェニル) - 9H - プリン - 6 - アミン + TX、ベンクロチアズ + TX、サイトカイ
 ニン + TX、DCIP + TX、ルフラール + TX、イサミドホス + TX、カイネチン + T
 X、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 組成物
 + TX、テトラクロロチオフエン + TX、キシレノルス + TX、ゼアチン + TX、エチル
 キサントゲン酸カリウム + TX、アシベンゾラル + TX、アシベンゾラル - S - メチル +
 TX、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 + T
 X、 - クロロヒドリン + TX、アンツ + TX、炭酸バリウム + TX、ビスチオセミ + T
 X、プロジファクム + TX、プロマジオロン + TX、プロメタリン + TX、クロロファシ
 ノン + TX、コレカルシフェロール + TX、クマクロル + TX、クマフリル + TX、クマ
 テトラリル + TX、クリミジン + TX、ジフェナクム + TX、ジフェチアロン + TX、ジ
 ファシノン + TX、エルゴカルシフェロール + TX、フロクマフェン + TX、フルオロア
 セタミド + TX、フルプロバジン + TX、フルプロバジンヒドロクロリド + TX、ノルボ
 ルミド + TX、ホスアセチム + TX、リン + TX、ピンドン + TX、ピリヌロン + TX、
 シリロシド + TX、フルオロ酢酸ナトリウム + TX、硫酸タリウム + TX、ワルファリン
 + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート + TX、5 - (1, 3 - ベ
 ンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン + TX、ファル
 ネソールとネロリドール + TX、ベルブチン + TX、MGK 264 + TX、ピペロニル
 ブトキシド + TX、ピプロタル + TX、プロピル異性体 + TX、S421 + TX、セサ
 メックス + TX、セサスモリン + TX、スルホキシド + TX、アントラキノン + TX、ナ
 フテン酸銅 + TX、オキシ塩化銅 + TX、ジシクロペンタジエン + TX、チラム + TX、
 ナフテン酸亜鉛 + TX、ジラム + TX、イマニン + TX、リバピリン + TX、酸化水銀 (I
 I) + TX、チオファネート - メチル + TX、アザコナゾール + TX、ピテルタノール
 + TX、プロムコナゾール + TX、シプロコナゾール + TX、ジフェノコナゾール + TX
 、ジニコナゾール + TX、エポキシコナゾール + TX、フェンブコナゾール + TX、フル
 キンコナゾール + TX、フルシラゾール + TX、フルトリアホール + TX、フラメトピル
 + TX、ヘキサコナゾール + TX、イマザリル + TX、イミベンコナゾール + TX、イブ

10

20

30

40

50

コナゾール+TX、メトコナゾール+TX、マイクロブタニル+TX、パクロブトラゾール+TX、ペフラゾエート+TX、ペンコナゾール+TX、プロチオコナゾール+TX、ピリフェノックス+TX、プロクロラズ+TX、プロピコナゾール+TX、ピリソキサゾール+TX、シメコナゾール+TX、テブコナゾール+TX、テトラコナゾール+TX、トリアジメホン+TX、トリアジメノール+TX、トリフルミゾール+TX、トリチコナゾール+TX、アンシミドール+TX、フェナリモル+TX、ヌアリモル+TX、ブピリメート+TX、ジメチリモール+TX、エチリモール+TX、ドデモルフ+TX、フェンプロピジン+TX、フェンプロピモルフ+TX、スピロキサミン+TX、トリデモルフ+TX、シプロジニル+TX、メパニピリム+TX、ピリメタニル+TX、フェンピクロニル+TX、フルジオキソニル+TX、ベナラキシル+TX、フララキシル+TX、メタラキシル+TX、Rメタラキシル+TX、オフレース+TX、オキサジキシル+TX、カルベンダジム+TX、デバカルブ+TX、フベリダゾール+TX、チアベンダゾール+TX、クロゾリネート+TX、ジクロゾリン+TX、マイクロゾリン+TX、プロシミドン+TX、ピンクロゾリン+TX、ボスカリド+TX、カルボキシシン+TX、フェンフラム+TX、フルトラニル+TX、メプロニル+TX、オキシカルボキシシン+TX、ベンチオピラド+TX、チフルザミド+TX、ドジン+TX、イミノクタジン+TX、アゾキシストロピン+TX、ジモキシストロピン+TX、エネストロブリン+TX、フェナミンストロピン+TX、フルフェノキシストロピン+TX、フルオキサストロピン+TX、クレソキシム-メチル+TX、メトミノストロピン+TX、トリフロキシストロピン+TX、オリザストロピン+TX、ピコキシストロピン+TX、ピラクロストロピン+TX、ピラメトストロピン+TX、ピラオキシストロピン+TX、フェルバム+TX、マンコゼブ+TX、マンネブ+TX、メチラム+TX、プロピネブ+TX、ジネブ+TX、カプタホール+TX、キャプタン+TX、フルオロイミド+TX、ホルベット+TX、トリルフルアニド+TX、ボルドー液+TX、酸化銅+TX、マンカップー+TX、オキシシン銅+TX、ニトロタル-イソプロピル+TX、エディフェンホス+TX、イプロベンホス+TX、ホスジフェン+TX、トルコホス-メチル+TX、アニラジン+TX、ベンチアバリカルブ+TX、ブラストサイジン-S+TX、クロロネブ+TX、クロロタロニル+TX、シフルフェナミド+TX、シモキサニル+TX、ジクロシメット+TX、ジクロメジン+TX、ジクロラン+TX、ジエトフェンカルブ+TX、ジメトモルフ+TX、フルモルフ+TX、ジチアノン+TX、エタボキサム+TX、エトリジアゾール+TX、ファミキサドン+TX、フェンアミドン+TX、フェノキサニル+TX、フェリムゾン+TX、フルアジナム+TX、フルオピコリド+TX、フルスルファミド+TX、フルキサピロキサド+TX、フェンヘキサミド+TX、ホセチル-アルミニウム+TX、ヒメキサゾール+TX、イプロバリカルブ+TX、シアゾファミド+TX、メタスルホカルブ+TX、メトラフェノン+TX、ペンシクロン+TX、フタリド+TX、ポリオキシシン+TX、プロパモカルブ+TX、ピリベンカルブ+TX、プロキナジド+TX、ピロキロン+TX、ピリオフェノン+TX、キノキシフェン+TX、キントゼン+TX、チアジニル+TX、トリアゾキシド+TX、トリシクラゾール+TX、トリホリン+TX、バリダマイシン+TX、バリフェナレート+TX、ゾキサミド+TX、マンジプロパミド+TX、フルベネテラム+TX、イソピラザム+TX、セダキサン+TX、ベンゾピンジフルピル+TX、ピジフルメトフェン+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(3',4',5'-トリフルオロ-ピフェニル-2-イル)-アミド+TX、イソフルシプラム+TX、イソチアニル+TX、ジピメチトロン+TX、6-エチル-5,7-ジオキソ-ピロロ[4,5][1,4]ジチイノ[1,2-c]イソチアゾール-3-カルボニトリル+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[3-エチル-1,1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニル-ピリダジン-3-カルボニトリル+TX、(R)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[1,1,3-トリメチルインダン-4-イル]ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、4-(2-プロモ-4-フルオロ-フェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾール-

10

20

30

40

50

3 - アミン + TX、4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン + TX、
 フルインドアビル + TX、クメトキシストロピン (ジアキシアングジュンジ (j i a x i a n g j u n z h i)) + TX、ルベンミキシアナン (l v b e n m i x i a n a n) + TX、
 ジクロベンチアゾクス + TX、マンデストロピン + TX、3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3, 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノロン + TX、2 -
 [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] フェニル] プロパン - 2 - オール + TX、オキサチアピプロリン + TX、t - ブチル N - [6 - [[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + TX、ピラジフルミド + TX、インピルフルキサム + TX、ツロールプロカルブ + TX、メフェントリフルコナゾール + TX、イプフェントリフルコナゾール + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4, 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル) オキシ - 2, 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタンスルホン酸 + TX、ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[(Z) - [(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + TX、メチル N - [[5 - [4 - (2, 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フェニル] メチル] カルバメート + TX、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン + TX、ピリダクロメチル + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド + TX、1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン + TX、1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3, 4, 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラゾール - 5 - オン + TX、アミノピリフェン + TX、アメトクトラジン + TX、アミスルプロム + TX、ペンフルフェン + TX、(Z, 2E) - 5 - [1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシ - 2 - メトキシイミノ - N, 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エンアミド + TX、フロリルピコキサミド + TX、フェンピコキサミド + TX、テブフロキン + TX、イブフルフェノキン + TX、キノフメリン + TX、イソフェタミド + TX、N - [2 - [2, 4 - ジクロロ - フェノキシ] フェニル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド + TX、N - [2 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド + TX、ベンゾチオストロピン + TX、フェナマクリル + TX、5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール亜鉛塩 (2 : 1) + TX、フルオピラム + TX、フルチアニル + TX、フルオピモミド + TX、ピラプロポイン + TX、ピカルブトラゾクス + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - ((3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、メチルテトラプロール + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - ((3R) - 1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、(1, 1 - ジメチルエチル) - [4' - (トリフルオロメトキシ) [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル] - 5 - ピリミジンメタノール + TX、フルオキサピプロリン + TX、エノキサストロピン + TX、4 - [[6 - [

10

20

30

40

50

2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、4 - [[6 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - スルファニル - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、4 - [[6 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - チオキソ - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、トリネキサパック + TX、クモキシストロピン + TX、チョンサンマイルシン (z h o n g s h e n g m y c i n) + TX、チオジアゾール銅 + TX、チアゾール亜鉛 + TX、アメクトトラクチン + TX、イプロジオン + TX ; N ' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - プロポキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N ' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - [(1 R) - 1 - メチル - 2 - プロポキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N ' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロポキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N ' - [5 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロポキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N ' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロポキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - イソプロピル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 5 / 1 5 5 0 7 5 号に記載の方法により調製され得る) ; N ' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - (2 - プロポキシプロポキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (この化合物は、I P C O M 0 0 0 2 4 9 8 7 6 D に記載の方法により調製され得る) ; N - イソプロピル - N ' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル) フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N ' - [4 - (1 - シクロプロピル - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - エチル) - 5 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル] - N - イソプロピル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 2 2 8 8 9 6 号に記載の方法により調製され得る) ; N - エチル - N ' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [2 - トリフルオロメチル) オキセタン - 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N - エチル - N ' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [2 - トリフルオロメチル) テトラヒドロフラン - 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルムアミジン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 9 / 1 1 0 4 2 7 号に記載の方法により調製され得る) ; N - [(1 R) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1 S) - 1 - ベンジル - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 1 - メチル - プロピル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1 S) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル] - 7 , 8 - ジフルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、8 - フルオロ - N - [1 - [(3 - フルオロフェニル) メチル] - 1 , 3 - ジメチル - ブチル] キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - (1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル) - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1 R) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1 S) - 1 - ベンジル - 1 , 3 - ジメチル - ブチル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 1 5 3 3 8 0 号に記載の方法により調製され得る) ; 1 - (6 , 7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、1 - (6 , 7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4 , 4 , 6 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (6 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) イソキノリン + TX、4 , 4 -

10

20

30

40

50

ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (7 - メチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) イソキノリン + T X 、 1 - (6 - クロロ - 7 - メチル - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 5 5 1 0 号に記載の方法により調製され得る) ; 1 - (4 , 5 - ジメチルベンズイミダゾール - 1 - イル) - 4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X 、 1 - (4 , 5 - ジメチルベンズイミダゾール - 1 - イル) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X 、 6 - クロロ - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン + T X 、 4 , 4 - ジフルオロ - 1 - (5 - フルオロ - 4 - メチル - ベンズイミダゾール - 1 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン + T X 、 3 - (10
4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリン) - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] ベンズイミダゾール + T X (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 0 8 5 号に記載の方法により調製され得る) ; N - メトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] シクロプロパンカルボキサミド + T X 、 N , 2 - ジメトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド + T X 、 N - エチル - 2 - メチル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド + T X 、 1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] 尿素 + T X 、 1 , 3 - ジメトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] 尿素 + T X 、 3 - エチル - 1 - メトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] 尿素 + T X 、 N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] プロパンアミド + T X 、 4 , 4 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン + T X 、 5 , 5 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン - 3 - オン + T X 、 エチル 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + T X 、 N , N - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - アミン + T X 。 この段落中の化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 5 5 4 7 3 号、国際公開第 2 0 1 7 / 0 5 5 4 6 9 号、国際公開第 2 0 1 7 / 0 9 3 3 4 8 号及び国際公開第 2 0 1 7 / 1 1 8 6 8 9 号に記載の方法により調製され得る) 、 2 - [6 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 9 1 7 9 号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - [6 - (4 - プロモフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 9 1 7 9 号に記載の方法により調製され得る) ; 3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法により調製され得る) ; 3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法により調製され得る) ; (4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 0 6 9 4 5 号に記載の方法により調製され得る) ; 2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) 50

- テトロン + TX (この化合物は、国際公開第 2011/138281号に記載の方法により調製され得る) ; N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゼンカルボチオアミド + TX ; N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX、(Z, 2 E) - 5 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシ - 2 - メトキシイミノ - N, 3 - ジメチル - ペンタ - 3 - エンアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/153707号に記載の方法により調製され得る)、N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロフェノキシ) - 5 - メチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (この化合物は、国際公開第 2016/202742号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (この化合物は、国際公開第 2014/095675号に記載の方法により調製され得る) から選択される生物学的に有効な物質 ; (5 - メチル - 2 - ピリジル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX、(3 - メチルイソキサゾール - 5 - イル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2017/220485号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - オキソ - N - プロピル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/065414号に記載の方法により調製され得る) ; エチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + TX (この化合物は、国際公開第 2018/158365号に記載の方法により調製され得る) ; 2, 2 - ジフルオロ - N - メチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX、N - [(E) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX、N - [(Z) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX (これらの化合物は、国際公開第 2018/202428号に記載の方法により調製され得る) ;

以下を含む生物 (Macrobials) : アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) + TX、エルビアブラバチ (*Aphidius ervi*) (*Aphelinus - System* (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (*Acerophagus papaya*) + TX、フタモンテントウ (*Adalia bipunctata*) (*Adalia - System* (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (*Adalia bipunctata*) (*Adaline* (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (*Adalia bipunctata*) (*Aphidalia* (登録商標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (*Ageniaspis citricola*) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (*Ageniaspis fuscicollis*) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (*Amblyseius andersoni*) (*Anderline* (登録商標)) + TX、Andersoni - System (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (*Amblyseius californicus*) (*Amblyline* (登録商標)) + TX、Spical (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (*Amblyseius cucumeris*) (*Thripex* (登録商標)) + TX、Bugline cucumeris (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (*Amblyseius fallacis*) (*Fallacis* (登録商標)) + TX、スワルスキーカブリダニ (*Am*

blyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)
) + TX、Swirskii - Mite (登録商標)) + TX、ケナガカブリダニ (Am
 blyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標)) + TX
 、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + TX、アナグルス
 ・アトムス (Anagrus atomus) + TX、アナギルス・フスシベントリス (A
 nagyru s fusciventris) + TX、アナギルス・カマリ (Anag
 yru s kamali) + TX、Anagyru s loeckii + TX、アナギルス
 ・シュードコッカス (Anagyru s pseudococci) (Citripar
 (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefic
 es) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus caland 10
 rae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis
) (Anthocoris - System (登録商標)) + TX、アブラコバチ (Ap
 helinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) + TX、A
 philine (登録商標)) + TX、アフエリヌス・アシキス (Aphelinus
 asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius coleman
 i) (Ahipar (登録商標)) + TX、エルビアブラバチ (Aphidius e
 rvi) (Ervipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aph
 idius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphid
 ius matricariae) (Ahipar - M (登録商標)) + TX、アフィ
 ドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Ap 20
 hidend (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphido
 letes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) + TX、ア
 フィチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、ア
 フィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘ
 ゲノウイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタ・コリア
 リア (Atheta coriaria) (Staphyline (登録商標)) + TX
 、マルハナバチ属 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bo
 mbus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) +
 TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeli
 ne (登録商標)) + TX、Tripol (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステフ 30
 アノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコ
 ルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲ
 ロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標))
 + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chryso
 pa (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフイラブリス (Chrysoperla
 rufilabris) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (Cirrospilus
 ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (Cirrospil
 us quadristriatus) + TX、シトロステクス・フィロクニストイデス
 (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロ 40
 セルス・カマエレオン (Closterocerus chamaeleon) + TX、
 クロステロセルス属 (Closterocerus spp.) + TX、コシドキシノイ
 デス・ペルミヌツス (Coccidoxenoides perminutus) (Pl
 anopar (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウベリ (Coccophagu
 s cowperi) + TX、コッコファグス・リシムニア (Coccophagus
 lycimnia) + TX、キアシサムライコマユバチ (Cotesia flavip
 es) + TX、コナガサムライコマユバチ (Cotesia plutellae) + T
 X、ツマアカオオテントウムシ (Cryptolaemus montrouzieri
) (Cryptobug (登録商標)) + TX、Cryptoline (登録商標)) + T
 X、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハ
 モグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマユバチ (50

Dacnusa sibirica) (*Minusa* (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシルス (*Delphastus pusillus*) + TX、ジアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorphakrausii*) + TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ (*Diachasmimorphalongicaudata*) + TX、ジアパルス・ジユクンダ (*Diaparsis jucunda*) + TX、ジアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) + TX、*Digline* (登録商標) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標)) + TX、*Minex* (登録商標) + TX、ディベルシネルブス属 (*Diversinervus spp.*) + TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標)) + TX、*Encarline* (登録商標) + TX、*En-Strip* (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (*Encarsia guadeloupae*) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) + TX、ホソヒラ 10
 タアブ (*Episyrphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) + TX、エルトモセリス・シフォニニ (*Eretmoceris siphonini*) + TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Ercal* (登録商標)) + TX、*Eretline e* (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) + TX、エルトモセルス・ハヤチ (*Eretmocerus hayati*) + TX、エルトモセルス・ムンツス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標)) + TX、*Eretline m* (登録商標) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エキソコム 20
 ス・クアドリプスツラツス (*Exochomus quadripustulatus*) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Spidend* (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (*Fopius arisanus*) + TX、フォピウス・セラチチボルス (*Fopius ceratitivorius*) + TX、ホルモノネチン (*Wireless Beehome* (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*) (*Vespop* (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (*Galendromus occidentalis*) + TX、ゴニオズス・レグネリ (*Goniozus legneri*) + TX、シマメイガコマコ 30
 バチ (*Habrobracon hebetor*) + TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmonBeetle* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (*Heterorhabditis spp.*) (*Lawn Patrol* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標)) + TX、*Nemaseek* (登録商標) + TX、*Terranem-Nam* (登録商標) + TX、*Terranem* (登録商標) + TX、*Larvanem* (登録商標) + TX、*B-Green* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nematop* (登録商標) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス (*Heterorhabditis megidis*) (*Nemasys H* (登録商標)) + TX、*BioN* 40
 50

em H (登録商標) + TX、Exhibitline hm (登録商標) + TX、Larvanem - M (登録商標) + TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer - System (登録商標) + TX、Entomite - A (登録商標) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標) + TX、Entomite - M (登録商標) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシムス (Lecanoideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンツス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea abnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標) + TX、レプトマスチクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リポレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標) + TX、リシフレプス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノス (Macrolophus caliginosus) (Mirical - N (登録商標) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mirical (登録商標) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス・フラプス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンズブリイ (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標) + TX、ミクロテリス・フラプス (Microterys flavus) + TX、ムスディフラクス・ラポトレルス (Muscidifurax raptorellus) 及びスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (NesidioBug (登録商標) + TX、Nesibug (登録商標) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor - I (登録商標) + TX、Oriline i (登録商標) + TX、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus) (Thripor - L (登録商標) + TX、Oriline l (登録商標) + TX、オリウス・マジュスクルス (Orius majusculus) (Oriline m (登録商標) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (Orius strigicollis) (Thripor - S (登録商標) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniperorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pedibobius foveolatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarhabditis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標) + TX、フィマスティクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Spidex (登録商標) + TX、Phytoline p (登録商標) + TX、ポディスス・マクリベントリス (Podisus maculiventris) (Podisus (登録商標) + TX、シューダクテオン・クルバツス (Pseudacteon curvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (Pse

10

20

30

40

50

udacteon obtusus) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、シューダフィクス・マクリペンニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、シュードレプトマステイクス・メキシカーナ (*Pseudoleptomastix mexicana*) + TX、サイラエファグス・ピロス (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、サイタリア・コンコロール (*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、クアドラスティクス属 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (*Rhizobius lophanthae*) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、オオクビキレガイ (*Ruminadecollate*) + TX、セミエラケア・ペティオラツス (*Semielacherpetiolatus*) + TX、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (*ErviBank* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・カーポプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (*Nematac C* (登録商標)) + TX、*Millenium* (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (*Steinernema feltiae*) (*NemaShield* (登録商標)) + TX、*Nemasys F* (登録商標) + TX、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinernema-System* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標) + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia-rid* (登録商標) + TX、*Entonem* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ (*Steinernema kraussei*) (*Nemasys L* (登録商標)) + TX、*BioNem L* (登録商標) + TX、*Exhibitline sr b* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (*BioVector* (登録商標)) + TX、*BioVektor* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ属 (*Steinernema spp.*) + TX、スタイナーネマチド属 (*Steinernematid spp.*) (*Guardian Nematodes* (登録商標)) + TX、ステトルス・punkチルム (*Stethorus punctillum*) (*Stethorus* (登録商標)) + TX、タマリキシア・ラジアタ (*Tamarixia radiate*) + TX、テトラスティクス・セティファー (*Tetrastichus setifer*) + TX、トリポビウス・セミルテウス (*Thripobius semiluteus*) + TX、トリムス・シネンシス (*Torymus sinensis*) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricholine b* (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip* (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma evanescens*) + TX、トリコグラムマ・ミヌツム (*Trichogramma minutum*) + TX、アウノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ostrinia*) + TX、トリコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*); 及び
 以下のものを含む他の生物学的製剤: アブシジン酸 + TX、*bioSea* (登録商標) + TX、コンドロステレウム・プルプレウム (*Chondrostereum purpureum*) (*Chontrol Paste* (登録商標)) + TX、コレトリウム・グレオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (*Collego* (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (*Cueva* (登録商標)) + TX、デルタトラップ (*Trapline d* (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (*ProAct* (登録商

10

20

30

40

50

標) + TX、Ni - H I B I T G o l d C S T (登録商標) + TX、リン酸第二鉄 (F e r r i - p h o s p h a t e) (F e r r a m o l (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (T r a p l i n e y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (H o m o - b r a s s o n o l i d e) + TX、リン酸鉄 (L i l l y M i l l e r W o r r y F r e e F e r r a m o l S l u g & S n a i l B a i t (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (T r a p l i n e f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (M i c r o c t o n u s h y p e r o d a e) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (M y c o l e p t o d i s c u s t e r r e s t r i s) (D e s - X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Amino mite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (T h r i p l i n e a m s (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (M i l S t o p (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (S a n o v a (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (S i l - M a t r i x (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (E n z i c u r (登録商標)) + TX、SuffOil - X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (N o s e m a l o c u s t a e) (S e m a s p o r e O r g a n i c G r a s s h o p p e r C o n t r o l (登録商標)) + TX、粘着トラップ (T r a p l i n e Y F (登録商標) + TX、Rebell Amarillo (登録商標)) + TX及びトラップ (T a k i t r a p l i n e y + b (登録商標)) + TX。

【0586】

有効成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば [3 8 7 8 - 1 9 - 1] は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。有効成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会 (The British Crop Protection Council)] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号 (1) で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names” に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり [A . W o o d ; C o m p e n d i u m o f P e s t i c i d e C o m m o n N a m e s , (著 作 権) 1 9 9 5 - 2 0 0 4] ；例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス：<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> に記載されている。

【0587】

上記の有効成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」又は別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が使用されるか、又はそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。

【0588】

表 A - 1 ~ A - 2 9 7 及び表 P に定義される化合物から選択される式 I の化合物と、上記の有効成分との有効成分混合物は、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 及び表 P 内で定義される1つの化合物から選択される化合物並びに上記の有効成分を好ましくは 1 0 0 : 1 ~ 1 : 6 0 0 0、特に 5 0 : 1 ~ 1 : 5 0 の混合比、より特に 2 0 : 1 ~ 1 : 2 0、さらにより特に 1 0 : 1 ~ 1 : 1 0、非常に特に 5 : 1 及び 1 : 5 の比率で (2 : 1 ~ 1 : 2 の比率が特に

好ましく、4 : 1 ~ 2 : 1の比率が同様に好ましい)、とりわけ1 : 1、又は5 : 1、又は5 : 2、又は5 : 3、又は5 : 4、又は4 : 1、又は4 : 2、又は4 : 3、又は3 : 1、又は3 : 2、又は2 : 1、又は1 : 5、又は2 : 5、又は3 : 5、又は4 : 5、又は1 : 4、又は2 : 4、又は3 : 4、又は1 : 3、又は2 : 3、又は1 : 2、又は1 : 600、又は1 : 300、又は1 : 150、又は1 : 35、又は2 : 35、又は4 : 35、又は1 : 75、又は2 : 75、又は4 : 75、又は1 : 6000、又は1 : 3000、又は1 : 1500、又は1 : 350、又は2 : 350、又は4 : 350、又は1 : 750、又は2 : 750、又は4 : 750の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

【0589】

上記の混合物は、有害生物を防除する方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に施用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療の方法及び人又は動物の身体において実施される診断方法を除く。

10

【0590】

表A - 1 ~ A - 297及び表Pに定義される化合物から選択される式Iの化合物と、上記の1つ又は複数の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス形態において、「タンクミックス」など、単一の有効成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として及び逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用され得る。式Iの化合物並びに上記の有効成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0591】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油(例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油)、消泡剤、例えばシリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び/又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

20

【0592】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉碎し、篩にかけ、且つ/又は圧縮することにより、助剤の非存在下において、及び例えば有効成分を1つ又は複数の助剤と均質混合し、且つ/又は粉碎することにより、少なくとも1つの助剤の存在下においてそれ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法及びこれらの組成物の調製のための化合物Iの使用も本発明の主題である。

30

【0593】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ(これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである)など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1 ~ 1000 ppm、好ましくは、0.1 ~ 500 ppmの有効成分である。1ヘクタール当たりの施用量は、一般に、1ヘクタール当たり1 ~ 2000 gの有効成分、特に10 ~ 1000 g / ha、好ましくは、10 ~ 600 g / haである。

【0594】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用(葉面施用)であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度及び施用量を選択することができる。代わりに、有効成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、又は固体形態の有効成分を植物の生息地、例えば土壤中に例えば粒剤の形態で導入すること(土壌施用)により、根系(全身作用)を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

40

【0595】

本発明の式Iの化合物及びその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば果実、塊茎又は穀粒などの種子又は苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。代わ

50

りに、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することによって又は固体組成物の層を塗布することによって種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を例えばドリルまき時に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物及び防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に、100kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは、100kgの種子当たり5～150グラム（100kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

【0596】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むが、これらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

10

【0597】

本発明は、式Iの化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「被覆又は処理されるか及び／又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式Iの化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、式Iの化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

20

【0598】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬及び種子ベレットリングなど、当技術分野において公知のすべての好適な種子処理技術を含む。式Iの化合物の種子処理適用は、種まきの前又は種まき／種子の植え付けの際に噴霧又は種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

【0599】

本発明の化合物は、低施用量での効力がより高いことにより、及び／又は、異なる有害生物防除により、他の類似の化合物とは区別可能であり、これは、必要に応じて、より低い濃度、例えば10ppm、5ppm、2ppm、1ppm若しくは0.2ppm；又は、300、200若しくは100mgのAI/m²などのより低い施用量を用いる実験手法を用いて、当業者により検証が可能である。より高い効力は、高い安全性プロファイル（地上及び地下の非標的生物（魚類、鳥類及びハチ類など）に対して、向上した物理化学的特性又は高い生分解性）によって観察可能である。

30

【0600】

本発明の各態様及び実施形態において、「本質的になる」及びその変化形は、「含む」及びその変化形の好ましい実施形態であり、「からなる」及びその変化形は、「から本質的になる」及びその変化形の好ましい実施形態である。

【0601】

本出願の開示は、本明細書に開示される実施形態のあらゆる組合せを利用可能にする。

【0602】

式Iの化合物に関する本明細書の開示が、式I*、I'a、I-A、I'-A、I o、並びに表A-1～A-297及び表Pのそれぞれの化合物に関して同様に適用されることに留意されたい。さらに、式I'aの好ましい鏡像異性体が、式I a aの化合物、並びに表A-1～A-297及び表Pにも適用される。また、式I*、I'a、I-A、I'-A、I o、並びに表A-1～A-297及び表Pの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及び／又はN-オキシドも、本明細書において利用可能である。

40

【0603】

生物学的実施例：

以下の実施例により本発明を例示する。本発明の特定の化合物は、低施用量で効力が高い

50

ことにより公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用い、必要に応じて例えば50 ppm、24 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm又は0.2 ppmといったより少ない施用量を用いて、当業者により検証可能である。

【0604】

実施例 B 1：ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) (コーンルートワーム)

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた(1ウェル当たり6~10匹)。外寄生の4日後にサンプルを未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

10

【0605】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方(死亡率又は成長阻害)において少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、P 21、P 25、P 26、P 35、P 36、P 37、P 38、P 39

【0606】

実施例 B 2：ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウンスティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉にN2若虫を外寄生させた。サンプルを外寄生の5日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

20

【0607】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方(死亡率又は成長阻害)において少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P 11、P 36、P 37

30

【0608】

実施例 B 3：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ (*Western flower thrips*))：摂食/接触活性

ヒマワリの葉片を24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000のDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のフランクリニエラ属 (*Frankliniella*) 個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の7日後に死亡率について評価した。

【0609】

実施例 B 4：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニカメイチュウ)

人工餌料の入った24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた(1ウェル当たり6~8匹)。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の6日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。カテゴリ(死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害)の少なくとも1つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるニカメイガ (*Chilo suppressalis*) の防除がもたらされている。

40

【0610】

以下の化合物が、3つのカテゴリ(死亡率、摂食阻害又は成長阻害)の少なくとも1つにおいて、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：

50

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、P 21、P 22、P 23、P 24、P 25、P 26、P 27、P 28、P 29、P 35、P 36、P 37、P 38、P 39、P 40、P 41

【0611】

実施例 B 5：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ (*Diamond back moth*))

人工餌料の入った 24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をプラスチック製のステンシル介してゲル吸取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。サンプルを外寄生の 8 日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

10

【0612】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で 2 つのカテゴリの少なくとも一方 (死亡率又は成長阻害) において少なくとも 80 % の防除の効果をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、P 21、P 22、P 23、P 24、P 25、P 26、P 27、P 28、P 29、P 35、P 36、P 37、P 38、P 39、P 40、P 41

【0613】

実施例 B 6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))：摂食 / 接触活性

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にヒマワリの葉片を置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の 6 日後に死亡率について評価した。

20

【0614】

実施例 B 7：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))。浸透移行活性

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウマメの実生の根を、10,000 の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液に直接入れた。サンプルを実生をテスト溶液に入れてから 6 日後に死亡率について評価した。

30

【0615】

実施例 B 8：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))。固有活性

10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト化合物を 24 ウェルマイクロタイタープレートにピペットにより適用し、スクロース溶液と混合した。プレートを、伸ばした *Parafilm* で閉じた。24 個の孔が開いたプラスチック製のステンシルをプレート上に置き、外寄生させたエンドウマメの実生を *Parafilm* 上に直接置いた。外寄生させたプレートをゲル吸取り紙及び他のプラスチック製のステンシルで閉じ、次いで上下を逆さまにした。サンプルを外寄生の 5 日後に死亡率について評価した。

40

【0616】

以下の化合物は、12 ppm のテスト割合で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした：

P 4、P 35

【0617】

実施例 B 9：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ (*Egyptian cotton leaf worm*))

綿の葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に 5 匹の L1 幼虫を外寄生させた。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の 3 日後に死

50

亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。カテゴリ（死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害）の少なくとも1つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるエジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）の防除がもたらされている。

【0618】

以下の化合物が、3つのカテゴリ（死亡率、摂食阻害又は成長阻害）の少なくとも1つにおいて、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、P 21、P 22、P 23、P 24、P 25、P 26、P 35、P 36、P 37、P 38、P 39、P 40

10

【0619】

実施例 B 10：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ（*Egyptian cotton leaf worm*））

ピペットにより、テスト化合物を10,000 ppmのDMSOストック溶液から24ウェルプレートに適用し、寒天と混合した。レタスの種子を寒天上に置き、マルチウェルプレートを同様に寒天を含む他のプレートで閉じた。7日後、化合物は、根に吸収され、レタスが蓋プレート中に成長した。次いで、レタスの葉を蓋プレート中に切り取った。スポドプテラ（*Spodoptera*）の卵を、ピペットで、プラスチック製のステンシルを介して湿らせたゲル吸取り紙上にとり、蓋プレートをこれで閉じた。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の6日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した

20

【0620】

以下の化合物は、12.5 ppmのテスト割合で3つのカテゴリ（死亡率、摂食阻害又は成長阻害）における少なくとも1つにおいて少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P 1、P 35

【0621】

実施例 B 11：ネギアザミウマ（*Thrips tabaci*）（タマネギアザミウマ）
摂食 / 接触活性

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。

30

【0622】

実施例 B 12：モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（モモアカアブラムシ（*Green Peach Aphid*））：

10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物を液体ハンドリングロボットにより96 - ウェルマイクロタイタープレート中に適用し、スクロース溶液と混合した。96 - ウェルマイクロタイタープレート上にParafilmを伸ばし、96個の孔が開いたプラスチック製のステンシルをプレート上に置いた。アブラムシをウェル中のParafilm上に直接ふるい分けた。外寄生させたプレートをゲル吸取り用厚紙及び第2のプラスチック製のステンシルで閉じ、次いで上下を逆さまにした。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。

40

【0623】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を50 ppmの施用量でもたらした：

P 7、P 14、P 26

【0624】

実施例 B 13：コナガ（*Plutella xylostella*）（コナガ（*Diamondback Moth*））：

人工餌料を含む96 - ウェルマイクロタイタープレートを、液体ハンドリングロボットに

50

より、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液により処理した。乾燥させた後、卵（1ウェル当たり約30個）をネットを付けた蓋に外寄生させ、これを食餌の上方に吊り下げた。卵が付加するとL1幼虫が食餌に降りる。サンプルを外寄生の9日後に死亡率について評価した。

【0625】

以下の化合物は、500 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率の効果をもたらした：

P5、P6、P7、P8、P11、P12、P14、P18、P22、P24、P26、
P27、P35、P36、P40

10

20

30

40

50

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2020/055989

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D401/14 A01N35/04 A01N35/08 C07D401/04 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2017/192385 A1 (ELANCO TIERGESUNDHEIT AG [CH]; LILLY CO ELI [US]) 9 November 2017 (2017-11-09) cited in the application examples -----	1-15
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		
<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search 1 April 2020		Date of mailing of the international search report 17/04/2020
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Fazzi, Raffaella

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2020/055989

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2017192385 A1	09-11-2017	AR 108222 A1	01-08-2018
		AU 2017261187 A1	04-10-2018
		BR 112018069578 A2	22-01-2019
		CA 3023208 A1	09-11-2017
		CL 2018003021 A1	15-02-2019
		CN 109311841 A	05-02-2019
		CO 2018011825 A2	22-11-2018
		DK 3452460 T3	16-03-2020
		EA 201892191 A1	30-04-2019
		EP 3452460 A1	13-03-2019
		JP 6370504 B2	08-08-2018
		JP 2018517716 A	05-07-2018
		KR 20180132100 A	11-12-2018
		TW 201803863 A	01-02-2018
		TW 201938548 A	01-10-2019
		US 2018186778 A1	05-07-2018
		US 2019256501 A1	22-08-2019
		WO 2017192385 A1	09-11-2017

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04	
A 0 1 M	1/20 (2006.01)	A 0 1 M	1/20	A
A 0 1 C	1/08 (2006.01)	A 0 1 C	1/08	
A 0 1 G	13/00 (2006.01)	A 0 1 G	13/00	A
A 0 1 K	13/00 (2006.01)	A 0 1 K	13/00	C
C 0 7 D	403/04 (2006.01)	C 0 7 D	403/04	

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,N
E,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,
CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JO,JP,KE,K
G,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,N
I,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,
TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(72)発明者 エドマンズ アンドリュウ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 コリート クリーガー アマンディーヌ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタールシュトラッセ 6 7 シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 シェーツァー ユルゲン ハリー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

F ターム (参考) 2B051 AB01 BA09 BB01

2B121 AA11 AA16 CC02 EA26 EA30

4C063 AA01 AA03 CC41 DD12 DD31 EE03

4H011 AC01 BB09 BB11 BB15 DA02 DA04 DA05 DA15 DA16