

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7678660号

(P7678660)

(45)発行日 令和7年5月16日(2025.5.16)

(24)登録日 令和7年5月8日(2025.5.8)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 C 257/12 (2006.01)

C 0 7 C 257/12

C S P

A 0 1 N 37/52 (2006.01)

A 0 1 N 37/52

A 0 1 N 43/40 (2006.01)

A 0 1 N 43/40

1 0 1 P

A 0 1 N 43/84 (2006.01)

A 0 1 N 43/84

1 0 1

A 0 1 P 1/00 (2006.01)

A 0 1 P 1/00

請求項の数 13 (全124頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2019-541894(P2019-541894)

(86)(22)出願日 平成29年10月11日(2017.10.11)

(65)公表番号 特表2019-532106(P2019-532106

A)

(43)公表日 令和1年11月7日(2019.11.7)

(86)国際出願番号 PCT/IB2017/056276

(87)国際公開番号 WO2018/069841

(87)国際公開日 平成30年4月19日(2018.4.19)

審査請求日 令和2年9月8日(2020.9.8)

審査番号 不服2023-5138(P2023-5138/J1)

審査請求日 令和5年3月29日(2023.3.29)

(31)優先権主張番号 201611035245

(32)優先日 平成28年10月14日(2016.10.14)

(33)優先権主張国・地域又は機関
インド(IN)

(73)特許権者 519135367

ピーアイ インダストリーズ リミテッド

P I I N D U S T R I E S L T D

インド共和国 3 1 3 0 0 1 ラージャス

ターン, ウダイプル, ウダイサガー ロ

ード

(74)代理人 100103894

弁理士 家入 健

(72)発明者 ナイク マルチ エヌ.

インド共和国 5 8 1 3 2 0 カルナータ

カ, バトカル, ハヌマン ナガー, バン

ダー ロード シックスス クロス

(72)発明者 マハジャン ヴィシャル アショーク

インド共和国 4 1 1 0 0 8 プネー, ピ

ンブル ニラック, ヴィシャル ナガー,

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 4 - 置換フェニルアミン誘導体、および望ましくない植物病原性微生物と闘うことにより作物を保護するためのその使用

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

N' - (4 - ベンジル - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (メトキシ (フェニル) メチル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 , 5 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (4 - プロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (4 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - ブロモ - 4 - (4 - ブロモベンジル) - 3 , 6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - ブロモベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - ブロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 4 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 , 5 - ジメチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - ((Z) - (メチルイミノ) (フェニル) メチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン ;

N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;

10

20

30

40

50

N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
モルホリノメタンイミン ;
N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
(ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
N - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - モルホ
リノメタンイミン ;
N - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - (ピペ
リジン - 1 - イル) メタンイミン ;
N - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - モルホリ
ノメタンイミン ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (3 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
- エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - シアノベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (4 - シアノベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) -
N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 ,
5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フ
ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (4 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメ
タンイミン ;
N - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメ
タンイミン ;
N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン
- 1 - イル) メタンイミン ;
N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン -
1 - イル) メタンイミン ;
N - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン
- 1 - イル) メタンイミン ;
N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタ
ンイミン ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - シアノベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - シアノベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (ジフルオロ (フェニル) メチル) - 2 - ヨード - 3 , 6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - ベンジル - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - ((トリフルオロメチル) チオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - チオモルホリノメタンイミン ;
N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - チオモルホリノメタンイミン ;
N - (シクロプロピルメチル) - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - (シクロプロピルメチル) - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - (シクロプロピルメチル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - ((トリフルオロメチル) チオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

50

N' - (4 - (シアノ (フェニル) メチル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 3 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 , 3 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 ,
5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 - メ
チルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 -
メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル)
- N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 5 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル)
- N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフ
ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェ
ニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチル
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
チルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 , 6 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - プロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 , 5 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 5 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 3 - ジメチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) -
- N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 -
メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) -
N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
- エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) -
- N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル
) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル)
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
- メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
- メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (4 - フルオロフェニル) メチル) - 5 - メチルフェニ
ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - ((3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) (シアノ) メチル) -
5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (p - トリル) メチル) - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - ((2 - クロロフェニル) (シアノ) メチル) - 5 - メチルフェ
ニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - ((4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル) - 5 - メチルフェ
ニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - フルオロフェニル) メチル) - 5 - メチルフェニ
ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 6 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベン
ジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N
- エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェ
ニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 ,
5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 6 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

50

N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 5 -
- (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 4 - (シアノ (5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) メチル) - 2 -
メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (1 - (4 - ブロモフェニル) ビニル) - 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル)
- N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 4 - ((4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) (シアノ) メチル) -
2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N
- メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジフルオロフェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - シアノ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - シアノ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジフルオロフェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
- N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (4 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (4 - シクロプロピルベンジル) - 3 , 6 - ジメチルフ
ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (2 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N
- メチルホルムイミドアミド ;
N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
- メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド塩酸塩 ;
N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) - 2 - (メチ
ルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;
N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベ
ンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ; および
N' - (4 - (シアノ (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 2 , 5 - ジメチ
ルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ; からなる群から選択される
、化合物 ; および前記化合物の農学的に許容される塩、立体異性体、ジアステレオ異性体
、エナンチオマー、互変異性体、または N - オキシド。

10

20

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物および 1 種または複数種の不活性担体を含む、植物病原性微生物を防除または予防するための組成物。

【請求項 3】

前記組成物は、菌類駆除剤、殺虫剤、軟体動物駆除剤、ダニ駆除剤、バイオ農薬、除草剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料および / もしくはそれらの混合物から選択される 1 種または複数種の活性化合物をさらに含む、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物の濃度が、組成物の総重量に対して 1 ~ 90 重量 % の範囲である、請求項 2 に記載の組成物。

30

【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物の濃度が、組成物の総重量に対して 5 ~ 50 重量 % の範囲である、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 6】

農作物および / または園芸作物の植物病原菌、細菌の防除のための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 7】

農作物および / または園芸作物の植物病原菌を防除または予防するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

40

【請求項 8】

農作物および / または園芸作物の植物病原菌、細菌を防除または予防するための、請求項 2 に記載の組成物の使用。

【請求項 9】

前記農作物が、穀物、トウモロコシ、イネ、ダイズおよび他のマメ科植物、果実および果樹、堅果および堅果樹、柑橘類および柑橘果樹、任意の園芸植物、ウリ科、油性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、サトウダイコン、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、ペッパーおよび他の植物、ならびに観賞植物からなる群から選択される、請求項 8 に記載の使用。

50

【請求項 10】

農作物および／または園芸作物における有用植物での植物病原菌または細菌の蔓延を防除または予防する方法であって、請求項 1 に記載の化合物が、植物、その一部またはその部位に施用される方法。

【請求項 11】

農作物および／または園芸作物における有用植物での植物病原菌または細菌の蔓延を防除または予防する方法であって、請求項 1 に記載の化合物が、植物の種子に施用される方法。

【請求項 12】

請求項 1 に記載の化合物を使用して、農作物および／または園芸作物における植物病原菌または細菌を防除または予防する方法であって、農作物または園芸作物の 1 ヘクタール当たり 1 g ~ 5 kg の範囲の量の化合物を含む有効用量の化合物を施用することからなる方法。

10

【請求項 13】

前記農作物が、穀物、トウモロコシ、イネ、マメ科植物、果実および果樹、堅果および堅果樹、柑橘類および柑橘果樹、園芸植物、ウリ科、油性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、サトウダイコン、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、ペッパーおよび他の植物、ならびに観賞植物からなる群から選択される、請求項 10 に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【0001】

本発明は、望ましくない植物病原性微生物と闘うことにより作物を保護することを意図した化合物に関する。より正確には、本発明の主題は、望ましくない植物病原性微生物と闘うことにより作物を保護するために使用される 4 - 置換フェニルアミン誘導体に関する。

【背景技術】

【0002】

植物病原性微生物により引き起こされる作物への損害の防除は、高い作物効率を達成する上で極めて重要である。例えば、観賞植物、野菜、畑作物、穀物および果実作物への植物病害による損害は、生産性の著しい低下をもたらし、それにより消費者にコストの増加をもたらす。そのような損害を防除するための多くの製品が市販されている。より効果的、より低コスト、より低毒性、より環境に安全、および／または異なる作用機序を有する新たな化合物が依然として必要とされている。ある特定のフェニルアミン誘導体が、害虫駆除剤中の抗菌活性成分として文献中に開示されている。例えば、WO 2000046184、WO 2003093224、WO 2003024219、WO 2005089547、WO 2005120234 および US 20110082036 は、単独の、または組成物の一部としてのフェニルアミン誘導体、特にフェニルアミジンの菌類駆除剤としての使用を開示している。ある特定のフェニルベンズアミド化合物、そのような化合物を生成する方法、および望ましくない微生物を防除するためのその使用が、WO 2004005242 に開示されている。

30

【0003】

40

US 4173637 は、フェニル尿素化合物およびこの化合物を含む殺虫剤としての組成物を開示している。JP 08291146 は、優れた除草活性を有する N - 置換フェニルスルホンアミド化合物、特に水田用除草剤を開示している。WO 2008110314 は、菌類除去化合物としてのフルオロアルキルフェニルアミジン、その調製方法、およびそのような化合物を使用して望ましくない微生物から種子を保護するための方法を開示している。1つの他の PCT 出願公開 WO 2011095462 は、カルボキサミドを含むフェニルアミン誘導体、それを調製するための方法、およびこの誘導体を含む殺虫、ダニ駆除、軟体動物駆除または殺軟体動物組成物を開示している。カンジダ属、アスペルギルス属およびトリコフィトン属の菌類を含む病原性菌類に対する抗菌類活性を示す、薬学的に有用なある特定のアミジン化合物が、WO 2013018735 に開示されている。

50

【 0 0 0 4 】

従来技術において説明されているフェニルアミン誘導体の有効性は良好であるが、様々な場合において望まれる点が残されている。したがって、農業においては、既知の活性成分に耐性を有する菌類または細菌病原体または有害生物等の微生物の発生を回避および／または防除するために、新規な害虫駆除化合物を使用することが常に高い関心を集めている。したがって、使用される活性化合物の量を低減すると同時に、すでに知られている化合物と少なくとも同等の有効性を維持することを目的として、すでに知られているものより活性が高い新規な化合物を使用することが高い関心を集めている。

【 0 0 0 5 】

ここで、我々は、上述の効果または利点を有する化合物の新たなファミリーを見出した。したがって、本発明による化合物の新たなファミリー、すなわちフェニル環が置換された 4 - 置換フェニルアミン誘導体は、菌類または細菌病原体または有害生物等の望ましくない微生物に対する予想外の、およびはるかに高い活性を可能にする。

10

【発明の概要】

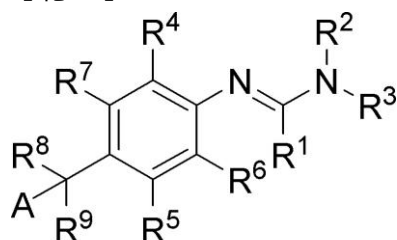
【課題を解決するための手段】

【 0 0 0 6 】

本発明は、一般式 (I)

【 0 0 0 7 】

【化 1】



20

(I)

の新規の発明的な 4 - 置換フェニルアミン誘導体に関し、置換基の定義は、上記の詳細な説明において定義されている。

30

【 0 0 0 8 】

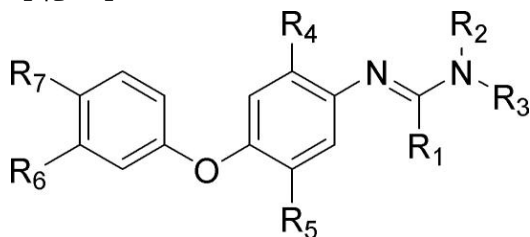
本発明の 4 - 置換フェニルアミン誘導体は、US 8 0 8 0 6 8 8 およびその対応する E P 出願第 2 1 2 0 5 5 8 号を考慮しても新規および発明的である。

【 0 0 0 9 】

US 8 0 8 0 6 8 8 は、一般式

【 0 0 1 0 】

【化 2】



40

により表される 3 , 4 - 二置換フェノキシフェニルアミジンを開示しており、式中、2つのフェニル環は「 - O - 」により連結されている。

【 0 0 1 1 】

US 8 0 8 0 6 8 8 の化合物 (I) の 1 8 ~ 2 5 頁のスキーム I、ステップ (a ~ f)、および化合物 (I) の 2 7 ~ 3 0 頁のステップ (g ~ j) を参照されたい。また、4 8 ~ 4 9 頁の表 I V 中の例を参照されたい。

50

【 0 0 1 2 】

しかしながら、18頁の段落5の実施形態および請求項4において、US8080688の出願人は、3,4-二置換ベンジルフェニルアミジンを開示している。US8080688で開示されている3,4-二置換ベンジルフェニルアミジン化合物のリストを以下に複製する。

N' - [4 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イルメチル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - { 4 - [(3 , 3 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) メチル] - 2 , 5 - ジメチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - [4 - (3 - クロロ - 4 - イソプロピルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

10

N' - [4 - (3 - クロロ - 4 - tert - ブチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N - エチル - N' - { 4 - [(3 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) メチル] - 2 , 5 - ジメチルフェニル } - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - [4 - (3 - クロロ - 4 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - { 2 , 5 - ジメチル - 4 - [(1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) メチル] フェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

20

N' - { 2 , 5 - ジメチル - 4 - [(1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) メチル] フェニル } - N - イソプロピル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - { 2 , 5 - ジメチル - 4 - [(1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) メチル] フェニル } - N - メチル - N - プロピルイミド - ホルムアミド、

N' - [2 , 5 - ジメチル - 4 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イルメチル) フェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - [2 , 5 - ジメチル - 4 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イルメチルフェニル) - N - イソプロピル - N - メチルイミドホルムアミド、

30

N' - [2 , 5 - ジメチル - 4 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イルメチル) フェニル] - N - メチル - N - プロピルイミドホルムアミド、

2 , 5 - ジメチル - N - [(1 E) - ピペリジン - 1 - イルメチレン] - 4 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラ - ヒドロナフタレン - 2 - イルメチル) アニリン、

4 - (4 - tert - ブチル - 3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチル - N - [(1 E) - ピペリジン - 1 - イルメチレン] アニリン、

N' - (4 - { 3 - クロロ - 4 - [(トリメチルシリル) メチル] ベンジル } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - [4 - (3 - クロロ - 4 - イソブチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

40

N' - [4 - (4 - ブチル - 3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 4 - (トリフルオロメチル) - 3 - [(トリメチルシリル) メチル] ベンジル } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、および

N' - { 4 - [3 - シクロペンチル - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 2 , 5 - ジメチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド。

【 0 0 1 3 】

US8080688におけるこの3,4-二置換ベンジルフェニルアミジン化合物の開示は、以下の理由から誤りがあり、意図的ではない：i) 請求項4の言葉から、出願人は3,4-二置換フェノキシフェニルアミジンを請求することを意図しており、3,4-二

50

置換ベンジルフエニルアミジンを請求することを意図していないようである； i i) 3 , 4 - 二置換ベンジルフエニルアミジンは、スキームおよび実施例に記載の手順によって調製され得ない； i i i) U S 8 0 8 0 6 8 8 の 4 8 ~ 4 9 頁の表 I V において、3 , 4 - 二置換フェノキシフェニルアミジンのみが開示されている。

【 0 0 1 4 】

したがって、U S 8 0 8 0 6 8 8 およびその対応する E P 出願第 2 1 2 0 5 5 8 号における訂正を必要とするこの誤植を考慮して、本発明の化合物は新規である。

【 0 0 1 5 】

本発明の化合物の発明性 / 非自明性は、実施例の項で示される比較結果から確認され得、そこでは驚くべきことに本発明の化合物が有害生物、微生物、雑草または非生物のストレスによる攻撃に対する作物保護の有効性をさらに増加させることが観察される。

10

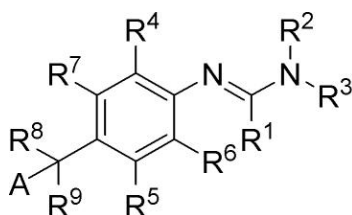
【発明を実施するための形態】

【 0 0 1 6 】

したがって、本発明は、一般式 (I)

【 0 0 1 7 】

【化 3】



20

(I)

(式中、

R^1 は、水素、CN、 SR'' 、 $S(O_n)R''$ 、 OR'' 、 $C_1 \sim 12$ -アルキル、 $C_1 \sim 12$ -アルコキシ、 $C_1 \sim 12$ -アルキルチオ、 $C_2 \sim 12$ -アルケニル、 $C_2 \sim 12$ -アルキニル、 $C_1 \sim 12$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim 12$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim 12$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim 8$ -シクロアルキル、 $C_4 \sim 8$ -シクロアルケニル、 $C_5 \sim 8$ -シクロアルキニルからなる群から選択され；環式環系において、1個もしくは複数の炭素原子は、N、O、および $S(O)_n$ からなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；

30

R^2 および R^3 は、独立して、水素、CN、 $S(O)_n R''$ 、 OR'' 、 $(C=O)-R''$ 、 $C_1 \sim 12$ -アルキル、 $C_2 \sim 12$ -アルケニル、 $C_2 \sim 12$ -アルキニル、 $C_1 \sim 12$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim 12$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim 12$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim 8$ -シクロアルキル、 $C_4 \sim 8$ -シクロアルケニル、 $C_5 \sim 8$ -シクロアルキニル、 $C_5 \sim 18$ -アリール、 $C_7 \sim 19$ -アラルキル、 $C_7 \sim 19$ -アルカリールからなる群から選択され；環式環系において、1個もしくは複数の炭素原子は、N、O、および $(O)_n$ からなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；または

R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 もしくは R^1 および R^3 は、それらが結合している原子と共に、もしくはC、N、O、Sからなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびに $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ および SiR'_2 からなる群から選択される1~3つの環員を任意選択で含めて、4~7員環を形成してもよく、この環は、一部が、1つもしくは複数のX、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ により置換されていてもよく； R^1 、 R^2 および R^3 のそれぞれは、X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ からなる群から選択される1つもしくは複数の基により任意選択で置換されていてもよく；

40

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、独立して、水素、X、CN、SCN、 SF_5 、 $S(O)_n R''$ 、 SiR'' 、 OR'' 、 $NR''R''$ 、 $(C=O)-R''$ 、 CR'' 、 $C_1 \sim 12$ -アルキル、 $C_2 \sim 12$ -アルケニル、 $C_2 \sim 12$ -アルキニル、 $C_1 \sim 12$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim$

50

12 - ハロアルケニル、C₂~12 - ハロアルキニル、C₁~12 - ハロアルコキシ、C₁~12 - ハロアルキルチオ、C₃~8 - シクロアルキル、C₄~8 - シクロアルケニル、C₅~8 - シクロアルキニル、C₃~8 - シクロアルキルオキシ、C₃~8 - シクロアルキルチオ、C₅~18 - アリール、C₇~19 - アラルキル、C₇~19 - アルカリールからなる群から選択され；環式環系において、1個もしくは複数の炭素原子は、N、O、およびS(O)_nからなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；上述の基はすべて、X、R'、OR'、SR'、N₂RSiR'₃、COOR'、CN、およびCONR'₂からなる群から選択される1つもしくは複数の基により任意選択で置換されていてもよく；または

R⁴およびR⁷もしくはR⁵およびR⁶は、それらが結合している原子と共に、もしくはC、N、O、Sからなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびにC(=O)、C(=S)、S(O)_mおよびSiR'₂からなる群から選択される1~3つの環員を任意選択で含めて、4~7員環を形成してもよく、この環は、一部が、1つもしくは複数のX、R'、OR'、SR'、N₂RSiR'₃、COOR'、CN、およびCONR'₂により置換されていてもよく；R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷のそれぞれは、X、R'、OR'、SR'、N₂RSiR'₃、COOR'、CN、およびCONR'₂からなる群から選択される1つもしくは複数の基により任意選択で置換されていてもよく；

R⁸およびR⁹は、独立して、水素、X、CN、SCN、S(O)_nR'、OS(O_n)R'、SiR'₃、OSiR'₃、NR'R'、NR'SiR'₃、(C=O)-R'、CR'=NR'、C~12 - アルキル、C₂~12 - アルケニル、C₂~12 - アルキニル、C₁~12 - アルコキシ、C₁~12 - ハロアルキル、C₂~12 - ハロアルケニル、C₂~12 - ハロアルキニル、C₁~12 - ハロアルコキシ、C₁~12 - ハロアルキルチオ、C₃~8 - シクロアルキル、C₄~8 - シクロアルケニル、C₅~8 - シクロアルキニル、C₃~8 - シクロアルキルオキシ、C₃~8 - シクロアルキルチオ、C₅~18 - アリール、C₇~19 - アラルキル、C₇~19 - アルカリールからなる群から選択され；環式環系において、1個もしくは複数の炭素原子は、N、O、およびS(O)_nからなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；上述の基はすべて、X、R'、OR'、SR'、N₂RSiR'₃、COOR'、CN、およびCONR'₂からなる群から選択される1つもしくは複数の基により置換されていてもよく；または

R⁸およびR⁹は、それらが結合している原子と共に、もしくはC、N、O、Sからなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびにC(=O)、C(=S)、S(O)_mおよびSiR'₂からなる群から選択される1~3つの環員を任意選択で含めて、3~7員環を形成してもよく、この環は、一部が、1つもしくは複数のX、R'、OR'、SR'、NR'₂、SiR'₃、COOR'、CN、およびCONR'₂により置換されていてもよく；またはR⁸およびR⁹は、それらが結合している原子と共に、=C(R'R')、=S、=NR'の基を形成してもよく；

Aは、縮合または非縮合C₆~18 - アリール、C₅~18 - ヘテロアリールからなる群から選択され、1個または複数の炭素原子は、N、O、Sから選択されるヘテロ原子により置き換えられ、またR¹⁰の1つまたは複数の基により任意選択で置換されたC(=O)、C(=S)、S(O)_mおよびSiR'₂からなる群から選択される1~3つの環員を任意選択で含み、但し、ヘテロアリールはチアゾリルまたはチアジアゾリルを表さず；

R¹⁰は、水素、X、CN、SCN、SF₅、R'、OR'、N₂RSiR'₂、SiR'₃、(C=O)-R'、S(O_n)R'、OS(O_n)R'、NR'SiR'₃、OSiR'₃、C₁~8 - アルキル - S(O)_nR'、C~8 - アルキル - (C=O)-R'、CR'=NR'、S(O_n)C₅~18 - アリール、S(O)_nC₇~19 - アラルキル、S(O)_nC₇~19 - アルカリール、C₁~12 - アルキル、C₂~12 - アルケニル、C₂~12 - アルキニル、C₁~12 - ハロアルキル、C₂~12 - ハロアルケニル、C₂~12 - ハロアルキニル、C₁~12 - アルコキシ、C₁~12 - アルキルチオ、C₁~12 - ハロアルコキシ、C₁~12 - ハロアルキルチオ、C₃~12 - シクロアルキル、C₄~8 - シクロアルケニル、C₅~8 - シクロアルキニル、C₃~8 - シクロアルキルオキシ、C₃~8 - シクロ

アルキルチオ、 $C_{7\sim 19}$ -アラルキル、 $C_{7\sim 19}$ -アルカリール；二環式 $C_{5\sim 12}$ -アルキル、 $C_{7\sim 12}$ -アルケニルからなる群から選択され；環式環系において、1個または複数の炭素原子は、N、O、および $S(O)_n$ からなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；上述の基はすべて、X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NR_2SiR'_3$ 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ からなる群から選択される1つまたは複数の基により置換されていてもよく；

R^8 、 R^9 、および R^{10} のそれぞれは、X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NR_2SiR'_3$ 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ からなる群から選択される1つまたは複数の基により任意選択で置換されていてもよく；

Xは、ハロゲンを表し；

R' は、水素、1つまたは複数のXにより任意選択で置換された直鎖もしくは分岐鎖 $C_{1\sim 12}$ -アルキルまたは環式 $C_{3\sim 10}$ -アルキルを表し；

R'' は、水素； NR_2 、 OR' 、X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NR_2SiR'_3$ 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ からなる群から選択される1つまたは複数の基により任意選択で置換された直鎖または分岐鎖 $C_{1\sim 12}$ -アルキル、 $C_{1\sim 12}$ -ハロアルキル、環式 $C_{3\sim 8}$ -アルキル、1つまたは複数の R' により任意選択で置換された $C_{5\sim 18}$ -アリールを表し；

R''' は、水素、 R'' 、CN、 OR' 、 $(C=O)-R'$ 、 $COOR'_2$ 、直鎖または分岐鎖 $C_{1\sim 12}$ -アルキル、 $C_{2\sim 12}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 12}$ -アルキニル；環式 $C_{3\sim 8}$ -アルキル、 $C_{4\sim 8}$ -アルケニル、 $C_{5\sim 8}$ -アルキニル； $C_{5\sim 18}$ -アリール、 $C_{7\sim 19}$ -アラルキル、 $C_{7\sim 19}$ -アルカリールからなる群から選択され；環式環系において、1個または複数の炭素原子は、N、O、および $S(O)_n$ からなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；上述の基はすべて、X、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ からなる群から選択される1つもしくは複数の基により置換されていてもよく；あるいは

R' および R'' は、それらが結合している原子と共に、またはN、O、および $S(O)_n$ からなる群から選択されるさらなる原子と共に、3～6員環を形成してもよく、この環は、一部が、1つまたは複数のX、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR_2 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、CN、および $CONR'_2$ により置換されていてもよく；

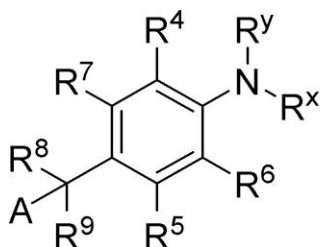
mおよびnは整数を表し、 $n=0$ 、1または2であり； $m=1$ または2である）の化合物に関する。

【0018】

1つの他の実施形態によれば、一般式(Ia)の化合物はさらに、

【0019】

【化4】



(Ia)

として説明され得、式中、

R^x および R^y は、独立して、水素、ヒドロキシ、CN、 NO_2 、 $COOR'$ 、 $S(O)_n$ 、 R'' 、 OR' 、 $(C=O)-R'$ 、 $C_{1\sim 12}$ -アルキル、 $C_{2\sim 12}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 12}$ -アルキニル、 $C_{3\sim 8}$ -シクロアルキル、 $C_{4\sim 8}$ -シクロアルケニル、 $C_{5\sim 8}$ -シクロアルキニル、 $C_{5\sim 18}$ -アリール、 $C_{7\sim 19}$ -アラルキル、 $C_{7\sim 19}$ -アルカリールからなる群から選択され；環式環系において、1個もしくは複数の炭素原子は、N、O

10

20

30

40

50

、および $S(O)_n$ からなる群から選択されるヘテロ原子により置き換えられていてもよく；または

R^x および R^y は、それらが結合している原子と共に、もしくは C 、 N 、 O 、 S からなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびに $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ および $S i R'_2$ からなる群から選択される 1 ~ 3 つの環員を任意選択で含めて、3 ~ 7 員環を形成してもよく、この環は、一部が、1 つもしくは複数の X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 $S i R'_3$ 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ により置換されていてもよく；
 R^x および R^y の基のすべては、 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR'_2 、 $S i R'_3$ 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ からなる群から選択される 1 つもしくは複数の基により任意選択で置換されていてもよく；
 すべての他の置換 A および $R^4 \sim R^{10}$ は、上記実施形態の 1 つにおいて定義された通りである。

10

【0020】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物の R^1 は、水素、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキルチオ、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキル、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキルである。

【0021】

1 つの別の実施形態のより好ましい置換において、一般式 (I) の化合物の R^1 は、水素、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキルである。

【0022】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物の R^2 および R^3 は、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ -アルケニル、 $C_{2 \sim 6}$ -アルキニル、 $C_{1 \sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキルチオ、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキル、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキルである。

20

【0023】

1 つの別の実施形態において、 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 または R^1 および R^3 は、それらが結合している原子と共に、または C 、 N 、 O 、 S からなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびに $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ および $S i R'_2$ からなる群から選択される 1 ~ 3 つの環員を任意選択で含めて、4 ~ 7 員環を形成してもよく、この環は、一部が、1 つまたは複数の X 、 R' 、 OR' 、 SR' および CN により置換されて

30

【0024】

1 つの別の実施形態において、それらが結合している原子と共に置換 R^1 および R^2 、 R^2 および R^3 または R^1 および R^3 を有する好ましい環形成構造は、アゼチジン、ピロリジン、イミダゾリジン、オキサゾリジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、ピペラジン、1-メチルピペラジン、1-メチルピロリジン、1-メチルピペリジン、3-メチル-1,3-チアジナンである。

【0025】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物の R^4 および R^5 は、 X 、 CN 、 $S(O)_n R'^1$ 、 $NR' R'^1$ 、 $(C=O)-R'^1$ 、 $CR' \rightleftharpoons NR'^1$ 、 C_{40} アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ -アルケニル、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキル、 $C_{1 \sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキルチオ、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキル、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキルチオである。

【0026】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物の R^6 および R^7 は、水素、 X 、 CN 、 $S(O)_n R'^1$ 、 $NR' R'^1$ 、 $(C=O)-R'^1$ 、 $CR' \rightleftharpoons NR'^1$ 、 $C_{1 \sim 6}$ -アルキル、 $C_{2 \sim 6}$ -アルケニル、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキル、 $C_{1 \sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$ -ハロアルキルチオ、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキル、 $C_{3 \sim 8}$ -シクロアルキルチオである。

【0027】

50

R^4 および R^7 または R^5 および R^6 は、それらが結合している原子と共に、または C、N、O、S からなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびに $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ および SiR'_2 からなる群から選択される 1 ~ 3 つの環員を任意選択で含めて、4 ~ 7 員環を形成してもよく、この環は、一部が、1 つまたは複数の X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR' 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ により置換されていてもよく； R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 のそれぞれは、 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 NR' 、 SiR'_3 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ からなる群から選択される 1 つまたは複数の基により任意選択で置換されていてもよい。

【0028】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物上の R^8 および R^9 は、水素、 X 、 CN 、 $S(O)_nR'$ 、 $NR'R'$ 、 $(C=O)-R'$ 、 $CR' \rightarrow NR'$ 、 C_{1-6} -アルキル、 C_{1-6} -ハロアルキル、 C_{1-6} -アルコキシ、 C_{1-6} -ハロアルコキシ、 C_{1-4} -アルキルチオ、 C_{1-6} -ハロアルキルチオ、 C_{3-8} -シクロアルキル、 C_{3-8} -シクロアルコキシ、 C_{3-8} -シクロアルキルチオである。

【0029】

1 つの別の実施形態において、 R^8 および R^9 は、それらが結合している原子と共に、または C、N、O、S からなる群から選択されるさらなる原子と共に、3 ~ 6 員環を形成してもよく、この環は、一部が、1 つまたは複数の X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NR'SiR'_3$ 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ により置換されていてもよい。

【0030】

1 つの別の実施形態の好ましい置換において、一般式 (I) の化合物上の R^{10} は、水素、 X 、 CN 、 SCN 、 SF_5 、 R' 、 OR' 、 NOR'_2 、 SiR'_3 、 $(C=O)-R'$ 、 $S(O)_nR'$ 、 C_{1-8} -アルキル- $S(O)_nR'$ 、 C_{1-6} -アルキル- $(C=O)-R'$ 、 $CR' = NR'_2$ 、 C_{1-6} -アルケニル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{1-6} -ハロアルキル、 C_{2-6} -ハロアルケニル、 C_{1-12} -アルコキシ、 C_{1-12} -アルキルチオ、 C_{1-12} -ハロアルコキシ、 C_{1-12} -ハロアルキルチオ、 C_{3-8} -シクロアルキル、 C_{4-8} -シクロアルケニル、 C_{3-8} -シクロアルキルオキシ、 C_{3-8} -シクロアルキルチオである。

【0031】

1 つの別の実施形態において、2 つの R^{10} は、それらが結合している原子と共に、または C、N、O、S からなる群から選択されるさらなる原子と共に、ならびに $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)_m$ および SiR'_2 からなる群から選択される 1 ~ 3 つの環員を任意選択で含めて、4 ~ 10 員環を形成してもよく、この環は、一部が、1 つまたは複数の X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NR'SiR'_3$ 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ により置換されていてもよい。

【0032】

1 つの別の実施形態において、好ましい A は、1 つまたは複数の R^{10} で置換されたフェニル、ナフタレニル、フリル、チエニル、ピロリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、インダゾリル；ベンゾフラニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、シンノニルである。

【0033】

1 つの別の実施形態において、より好ましい A は、1 つまたは複数の R^{10} で置換されたフェニル、ナフタレニル、チエニル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルである。

【0034】

1 つの別の実施形態において、 $R^1 \sim R^{10}$ は、 X 、 R' 、 OR' 、 SR' 、 $NRSiR'_3$ 、 $COOR'$ 、 CN 、および $CONR'_2$ からなる群から選択される 1 つまたは複数の基によりさらに任意選択で置換されていてもよい。

【 0 0 3 5 】

1つの別の実施形態において、一般式（I）の好ましい化合物は、

- N' - (4 - ベンジル - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N - エチル - N' - (4 - (メトキシ (フェニル) メチル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (3 , 5 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (4 - プロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (3 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (4 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 - プロモ - 4 - (4 - プロモベンジル) - 3 , 6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (3 - プロモベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (3 - プロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 4 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (4 - (4 - プロモベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
- N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 5 - ジメチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - ((Z) - (メチルイミノ) (フェニル) メチル) フェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
 モルホリノメタンイミン ;
 N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
 (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
 モルホリノメタンイミン ;
 N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 -
 (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - モルホ
 リノメタンイミン ;
 N - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - (ピペ
 リジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - 1 - モルホリ
 ノメタンイミン ;
 N' - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - メチル
 ホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - シアノベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (4 - シアノベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (4 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン ;
 N - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン ;
 N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン ;
 N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メトキシ - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メトキシ - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン ;
 N - シアノ - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) ホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - シアノホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - シアノベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - シアノベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (ジフルオロ (フェニル) メチル) - 2 - ヨード - 3 , 6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - ベンジル - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - ニトロベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) チオ) ベンジル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - イソプロピル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - アリル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N - アリル - N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - チオモルホリ
 ノメタンイミン ;
 N - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - チオモルホリノ
 メタンイミン ;
 N - (シクロプロピルメチル) - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチ
 ルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - (シクロプロピルメチル) - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチ
 ルフェニル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - (シクロプロピ
 ルメチル) - N - イソプロピルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - シアノ - N - (シ
 アノメチル) ホルムイミドアミド ;
 N - シアノ - N - (シアノメチル) - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジ
 メチルフェニル) ホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) チオ) ベンジル) フェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 5 - ピス(トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチル
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - シアノベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル)
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル)
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル)
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 5 - ピス (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - (1 - シアノエチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロ - 3 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェ
 ニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - (ジメチルアミノ) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 3 - ジメチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 4 - ジメチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 5 - ジメチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - シアノベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) -
 N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) -
 N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 3 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル)
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) -
 N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 (E) - N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル)
) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベン
 ジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (シアノ (フェニル) メチル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 3 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 3 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 ,
 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 - メ
 チルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 -
 メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 5 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフ
 ェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチル
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メ
 チルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
 メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 6 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - プロモベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 5 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 4 - ジフルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 5 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 3 - ジメチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル)
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 5 -
 メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 -
 メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) -
 N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジクロロ - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル)
 - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル
) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル)
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (4 - フルオロフェニル) メチル) - 5 - メチルフェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - ((3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) (シアノ) メチル) -
 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (p - トリル) メチル) - 5 - メチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - ((2 - クロロフェニル) (シアノ) メチル) - 5 - メチルフェ
 ニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - ((4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル) - 5 - メチルフェ
 ニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - フルオロフェニル) メチル) - 5 - メチルフェニ
 ル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 6 - ジクロロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エ
 チル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベン
 ジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N
 - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - メチルフェニル) - N -
 エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロ - 5 - メチルベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (ピリジン - 2 - イルメチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 , 6 - ジフルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (ピリジン - 3 - イルメチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (2 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - ((Z) - (メチルイミノ) (o - トリル) メチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 メチル N - (2 - ブロモ - 4 - (4 - ブロモベンジル) - 3 , 6 - ジメチルフェニル) ホルムイミデート
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - ブロモ - 3 , 6 - ジメチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル

10

20

30

40

50

-)フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (4 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (2 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (3 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N' - (2 - フルオロ - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;
 N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - (シアノ (5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) メチル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 メチル 2 - (2 - クロロ - 4 - (((エチル (メチル) アミノ) メチレン) アミノ) - 5 - メチルフェニル) - 2 - (3 - クロロフェニル) アセテート
 N' - (4 - (1 - (4 - プロモフェニル) ビニル) - 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 2 - (2 - クロロ - 4 - (((エチル (メチル) アミノ) メチレン) アミノ) - 5 - メチルフェニル) - 2 - (3 - フルオロフェニル) - N , N - ジメチルプロパンアミド ;
 2 - (2 - クロロ - 4 - (((エチル (メチル) アミノ) メチレン) アミノ) - 5 - メチルフェニル) - 2 - (5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N , N - ジメチルアセトアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - ((4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) (シアノ) メチル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジフルオロフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - シアノ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - シアノ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 , 5 - ジフルオロフェニル) - N - エチル - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N -
 メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル -
 N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (4 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (4 - シクロプロピルベンジル) - 3 , 6 - ジメチルフ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 - シクロプロピル - 4 - (2 - メチルベンジル) - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (2 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N
 - メチルホルムイミドアミド ;
 N' - (4 - (2 - クロロベンジル) ナフタレン - 1 - イル) - N - エチル - N - メチルホ
 ルムイミドアミド ;
 N - エチル - N - メチル - N' - (4 - (2 - メチルベンジル) ナフタレン - 1 - イル) ホ
 ルムイミドアミド ;
 N' - (2 - クロロ - 4 - (シアノ (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) メチル) - 5
 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド塩酸塩 ;
 N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) - 2 - (メチ
 ルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

10

20

30

40

50

N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (4 - メチルベンジル) - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 4 - (3 - メチルベンジル) - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N - エチル - N' - (4 - (2 - フルオロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド ;

N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) ホルムイミドアミド ;

N - エチル - N - メチル - N' - (5 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) ホルムイミドアミドおよび

N - エチル - N' - (5 - フルオロ - 2 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - メチルホルムイミドアミド

である。

* 化合物名は Chemdraw Professional 16.0 を使用して生成された。

【 0 0 3 6 】

本発明による化合物はいずれも、化合物中の不斉中心の数に応じて1つまたは複数の光学、幾何またはキラル異性体形態で存在し得る。したがって、本発明は、すべての光学異性体およびそれらのラセミまたはスカレミック混合物（「スカレミック」という用語は異なる割合でのエナンチオマーの混合物を指す）、ならびにすべての割合でのすべての可能な立体異性体の混合物に等しく関連する。ジアステレオ異性体および/または光学異性体は、それ自体当業者に知られている方法に従って分離され得る。

【 0 0 3 7 】

また、本発明による化合物はいずれも、化合物中の二重結合の数に応じて1つまたは複数の幾何異性体形態で存在し得る。したがって、本発明は、すべての幾何異性体、およびすべての割合でのすべての可能な混合物に等しく関連する。幾何異性体は、それ自体当業者に知られている一般的方法に従って分離され得る。

【 0 0 3 8 】

また、本発明による化合物はいずれも、その調製、精製、貯蔵および様々な他の影響因子に応じて1つまたは複数の不定形または同形または多形形態で存在し得る。したがって、本発明は、すべての割合でのすべての可能な不定形、同形および多形形態に関連する。不定形、同形および多形形態は、それ自体当業者に知られている一般的方法に従って調製

および／または分離および／または精製され得る。

【0039】

上記説明において、単独で、または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」等の複合語で使用する「アルキル」という用語は、直鎖または分岐状アルキル、例えばメチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、または様々なブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体を含む。

【0040】

「アルケニル」は、直鎖または分岐状アルケン、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、ならびに様々なブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体を含む。「アルケニル」はまた、ポリエン、例えば1,2-プロパジエニルおよび2,4-ヘキサジエニルを含む。

10

【0041】

「アルキニル」は、直鎖または分岐状アルキン、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニルならびに様々なブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体を含む。「アルキニル」はまた、複数の三重結合を含む部分、例えば2,5-ヘキサジイニルを含み得る。

【0042】

「環式アルキル」または「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルを含む。環式アルケニルは、例えば、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、およびシクロヘキセニルを含む。環式アルキニルは、同様に、環式ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニルおよびオクチニルを指す。

20

【0043】

「アリール」という用語は、本明細書において使用される場合、これらに限定されないが、フェニル、ナフタレン、ピフェニル、アントラセン等を含む任意の炭素ベース芳香族基を含む基である。アリール基は、置換または非置換であってもよい。さらに、アリール基は、単環構造であってもよく、あるいは縮合環構造である、または炭素-炭素結合等の1つもしくは複数の架橋基を介して結合した複数の環構造を含んでもよい。

【0044】

環に関連する「ヘテロ」という用語は、少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、独立して窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含み得る環を指すが、但し、各環は、4個以下の窒素、2個以下の酸素および2個以下の硫黄を含む。

30

【0045】

「ヘテロシクリル」という用語は、少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、独立して窒素、酸素、硫黄、リン、ホウ素等を含む群から選択されるヘテロ原子を含み得る環式環系を意味する。

【0046】

「ヘテロシクリル」という用語は、さらに「非芳香族ヘテロ環」および「芳香族ヘテロ環またはヘテロアリール」として分類され得る。

【0047】

「非芳香族ヘテロ環」という用語は、縮合または非縮合3~15員、好ましくは3~12員飽和または完全もしくは部分不飽和ヘテロ環、単環式または多環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）ヘテロ環を含み、ヘテロ原子は、酸素、窒素および硫黄の群から選択され；環が2個以上の酸素原子を含む場合、それらは直接隣接せず；非芳香族ヘテロ環の限定されない例は、オキセタニル、オキシラニル；アジリジニル；チイラニル、アゼチジニル、チエタニル、ジチエタニル、ジアゼチジニル、2-テトラヒドロフラニル；3-テトラヒドロフラニル；2-テトラヒドロチエニル；3-テトラヒドロチエニル；2-ピロリジニル；3-ピロリジニル；3-イソオキサゾリジニル；4-イソオキサゾリジニル；5-イソオキサゾリジニル；3-イソチアゾリジニル；4-イソチアゾリジニル；2-テトラヒドロピラニル；4-テトラヒドロピラニルを含む。この定義はまた、別の箇所ですpecific

40

50

に定義されない限り、ヘテロシクリルアルキル（上で定義されたアルキル部分を含むヘテロ環基）等の複合置換基の一部としてのヘテロシクリルにも適用される。

【0048】

「ヘテロアリールアリール」という用語は、本明細書で使用される場合、縮合または非縮合3～15員、好ましくは3～12員、より好ましくは5または6員単環式または多環式不飽和環系を含む基であり、酸素、窒素、硫黄、リン、ホウ素等の群から選択されるヘテロ原子を含む。

【0049】

5員ヘテロアリール基の限定されない例は、2-フリル；3-フリル；2-チエニル；3-チエニル；2-ピロリル；3-ピロリル；3-イソオキサゾリル；4-イソオキサゾリル；5-イソオキサゾリル；3-イソチアゾリル；4-イソチアゾリル；5-イソチアゾリル；3-ピラゾリル；4-ピラゾリル；5-ピラゾリル；2-オキサゾリル；4-オキサゾリル；5-オキサゾリル；2-チアゾリル；4-チアゾリル；5-チアゾリル；2-イミダゾリル；4-イミダゾリル；1,2,4-オキサジアゾール-3-イル；1,2,4-オキサジアゾール-5-イル；1,2,4-チアジアゾール-3-イル；1,2,4-チアジアゾール-5-イル；1,2,4-トリアゾール-3-イル；1,3,4-オキサジアゾール-2-イル；1,3,4-チアジアゾール-2-イルおよび1,3,4-トリアゾール-2-イル；1-ピロリル；1-ピラゾリル；1,2,4-トリアゾール-1-イル；1-イミダゾリル；1,2,3-トリアゾール-1-イル；1,3,4-トリアゾール-1-イル等を含む。

【0050】

6員ヘテロアリール基の限定されない例は、2-ピリジニル；3-ピリジニル；4-ピリジニル；3-ピリダジニル；4-ピリダジニル；2-ピリミジニル；4-ピリミジニル；5-ピリミジニル；2-ピラジニル；1,3,5-トリアジン-2-イル；1,2,4-トリアジン-3-イル；1,2,4,5-テトラジン-3-イル等を含む。

【0051】

ベンゾ融合5員ヘテロアリールの限定されない例は、インドール-1-イル；インドール-2-イル；インドール-3-イル；インドール-4-イル；インドール-5-イル；インドール-6-イル；インドール-7-イル；ベンズイミダゾール-1-イル；ベンズイミダゾール-2-イル；ベンズイミダゾール-4-イル；ベンズイミダゾール-5-イル；インダゾール-1-イル；インダゾール-3-イル；インダゾール-4-イル；インダゾール-5-イル；インダゾール-6-イル；インダゾール-7-イル；インダゾール-2-イル；1-ベンゾフラン-2-イル；1-ベンゾフラン-3-イル；1-ベンゾフラン-4-イル；1-ベンゾフラン-5-イル；1-ベンゾフラン-6-イル；1-ベンゾフラン-7-イル；1-ベンゾチオフェン-2-イル；1-ベンゾチオフェン-3-イル；1-ベンゾチオフェン-4-イル；1-ベンゾチオフェン-5-イル；1-ベンゾチオフェン-6-イル；1-ベンゾチオフェン-7-イル；1,3-ベンゾチアゾール-2-イル；1,3-ベンゾチアゾール-4-イル；1,3-ベンゾチアゾール-5-イル；1,3-ベンゾチアゾール-6-イル；1,3-ベンゾチアゾール-7-イル；1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル；1,3-ベンゾオキサゾール-4-イル；1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル；1,3-ベンゾオキサゾール-6-イル；1,3-ベンゾオキサゾール-7-イル等を含む。

【0052】

ベンゾ融合6員ヘテロアリールの限定されない例は、キノリン-2-イル；キノリン-3-イル；キノリン-4-イル；キノリン-5-イル；キノリン-6-イル；キノリン-7-イル；キノリン-8-イル；イソキノリン-1-イル；イソキノリン-3-イル；イソキノリン-4-イル；イソキノリン-5-イル；イソキノリン-6-イル；イソキノリン-7-イル；イソキノリン-8-イル等を含む。

【0053】

「アラルキル」という用語は、上で定義されたアルキル部分を含むアリール炭化水素基

10

20

30

40

50

を指す。その例は、ベンジル、フェニルエチル、および 6 - ナフチルヘキシルを含む。本明細書において使用される場合、「アラルケニル」という用語は、上で定義されたアルケニル部分、および上で定義されたアリール部分を含むアリール炭化水素基を指す。その例は、スチリル、3 - (ベンジル)プロパ - 2 - エニル、および 6 - ナフチルヘキサ - 2 - エニルを含む。

【0054】

「アルカリール」という用語は、アルキル基を有するアリール基を指し；本明細書において使用される場合、「アルカリール」という用語は、置換された基および非置換の基の両方を含む。アルカリール基の一例は、4 - メチルフェニル基である。

【0055】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシならびに様々なブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を含む。

【0056】

「アルキルチオ」は、分岐状または直鎖アルキルチオ部分、例えばメチルチオ、エチルチオ、ならびに様々なプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体を含む。

【0057】

「ハロゲン」という用語は、単独で、または「ハロアルキル」等の複合語で、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。

【0058】

置換基内の炭素原子の総数は接頭辞「C_{i-j}」により示され、i および j は、1 ~ 21 の数である。例えば、C₁₋₃アルコキシは、メトキシからプロポキシまでを指す。上記の列挙において、式 (I) の化合物が 1 つまたは複数のヘテロ環式環を含む場合、すべての置換基は、利用可能な炭素または窒素上の水素の置き換えにより、前記炭素または窒素を介してこれらの環に結合している。

【0059】

化合物が、1 を超えてもよい置換基の数を示す下付き文字を有する前記置換基で置換されている場合、前記置換基 (1 を超える場合) は、独立して、定義された置換基の群から選択される。さらに、下付き文字が範囲を示す場合、例えば (R)_{i-j} の場合、置換基の数は、i ~ j (これらを含む) の整数から選択され得る。

【0060】

基が、水素であってもよい置換基を含む、例えば R¹ または R² である場合、この置換基が水素として考えられる時には、これは非置換の前記基と同等であると理解される。

【0061】

本発明は、さらに、式 (I) の化合物の少なくとも 1 種、および 1 種もしくは複数種の不活性担体を含む、望ましくない微生物を防除するための組成物に関する。不活性担体は、さらに、農業的に適切な補助剤、溶媒、希釈剤、界面活性剤および / または増量剤等を含む。

【0062】

本発明は、さらに、式 (I) の化合物の少なくとも 1 種、ならびに / または、菌類駆除剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、殺虫剤、軟体動物駆除剤、除草剤、バイオ農薬、植物成長調節剤、抗生物質、肥料および / もしくはそれらの混合物から選択される 1 種もしくは複数種の活性適合性化合物を含む、望ましくない微生物を防除するための組成物に関する。

【0063】

本発明は、さらに、一般式 (I) を有する化合物の濃度が、組成物の総重量に対して 1 ~ 90 重量 %、好ましくは組成物の総重量に対して 5 ~ 50 重量 % の範囲である組成物に関する。

【0064】

本発明はまた、望ましくない微生物を防除するための方法に関し、式 (I) の化合物は、微生物および / またはその生息環境に施用される。

10

20

30

40

50

【 0 0 6 5 】

本発明は、さらに、式 (I) の少なくとも 1 種の化合物で処理された種子を使用することにより、望ましくない微生物に対して種子を保護するための方法を提供する。

【 0 0 6 6 】

式 (I) の化合物は、強力な抗菌活性を有し得、農作物または園芸作物保護、およびそのような材料の保護において、望ましくない微生物、例えば菌類、昆虫、ダニ、線形動物および細菌の防除に使用され得る。

【 0 0 6 7 】

式 (I) の化合物は、非常に良好な菌類除去特性を有し得、作物保護において、例えばプラスモジオホラ属、卵菌類、ツボカビ綱、接合菌、子囊菌、担子菌および不完全菌の防除に使用され得る。

10

【 0 0 6 8 】

式 (I) の化合物は、作物保護において軟体動物駆除剤として、例えばカンセンチュウ類、ニセハリセンチュウ類、およびトリプロンチダ (*Trypionchida*) の防除に使用され得る。

【 0 0 6 9 】

式 (I) の化合物は、作物保護において殺虫剤として、例えば鱗翅目、鞘翅目、半翅目、同翅目、総翅目、双翅目、直翅目および等翅目の防除に使用され得る。

【 0 0 7 0 】

式 (I) の化合物は、作物保護においてダニ駆除剤として、例えばフシダニ上科、ハダニ上科、エウポドイデア (*Eupodoidea*) 、およびホコリダニ科の防除に使用され得る。

20

【 0 0 7 1 】

式 (I) の化合物は、作物保護において殺菌剤として、例えばシュードモナス科、リゾビウム科、腸内細菌科、コリネバクテリウム科およびストレプトミセス科の防除に使用され得る。

【 0 0 7 2 】

式 (I) の化合物は、除草剤として使用され得、広範囲の経済的に重要な有害単子葉植物および双子葉植物に対して効果的となり得る。単子葉植物の広葉系雑草種は、一年生植物群からのカラスムギ属、ライグラス属、スズメノテッポウ属、クサヨシ属、ヒエ属、メヒシバ属、セタリア属およびカヤツリグサ属の種、ならびに多年生種であるカモジグサ属、ギョウギシバ属、チガヤ属およびモロコシ属、さらに多年生カヤツリグサ属の種を含み得る。双子葉植物の広葉系雑草種は、一年生ではヤエムグラ属、スミレ属、クワガタソウ属、オドリコソウ属、ハコベ属、ヒユ属、シロガラシ属、サツマイモ属、シダ属、シカレギク属およびイチビ属を、また多年生広葉系雑草の場合はヒルガオ属、アザミ属、ギシギシ属およびヨモギ属を含み得る。イネに生じる有害植物、例えばヒエ属、オモダカ属、サジオモダカ属、ハリイ属、ホタルイ属およびカヤツリグサ属等は、式 (I) の化合物により防除され得る。

30

【 0 0 7 3 】

式 (I) の化合物は、植物病原菌の治癒的または保護的防除に使用され得る。したがって、本発明はまた、種子、植物もしくは植物部分、果実、または植物が成長する土壤に施用される本発明の活性成分または組成物の使用により植物病原菌を防除するための治癒的および保護的方法に関する。

40

【 0 0 7 4 】

式 (I) の化合物は、農作物および / または園芸作物の植物病原菌、細菌、昆虫、線形動物、ダニを防除または予防するために使用され得る。

【 0 0 7 5 】

式 (I) の化合物は、作物保護に使用され得、農作物は、穀物、トウモロコシ、イネ、ダイズおよび他のマメ科植物、果実および果樹、堅果および堅果樹、柑橘類および柑橘果樹、任意の園芸植物、ウリ科、油性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、サトウダイコ

50

ン、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、ペッパーおよび他の植物、ならびに観賞植物である。

【 0 0 7 6 】

本発明によれば、上で定義されたように、担体は、より良好な施用性、特に植物もしくは植物部分または種子への施用のために活性成分が混合または組み合わされる、天然または合成有機または無機物質である。固体または液体であってもよい担体は、一般に不活性であり、農業における使用に適切であるべきである。

【 0 0 7 7 】

有用な固体担体は、例えば、アンモニウム塩および天然岩粉、例えばカオリン、粘土、タルク、白亜、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土、ならびに合成岩粉、例えば微粉化シリカ、アルミナおよびシリケートを含み；顆粒に有用な固体担体は、例えば、粉碎および断片化天然岩石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイト、さらには無機および有機粉体の合成顆粒、ならびに有機材料、例えば紙、おがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコの茎の顆粒を含み；有用な乳化剤および/または発泡剤は、例えば、非イオン性およびアニオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリアルスルホネート、さらにはタンパク質加水分解物を含み；適切な分散剤は、非イオン性および/またはイオン性物質、例えばアルコール - P O E および/もしくは - P O P エーテル、酸および/もしくは P O P P O E エステル、アルキルアリアルおよび/もしくは P O P P O E エーテル、脂肪および/もしくは P O P P O E 付加物、P O E - および/もしくは P O P - ポリオール誘導体、P O E - および/もしくは P O P - ソルビタンもしくは - 糖付加物、アルキルもしくはアリアルサルフェート、アルキル - もしくはアリアルスルホネートおよびアルキルもしくはアリアルホスフェート、または対応する P O - エーテル付加体のクラスからのものである。さらに、オリゴマーまたはポリマー、例えばビニルモノマー、アクリル酸、E O および/もしくは P O 単独から、または例えば(ポリ)アルコールもしくは(ポリ)アミンと組み合わせて得られたものが適切である。また、リグニンおよびそのスルホン酸誘導体、非修飾および修飾セルロース、芳香族および/または脂肪族スルホン酸、さらにはそのホルムアルデヒドとの付加物を使用することも可能である。

【 0 0 7 8 】

活性成分は、そのまま施用されてもよく、または特別な配合物に変換されてもよく、またはそれから調製されたその配合形態もしくは使用形態、例えばすぐに使用可能な溶液、エマルジョン、水性もしくは油性懸濁液、粉末、水和剤、ペースト、可溶性粉末、可溶性錠剤、粉剤、可溶性顆粒、散布用顆粒、サスポエマルジョン濃縮物、活性成分が含浸された天然産物、活性成分が含浸された合成物質、肥料、さらにはポリマー物質へのマイクロカプセル化形態であってもよい。施用は慣例的な様式で、例えば散水、噴霧、霧化、苗床箱、散布、散粉、発泡、展着等により達成される。また、超微量法により活性成分を分布させる、または活性成分調製物もしくは活性成分自体を土壌に注入することも可能である。また、植物の種子を処理することも可能である。

【 0 0 7 9 】

活性成分は、水溶性、熱安定性、バイオアベイラビリティ、官能特性、および生理学的性能をさらに改善する目的で、ナノ配合物にさらに変換され得る。

【 0 0 8 0 】

さらに、配合物の種類の選択は、特定の用途に依存する。

【 0 0 8 1 】

言及された配合物は、それ自体知られた様式で、例えば活性成分を少なくとも1種の慣例的な増量剤、溶媒または希釈剤、乳化剤、分散剤および/または結合剤もしくは定着剤、湿潤剤、撥水剤、適切な場合には乾燥剤およびUV安定剤、ならびに適切な場合には染料および顔料、消泡剤、保存剤、補助増粘剤、粘着剤、ジベレリン、さらには他の加工補助剤と混合することにより調製され得る。

【 0 0 8 2 】

本発明は、すでにすぐに使用可能で適切な装置により植物または種子に分布させることができる配合物だけでなく、使用前に水で希釈する必要がある商業用濃縮物も含む。

【 0 0 8 3 】

使用される補助剤は、組成物自体、および／またはそれから得られる調製物（例えば噴霧液体、種子粉衣）に特定の特性、例えばある特定の技術的特性および／または特定の生物学的特性を付与するのに適切な物質であってもよい。典型的な補助剤は、増量剤、溶媒および担体を含む。

【 0 0 8 4 】

好適な増量剤は、例えば、水、極性および非極性有機化学物質液体、例えば芳香族および非芳香族炭化水素（例えばパラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼン）、アルコールおよびポリオール（任意選択で置換、エーテル化および／またはエステル化されていてもよい）、ケトン（例えばアセトン、シクロヘキサノン）、エステル（脂肪および油を含む）、ならびに（ポリ）エーテル、非置換および置換アミン、アミド、ラクタム（例えばN-アルキルピロリドン）およびラクトン、スルホン、ならびにスルホキシド（例えばジメチルスルホキシド）である。

【 0 0 8 5 】

液化ガス状増量剤または担体は、標準温度および標準圧力下でガス状である液体、例えばエアロゾル噴射剤、例えばハロ炭化水素、またはその他にブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素を意味することが理解される。

【 0 0 8 6 】

配合物において、粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒もしくはラテックスの形態の天然および合成ポリマー、例えばアラビアガム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニル、またはその他に天然リン脂質、例えばセファリンおよびレシチン、ならびに合成リン脂質を使用することが可能である。さらなる添加剤は、ミネラル、植物油およびメチル化種子油であってもよい。

【 0 0 8 7 】

使用される増量剤が水である場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を使用することも可能である。有用な液体溶媒は、本質的に、芳香族、例えばキシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン、塩素化芳香族もしくは塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサノンもしくはパラフィン、例えば石油留分、アルコール、例えばブタノールもしくはグリコールならびにそれらのエーテルおよびエステル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド、またはその他に水である。

【 0 0 8 8 】

式(I)の化合物を含む組成物は、さらなる成分、例えば界面活性剤をさらに含んでもよい。適切な界面活性剤は、乳化剤および／もしくは発泡剤、イオン性もしくは非イオン性特性を有する分散剤もしくは湿潤剤、またはこれらの界面活性剤の混合物である。その例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールまたは脂肪酸または脂肪アミンとの重縮合物、置換フェノール（好ましくはアルキルフェノールまたはアリールフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはアルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールまたはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪エステル、ならびにサルフェート、スルホネートおよびホスフェートを含む化合物の誘導体、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリールスルホネート、タンパク質加水分解物、リグノサルファイト排液、ならびにメチルセルロースである。界面活性剤の存在は、活性成分の1つおよび／または不活性担体の1つが水に不溶である場合、および施用が水を用いて実行される場合に必要である。界面活性剤の割合は、本発明の組成物の5～40重量パーセントである。

10

20

30

40

50

【 0 0 8 9 】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー等の染料、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料等の有機染料、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩等の微量栄養素を使用することが可能である。

【 0 0 9 0 】

さらなる添加剤は、香料、ミネラルまたは野菜、任意選択で修飾された油、ワックスおよび栄養素（微量栄養素を含む）、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩であってもよい。

【 0 0 9 1 】

追加の成分は、安定剤、例えば低温安定剤、保存剤、酸化防止剤、光安定剤、または化学的および／もしくは物理的安定性を改善する他の薬剤であってもよい。

【 0 0 9 2 】

適切な場合には、他の追加の成分、例えば保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロピー物質、浸透剤、安定剤、封鎖剤、錯体形成剤が存在してもよい。概して、活性成分は、配合目的で一般的に使用される任意の固体または液体添加剤と組み合わせられ得る。

【 0 0 9 3 】

配合物は、一般に、0.05～99重量%、0.01～98重量%、好ましくは0.1～95重量%、より好ましくは0.5～90重量%、最も好ましくは10～70重量%の活性成分を含む。

【 0 0 9 4 】

上述の配合物は、望ましくない微生物を防除するために使用され得、式（I）の化合物を含む組成物は、微生物および／またはその生息環境に施用される。

【 0 0 9 5 】

本発明による式（I）の化合物および塩、N-オキシド、金属錯体、立体異性体または多形体は、そのまま、またはその配合物中に使用され得、例えば活性範囲を広げるために、または耐性の発達を予防するために、既知の混合相手と混合され得る。有用な混合相手は、例えば、既知の菌類駆除剤、殺虫剤、ダニ駆除剤、軟体動物駆除剤、パイオ農薬および殺菌剤を含む。除草剤等の他の既知の活性成分、または肥料および成長調節剤、毒性緩和剤および／もしくは情報化学物質との混合物もまた可能である。

【 0 0 9 6 】

そのような化学成分の例は、非限定的に本明細書に示される。それらのいくつかは、本明細書において、例えばThe Pesticide Manual 17th Ed.において知られ記載されている、またはインターネットで（例えばwww.alanwood.net/pesticidesで）検索され得るそれらの一般名で指定されている。その他は、IUPAC命名法に従うそれらの体系名により説明されている。

【 0 0 9 7 】

以下に記載のクラス（A）～（O）のすべての命名された混合相手は、その官能基が許容する場合には、任意選択で、適切な塩基もしくは酸との塩を形成し得る、各場合において具体的に言及されていなくても立体異性体として出現し得る、または多形体として出現し得る。それらもまた、本明細書に含まれることが理解される。これらの例は、以下の通りである。

【 0 0 9 8 】

A) エルゴステロール生合成の阻害剤、例えば（A01）アルジモルフ、（A02）アザコナゾール、（A03）ピテルタノール、（A04）プロムコナゾール、（A05）シプロコナゾール、（A06）ジクロブトラゾール、（A07）ジフェノコナゾール、（A08）ジニコナゾール、（A09）ジニコナゾール-M、（A10）ドデモルフ、（A11）ドデモルフアセテート、（A12）エポキシコナゾール、（A13）エタコナゾール、（A14）フェナリモール、（A15）フェンブコナゾール、（A16）フェンヘキサ

10

20

30

40

50

ミド、(A 17) フェンプロピジン、(A 18) フェンプロピモルフ、(A 19) フルキン
 コナゾール、(A 20) フルルプリミドール、(A 21) フルシラゾール、(A 22)
 フルトリアホール、(A 23) フルコナゾール、(A 24) フルコナゾール - c i s、(A 25)
 ヘキサコナゾール、(A 26) イマザリル、(A 27) イマザリルサルフェート、
 (A 28) イミベンコナゾール、(A 29) イブコナゾール、(A 30) メトコナゾー
 ル、(A 31) ミクロブタニル、(A 32) ナフチフィン、(A 33) ヌアリモール、(A 34)
 オクスボコナゾール、(A 35) パクロブトラゾール、(A 36) ペフラゾエー
 ト、(A 37) ペンコナゾール、(A 38) ピペラリン、(A 39) プロクロラズ、(A 40)
 プロピコナゾール、(A 41) プロチオコナゾール、(A 42) ピリブチカルブ、
 (A 43) ピリフェノックス、(A 44) キンコナゾール、(A 45) シメコナゾール、
 (A 46) スピロキサミン、(A 47) テブコナゾール、(A 48) テルピナフィン、(A 49)
 テトラコナゾール、(A 50) トリアジメフォン、(A 51) トリアジメノール、
 (A 52) トリデモルフ、(A 53) トリフルミゾール、(A 54) トリホリン、(A 55)
 トリチコナゾール、(A 56) ユニコナゾール、(A 57) ユニコナゾール - p、
 (A 58) ビニコナゾール、(A 59) ボリコナゾール、(A 60) 1 - (4 - クロロフェ
 ニル) - 2 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール、(A 61)
 メチル 1 - (2, 2 - ジメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル)
 - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキシレート、(A 62) N' - { 5 - (ジフルオロメ
 チル) - 2 - メチル - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェニル } - N - エ
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、(A 63) N - エチル - N - メチル - N' - { 2 -
 メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェ
 ニル } イミドホルムアミド、(A 64) O - [1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3,
 3 - ジメチルブタン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 1 - カルボチオエート、(A 65)
 ピリイソオキサゾール、(A 66) 2 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2,
 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H
 - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(A 67) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニ
 ル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1,
 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(A 68) 5 - (アリルスルファニ
 ル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキ
 シラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(A 69) 2 - [1 -
 (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4
 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(A 70)
 2 - { [r e l (2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフル
 オロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4
 - トリアゾール - 3 - チオン、(A 71) 2 - { [r e l (2 R, 3 R) - 3 - (2 - ク
 ロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル }
 - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(A 72) 1 - {
 [r e l (2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェ
 ニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチ
 オシアネート、(A 73) 1 - { [r e l (2 R, 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル)
 - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1, 2,
 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(A 74) 5 - (アリルスルファニル)
 - 1 - { [r e l (2 R, 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフル
 オロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(A 75)
 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R, 3 R) - 3 - (2 - ク
 ロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } -
 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(A 76) 2 - [(2 S, 4 S, 5 S) - 1 - (2,
 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル
] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(A 77) 2 -
 [(2 R, 4 S, 5 S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6

10

20

30

40

50

, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリア
 ザール - 3 - チオン、(A 7 8) 2 - [(2 R , 4 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロ
 フェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 -
 ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 3 - チオン、(A 7 9) 2 - [(2 S , 4
 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメ
 チルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 3 -
 チオン、(A 8 0) 2 - [(2 S , 4 S , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 -
 ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3
 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 3 - チオン、(A 8 1) 2 - [(2 R , 4 S , 5 R) - 1 -
 (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン
 - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 3 - チオン、(A
 8 2) 2 - [(2 R , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ
 シ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 ,
 4 - トリアザール - 3 - チオン、(A 8 3) 2 - [(2 S , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4
 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル]
 - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 3 - チオン、(A 8 4) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) プロパン 2 - オール、(A 8 5) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 8 6) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ペンタン - 2 - オール、(A 8 7) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 8 8) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) プロパン 2 - オール、(A 8 9) (2 R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 R) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 9 0) (2 R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 S) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 9 1) (2 S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 S) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 9 2) (2 S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1 R) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(A 9 3) (1 S , 2 R , 5 R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(A 9 4) (1 R , 2 S , 5 S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(A 9 5) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアザール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール。

10

20

30

40

【 0 0 9 9 】

B) 複合体 I または I I での呼吸鎖の阻害剤、例えば (B 0 1) ビキサフェン、(B 0
 2) ポスカリド、(B 0 3) カルボキシン、(B 0 4) シプロバミド、(B 0 5) ジフル
 メトリム、(B 0 6) フェンフラム、(B 0 7) フルオピラム、(B 0 8) フルトラニル
 、(B 0 9) フルキサピロキサド、(B 1 0) フラメトピル、(B 1 1) フルメシクロッ
 クス、(B 1 2) イソピラザム (s y n - エピマーラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 R S およ
 び a n t i - エピマーラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 S R の混合物)、(B 1 3) イソピラ
 ザム (a n t i - エピマーラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 S R)、(B 1 4) イソピラザム
 (a n t i - エピマー鏡像異性体 1 R , 4 S , 9 S)、(B 1 5) イソピラザム (a n t
 i - エピマー鏡像異性体 1 S , 4 R , 9 R)、(B 1 6) イソピラザム (s y n - エピマ

50

ーラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 R S)、(B 1 7) イソピラザム (s y n - エピマー鏡像異性体 1 R , 4 S , 9 R)、(B 1 8) イソピラザム (s y n - エピマー鏡像異性体 1 S , 4 R , 9 S)、(B 1 9) メプロニル、(B 2 0) オキシカルボキシ、(B 2 1) ペンフルフェン、(B 2 2) ペンチオピラド、(B 2 3) ピジフルメトフェン、(B 2 4) セダキサン、(B 2 5) チフルザミド、(B 2 6) 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 2 7) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 2 8) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロボキシ) フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 2 9) N - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 0) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(B 3 1) ベンゾピンジフルビル、(B 3 2) N - [(1 S , 4 R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 3) N - [(1 R , 4 S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 4) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 5) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 6) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 7) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 8) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 3 9) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 0) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 1) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 2) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 3) ベノダニル、(B 4 4) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、(B 4 5) イソフェタミド、(B 4 6) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [2 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 7) N - (4 ' - クロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 8) N - (2 ' , 4 ' - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 4 9) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 0) N - (2 ' , 5 ' - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 1) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イ

10

20

30

40

50

ン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 2) 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 3) 2 - クロロ - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(B 5 4) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 5) N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 6) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4 ' - エチニルピフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 7) N - (4 ' - エチニルピフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 5 8) 2 - クロロ - N - (4 ' - エチニルピフェニル - 2 - イル) ニコチンアミド、(B 5 9) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(B 6 0) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド、(B 6 1) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 2) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(B 6 3) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 4) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 5) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(B 6 6) 1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 7) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 8) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 6 9) 3 - (ジフルオロメチル) - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) プロパン - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 7 0) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 7 1) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 , R) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(B 7 2) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド。

【 0 1 0 0 】

C) 複合体 I I I での呼吸鎖の阻害剤、例えば (C 0 1) アメトクトラジン、(C 0 2) アミスルプロム、(C 0 3) アゾキシストロビン、(C 0 4) シアゾファミド、(C 0 5) クメトキシストロビン、(C 0 6) クモキシストロビン、(C 0 7) ジモキシストロビン、(C 0 8) エノキサストロビン、(C 0 9) ファモキサドン、(C 1 0) フェンアミドン、(C 1 1) フェンアミンストロビン、(C 1 2) フルフェノキシストロビン、(C 1 3) フルオキサストロビン、(C 1 4) クレソキシム - メチル、(C 1 5) メトミノストロビン、(C 1 6) マンデストロビン、(C 1 7) オリサストロビン、(C 1 8) ピコキシストロビン、(C 1 9) ピラクロストロビン、(C 2 0) ピラメトストロビン、(C 2 1) ピラオキシストロビン、(C 2 2) ピリベンカルブ、(C 2 3) トリクロピリカ

ルブ、(C 2 4)トリフロキシストロピン、(C 2 5)(2 E) - 2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ} フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(C 2 6)(2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - (2 - { [({ (1 E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン} アミノ) オキシ] メチル} フェニル) アセトアミド、(C 2 7)(2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - { 2 - [(E) - ({ 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エトキシ} イミノ) メチル] フェニル } アセトアミド、(C 2 8)(2 E) - 2 - { 2 - [({ [(1 E) - 1 - (3 - { [(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ} フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(C 2 9) フェナミノストロピン、(C 3 0) 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 - { [({ (1 E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン} アミノ) オキシ] メチル} フェニル) - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - オン、(C 3 1) メチル (2 E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } スルファニル) メチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、(C 3 2) N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、(C 3 3) 2 - { 2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(C 3 4) 2 - { 2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(C 3 5)(2 E, 3 Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 1 H - 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 - エナミド。

10

20

【0101】

D) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、例えば(D 0 1)ベノミル、(D 0 2)カルベンダジム、(D 0 3)クロルフェナゾール、(D 0 4)ジエトフェンカルブ、(D 0 5)エタボキサム、(D 0 6)フルオピコリド、(D 0 7)アルベンダゾール、(D 0 8)ペンシクロン、(D 0 9)チオベンダゾール、(D 1 0)チオファネート - メチル、(D 1 1)チオファネート、(D 1 2)ゾキサミド、(D 1 3)5 - クロロ - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、(D 1 4)3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン。

30

【0102】

E) 多点作用を有することができる化合物、例えば(E 0 1)ボルドー液、(E 0 2)キャプタホール、(E 0 3)キャプタン、(E 0 4)クロロタロニル、(E 0 5)水酸化銅、(E 0 6)ナフテン酸銅、(E 0 7)酸化銅、(E 0 8)オキシ塩化銅、(E 0 9)硫酸銅(2+)、(E 1 0)ジクロフルアニド、(E 1 1)ジチアノン、(E 1 2)ドジン、(E 1 3)ドジン遊離塩基、(E 1 4)フェルバム、(E 1 5)フルオロホルペット、(E 1 6)ホルペット、(E 1 7)グアザチン、(E 1 8)グアザチンアセテート、(E 1 9)イミノクタジン、(E 2 0)イミノクタジンアルベシレート、(E 2 1)イミノクタジントリアセテート、(E 2 2)マンカップー、(E 2 3)マンコゼブ、(E 2 4)マネブ、(E 2 5)メチラム、(E 2 6)メチラム亜鉛、(E 2 7)オキシシン - 銅、(E 2 8)プロパミジン、(E 2 9)プロピネブ、(E 3 0)硫黄および多硫化カルシウムを含む硫黄調製物、(E 3 1)チラム、(E 3 2)トリルフルアニド、(E 3 3)ゼニブ、(E 3 4)ジラム、(E 3 5)アニラジン。

40

【0103】

F) 宿主防衛を誘発することができる化合物、例えば(F 0 1)アシベンゾラル - S - メチル、(F 0 2)イソチアニル、(F 0 3)プロベナゾール、(F 0 4)チアジニル、(F 0 5)ラミナリン。

【0104】

G) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、例えば(G 0 1)アンドプリ

50

ム、(G 0 2) プラストサイジン - S、(G 0 3) シプロジニル、(G 0 4) カスガマイシン、(G 0 5) カスガマイシン塩酸塩水和物、(G 0 6) メパニピリム、(G 0 7) ピリメタニル、(G 0 8) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(G 0 9) オキシテトラサイクリン、(G 1 0) ストレプトマイシン。

【0105】

H) ATP 産生の阻害剤、例えば (H 0 1) フェンチンアセテート、(H 0 2) フェンチンクロリド、(H 0 3) フェンチンヒドロキシド、(H 0 4) シルチオファミン。

【0106】

I) 細胞壁合成の阻害剤、例えば (I 0 1) ベンチアバリカルブ、(I 0 2) ジメトモルフ、(I 0 3) フルモルフ、(I 0 4) イプロバリカルブ、(I 0 5) マンジプロパミド、(I 0 6) ポリオキシシン、(I 0 7) ポリオキソリム、(I 0 8) バリダマイシン A、(I 0 9) バリフェナレート、(I 1 0) ポリオキシシン B、(I 1 1) (2 E) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、(I 1 2) (2 Z) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン。

【0107】

J) 脂質および膜合成の阻害剤、例えば (J 0 1) ピフェニル、(J 0 2) クロロネブ、(J 0 3) ジクロラン、(J 0 4) エディフェンフォス、(J 0 5) エトリジアゾール、(J 0 6) ヨードカルブ、(J 0 7) イプロベンホス、(J 0 8) イソプロチオラン、(J 0 9) プロパモカルブ、(J 1 0) プロパモカルブ塩酸塩、(J 1 1) プロチオカルブ、(J 1 2) ピラゾフォス、(J 1 3) キントゼン、(J 1 4) テクナゼン、(J 1 5) トクロフォス - メチル。

【0108】

K) メラニン生合成の阻害剤、例えば (K 0 1) カルプロパミド、(K 0 2) ジクロシメット、(K 0 3) フェノキサニル、(K 0 4) フタリド、(K 0 5) ピロキロン、(K 0 6) トルプロカルブ、(K 0 7) トリシクラゾール。

【0109】

L) 核酸合成の阻害剤、例えば (L 0 1) ベナラキシル、(L 0 2) ベナラキシル - M (キララキシル)、(L 0 3) ブピリメート、(L 0 4) クロジラコン、(L 0 5) ジメチリモール、(L 0 6) エチリモール、(L 0 7) フララキシル、(L 0 8) ヒメキサゾール、(L 0 9) メタラキシル、(L 1 0) メタラキシル - M (メフェノキサム)、(L 1 1) オフレース、(L 1 2) オキサジキシル、(L 1 3) オキソリン酸、(L 1 4) オクチリノン。

【0110】

M) シグナル伝達の阻害剤、例えば (M 0 1) クロゾリネート、(M 0 2) フェンピクロニル、(M 0 3) フルジオキソニル、(M 0 4) イプロジオン、(M 0 5) プロシミドン、(M 0 6) キノキシフェン、(M 0 7) ピンクロゾリン、(M 0 8) プロキナジド。

【0111】

N) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば (N 0 1) ビナパクリル、(N 0 2) ジノカップ、(N 0 3) フェリムゾン、(N 0 4) フルアジナム、(N 0 5) メブチルジノカップ。

【0112】

O) さらなる化合物、例えば (O 0 1) ベンチアゾール、(O 0 2) ベトキサジン、(O 0 3) カブシマイシン、(O 0 4) カルボン、(O 0 5) キノメチオナート、(O 0 6) ピリオフェノン (クラザフェノン)、(O 0 7) クフラネブ、(O 0 8) シフルフェナミド、(O 0 9) シモキサニル、(O 1 0) シプロスルファミド、(O 1 1) ダゾメット、(O 1 2) デバカルブ、(O 1 3) ジクロロフェン、(O 1 4) ジクロベンチアゾクス、(O 1 5) ジクロメジン、(O 1 6) ジフェンゾコート、(O 1 7) ジフェンゾコート

10

20

30

40

50

メチルサルフェート、(O18)ジフェニルアミン、(O19)エコメート、(O20)フェンピラザミン、(O21)フェンヘキサミン、(O22)フルメトベル、(O23)フルオロイミド、(O24)フルスルファミド、(O25)フルチアニル、(O26)フォセチル-アルミニウム、(O27)フォセチル-カルシウム、(O28)フォセチル-ナトリウム、(O29)ヘキサクロロベンゼン、(O30)イルママイシン、(O31)イソチアニル、(O32)メタスルホカルブ、(O33)メチルイソチオシアネート、(O34)メトラフェノン、(O35)ミルドマイシン、(O36)ナタマイシン、(O37)ニッケルジメチルジチオカルバメート、(O38)ニトロタール-イソプロピル、(O39)オキサモカルブ、(O40)オキシフェンチン、(O41)ペンタクロロフェノールおよび塩、(O42)フェノトリン、(O43)ピカルブトラゾクス(O44)リン酸およびその塩、(O45)プロパモカルブ-フォセチレート、(O46)プロパノシン-ナトリウム、(O47)ピリモルフ、(O48)ピラジフルミド、(O49)ピロールニトリン、(O50)テブフロキン、(O51)テクロフタラム、(O52)トルニファニド、(O53)トリアゾキシド、(O54)トリクラミド、(O55)ザリラミド、(O56)(3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル)アミノ]-6-メチル-4, 9-ジオキソ-1, 5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロピオネート、(O57)1-(4-{4-[(5R)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(O58)1-(4-{4-[(5S)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(O59)オキサチアピプロリン、(O60)1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(O61)2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(O62)2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ[2, 3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(O63)2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4]ジチイノ[2, 3-c: 5, 6-c']ジピロール-1, 3, 5, 7(2H, 6H)-テトロン、(O64)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5R)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(O65)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5S)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(O66)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-{4-[4-(5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル)-1, 3-チアゾール-2-イル]ピペリジン-1-イル}エタノン、(O67)2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(O68)2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル]ピリジン、(O69)2-フェニルフェノールおよび塩、(O70)3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(O71)3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボニトリル、(O72)3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(O73)4-(4-クロロフェニル)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3, 6-ジメチルピリダジン、(O74)3-クロロ-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、(O75)5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(O76)5-クロロ-N'-フェニル-N'-(プロパ-2-イン-1-イル)チオフェン-2-スルホノヒドラジド、(O77)5-フルオロ-2-[(

10

20

30

40

50

4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(O 7 8) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(O 7 9) 5 - メチル - 6 - オクチル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、(O 8 0) エチル (2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリレート、(O 8 1) N ' - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル] オキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 8 2) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(O 8 3) N - [(4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(O 8 4) N - [(5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、(O 8 5) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、(O 8 6) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードニコチンアミド、(O 8 7) N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、(O 8 8) N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、(O 8 9) N ' - { 4 - [(3 - tert - ブチル - 4 - シアノ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イル) オキシ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 9 0) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(O 9 1) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 R) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(O 9 2) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(O 9 3) ベンチル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - 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] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、(O 9 4) フェナジン - 1 - カルボン酸、(O 9 5) キノリン - 8 - オール、(O 9 6) キノリン - 8 - オールサルフェート (2 : 1)、(O 9 7) tert - ブチル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - 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] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、(O 9 8) (5 - ブロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル) (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン、(O 9 9) N - [2 - (4 - { [3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } - 3 - メトキシフェニル) チル] - N 2 - (メチルスルホニル) パリンアミド、(O 1 0 0) 4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(O 1 0 1) ブタ - 3 - イン - 1 - イル { 6 - [({ [(Z) - (1 - メチル - 1 H - 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] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、(O 1 0 2) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性型 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1 H) - オン)、(O 1 0 3) プロピル 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシベンゾエート、(O 1 0 4) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(O 1 0 5) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(O 1 0 6) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(O 1 0 7) 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N

10

20

30

40

50

- (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ベンズアミド、(O 1 0 8) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、(O 1 0 9) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、(O 1 1 0) 3 - (4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(O 1 1 1) アブシジン酸 (O 1 1 2) N ' - [5 - ブロモ - 6 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルオキシ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 3) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 4) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [(1 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 5) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [(1 S) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 6) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [(c i s - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 7) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [(t r a n s - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 1 8) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 1 9) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 0) N - (2 - t e r t - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 1) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 2) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 3) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 4) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 5) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 6) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 7) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 8) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 2 9) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 0) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 1) N - (2 - t e r t - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 2) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 3) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル

10

20

30

40

50

) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 4) N - [2 - クロロ
 - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル)
 - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 5) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シク
 ロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 6) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) -
 N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピ
 ラゾール - 4 - カルボキサミド、(O 1 3 7) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメ
 チル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾ
 ール - 4 - カルボチオアミド、(O 1 3 8) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 3 9) N ' - { 4 - [(4
 , 5 - ジクロロ - 1 , 3 - 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 - メチルイミドホルムアミド、(O 1 4 0) N - (4 - クロロ - 2 ,
 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメ
 チル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 4 1) 9 - フルオロ - 2 , 2 - ジメチル -
 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサゼピン、(O 1
 4 2) 2 - { 2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オ
 キシ] フェニル} プロパン - 2 - オール、(O 1 4 3) 2 - { 2 - [(7 , 8 - ジフルオ
 ロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル} プロパン - 2 -
 オール、(O 1 4 4) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロ
 フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 4 5) 4 - (2
 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジ
 メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 4 6) 4 - (2 - クロロ - 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 - 1 H - ピ
 ラゾール - 5 - アミン、(O 1 4 7) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - ア
 ミン、(O 1 4 8) N - (2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4
 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 4 9
) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - ブロモフェニル) - 1 , 3 -
 ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 5 0) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオ
 ロフェニル) - N - (2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H -
 ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 5 1) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N
 - (2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1
 5 2) N - (2 - ブロモフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 ,
 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 5 3) 4 - (2 - クロロ - 4 - フ
 ルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール
 - 5 - アミン、(O 1 5 4) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6
 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 5
 5) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1 ,
 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(O 1 5 6) N ' - (4 - { 3 - [(ジフ
 ルオロメチル) スルファニル] フェノキシ} - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル
 - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 5 7) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ} フェニル) - N
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 5 8) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 -
 { 3 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ} フェニル) -
 N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 5 9) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4
 - { 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロピル) スルファニル] フェノキシ} フ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 6 0) N ' - (2 , 5 - ジ
 メチル - 4 - { 3 - [(ペンタフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ} フェニル)
 - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(O 1 6 1) N ' - (4 - { [3 - (ジフ

ルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル
 -N-メチルイミドホルムアミド、(O162)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-
 (1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N
 -エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(O163)N'-(2,5-ジメチル-4-
 {[3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-
 N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(O164)N'-(2,5-ジメチル-4
 -{[3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フ
 ェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、
 (O165)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(ペンタフルオロエトキシ)フェニ
 ル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホミアミド、(O166
)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4
 -(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒ
 ドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン
 -1-イル]エタノン、(O167)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-
 ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-
 イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イ
 ル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(O168)
 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-
 (4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4
 ,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)
 ピペリジン-1-イル]エタノン、(O169)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス
 (ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イ
 ル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5
 -イル}フェニルメタンスルホネート、(O170)2-{3-[2-(1-{[3,5
 -ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4
 -イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール
 -5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(O171)2-[3,5-ビス
 (ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5S)
 -5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1
 ,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イ
 ル]エタノン、(O172)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾー
 ル-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イ
 ルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3
 -チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(O173)2-[3,5
 -ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5
 S)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4
 ,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)
 ピペリジン-1-イル]エタノン、(O174)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル
)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-フルオロ
 -6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-
 オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エ
 タノン、(O175)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1
 -イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-
 1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-
 1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(O176)2-[
 3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-
 {(5R)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]
 -4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イ
 ル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(O177)2-{(5S)-3-[2-(1-
 {[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペ

10

20

30

40

50

リジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル} フェニルメタンスルホネート、(O178) 2 - {(5R) - 3 - [2 - (1 - {[3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル} フェニルメタンスルホネート、(O179) 2 - {(5S) - 3 - [2 - (1 - {[3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、(O180) 2 - {(5R) - 3 - [2 - (1 - {[3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニルメタンスルホネート、(O181) (3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - {3 - [(イソブチリルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシピコリンアミド} - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イルイソブチレート。
【0113】

10

上記の通り、式(I)の化合物は、殺虫剤/ダニ駆除剤/線虫駆除剤のクラスから選択される1種または複数の適合性活性化合物と混合することができ、これらの適合性活性化合物は、例えば、The Pesticide Manual 第17版において公知であり、記載されているか、またはインターネット(例えば、www.alanwood.net/pesticides)で検索することができる、その一般名によって本明細書に指定されている。

20

【0114】

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

30

40

【0115】

(2) GABA 開閉型塩素チャネルアンタゴニスト、例えば、シクロジエン有機クロリン系、例えば、クロルダンおよびエンドスルファンまたはフェニルピラゾール(フィプロール)、例えば、エチプロールおよびフィプロニル。

【0116】

(3) ナトリウムチャネルモジュレータ/電位依存性ナトリウムチャネル遮断剤、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレトリン、d - cis - trans アレトリン、d - trans アレトリン、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリ

50

ンS - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン [(1 R) - t r a n s - 異性体] 、デルタメトリン、エンベントリン [(E Z) - (1 R) - 異性体] 、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1 R) - t r a n s - 異性体)] 、プラレスリン、ピレトリン類 (ピレトルム) 、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1 R) - 異性体)] 、トラロメトリンおよびトランスフルトリンまたはD D Tまたはメトキシシクロロ。

10

【 0 1 1 7 】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) 競合的モジュレータ、例えば、ネオネコチノイド系、例えば、アセトアミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリドおよびチアメトキサムまたはニコチンまたはスルホキサフルルまたはフルピラジフロン。

【 0 1 1 8 】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) アロステリックモジュレータ、例えばスピノシン系、例えば、スピネトラムおよびスピノサド。

【 0 1 1 9 】

20

(6) グルタミン酸開閉型塩素チャネル (G l u C l) アロステリックモジュレータ、例えばアベルメクチン系 / ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチンおよびミルベメクチン。

【 0 1 2 0 】

(7) 幼若ホルモン様作用物質、例えば幼若ホルモン類縁体、例えば、ヒドロブレン、キノブレンおよびメトブレンまたはフェノキシカルブまたはピリプロキシフェン。

【 0 1 2 1 】

(8) 未知または非特異的な作用機序を有する活性化合物、例えばハロゲン化アルキル (例えば、臭化メチルおよび他のハロゲン化アルキルなど) 、またはクロロピクリンまたはフッ化物またはホウ酸塩または吐酒石またはメチルイソシアネート発生剤。

30

【 0 1 2 2 】

(9) 脊索器官T R P Vチャネルモジュレータ、例えばピリジンアゾメチン誘導体、例えば、ピメトロジンおよびピリフルキナゾンまたはフロニカミド。

【 0 1 2 3 】

(1 0) ダニ成長阻害剤、例えばクロフェンテジン、ヘキシチアゾクスおよびジフロビダジンまたはエトキサゾール。

【 0 1 2 4 】

(1 1) 昆虫腸中腸の微生物攪乱剤、例えば、バシルス・ツリングエンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*) 、バシルス・ツリングエンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*) 、バシルス・ツリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*) 、バシルス・ツリングエンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*) およびバシルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*) 、ならびにB T作物タンパク質 : C r y 1 A b 、 C r y 1 A c 、 C r y 1 F a 、 C r y 1 A 1 0 5 、 C r y 2 A b 、 V i p 3 a 、 m C r y 3 A 、 C r y 3 A b 、 C r y 3 B b 、 C r y 3 4 A b 1 / C r y 3 5 A b 1 。

40

【 0 1 2 5 】

(1 2) ミトコンドリアA T Pシンターゼの阻害剤、例えば有機スズダニ駆除剤、例え

50

ばアゾシクロチン、シヘキサチンおよびフェンブタチンオキシドまたはジアフェンチウロンまたはプロパルギットまたはテトラジホン。

【 0 1 2 6 】

(1 3) プロトン勾配の破壊を介して作用する酸化的リン酸化の脱共役剤、例えばクロルフェナピル、D N O C およびスルフルアミド。

【 0 1 2 7 】

(1 4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) チャネル遮断剤、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラムおよびチオスルタップ - ナトリウム。

【 0 1 2 8 】

(1 5) キチン生合成の阻害剤 (タイプ 0) 、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノキシウロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロン。

10

【 0 1 2 9 】

(1 6) キチン生合成の阻害剤 (タイプ 1) 、例えば、ブプロフェジン。

【 0 1 3 0 】

(1 7) 脱皮攪乱物質 (特に、双翅目 (D i p t e r a n) において) 、例えばシロマジン。

【 0 1 3 1 】

(1 8) エクジソン受容体アゴニスト、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジド。

20

【 0 1 3 2 】

(1 9) オクトパミン受容体アゴニスト、例えばアミトラズ。

【 0 1 3 3 】

(2 0) ミトコンドリア複合体 I I I 電子伝達阻害剤、例えば、ヒドラメチルノンまたはアセキノシルまたはフルアクリピリムまたはピフェナゼート。

【 0 1 3 4 】

(2 1) ミトコンドリア複合体 I 電子伝達阻害剤、例えば、M E T I ダニ駆除剤および殺虫剤、例えばフェナザクイン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラドおよびトルフェンピラドまたはロテノン (デリス) 。

30

【 0 1 3 5 】

(2 2) 電位依存性ナトリウムチャネル遮断剤、例えば、インドキサカルブまたはメタフルミゾン。

【 0 1 3 6 】

(2 3) アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸およびテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェンおよびスピロテトラマト。

【 0 1 3 7 】

(2 4) ミトコンドリア複合体 I V 電子伝達阻害剤、例えばリン化物、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、リン化亜鉛およびホスフィンまたはシアン化物。

【 0 1 3 8 】

(2 5) ミトコンドリア複合体 I I 電子伝達阻害剤、例えばベータ - ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェンおよびシフルメトフェンまたはカルボキシアニリド。

40

【 0 1 3 9 】

(2 8) リアノジン受容体モジュレータ、例えばジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミド。

【 0 1 4 0 】

(2 9) 未定義の標的部位に対する弦音器官調節剤、例えばフロニカミド。

【 0 1 4 1 】

未知のまたは未確定の作用様式を有するさらなる活性成分、例えば、アフィドピロペン、アホキソラネル、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンズオキシメート、ピフェナゼ

50

ート、プロフラニリド、プロモプロピレート、キノメチオネート、氷晶石、シクラニリブ
 ロール、シクロキサプリド、シハロジアミド、ジクロロメゾチアズ、ジコホル、ジフロビ
 ダジン、フロメトキン、フルアザインドリジン、フルエンズルホン、フルフェネリム、フ
 ルフェノキシストロピン、フルフィプロール、フルヘキサホン、フルオピラム、フルララ
 ネル、フルキサメタミド、フフェノジド、グアジビル、ヘプタフルトリン、イミダクロチ
 ズ、イプロジオン、ロチラネル、メペルフルトリン、パイコングジグ、ピフルブミド、
 ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、サロラネル、テトラメチルフルト
 リン、テトラニピプロール、テトラクロラントラニリプロール、チオキサザフェン、トリ
 フルメゾピリムおよびヨードメタン；さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus
 firmus) に基づく調製物 (I - 1582、BioNeem、Votivo)、および以下の既知活性化化合物：1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリ
 フルオロエチル) スルフィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 ,
 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン (WO 2 0 0 6 0 4 3 6 3 5 から公知) 、 { 1 ' - 4 [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロス
 ピロ [インドール - 3 , 4 ' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル } (2 - クロロピリジン -
 4 - イル) メタノン (WO 2 0 0 3 1 0 6 4 5 7 から公知) 、 2 - クロロ - N - [2 - { 1 - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] ピペリジン
 - 4 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2 0 0
 6 0 0 3 4 9 4 から公知) 、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 -
 メトキシ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO 2 0 0 9 0
 4 9 8 5 1 から公知) 、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ
 - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 4 - イルエチルカーボネート (WO
 2 0 0 9 0 4 9 8 5 1 から公知) 、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3
 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (WO 2 0 0 4 0 9 9
 1 6 0 から公知) 、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 - クロロフェニ
 ル) ピリミジン (WO 2 0 0 3 0 7 6 4 1 5 から公知) 、 P F 1 3 6 4 (C A S 登録番号
 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0 - 2) 、 メチル - 2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ
 ピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - クロ
 ロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボキシレート (WO 2 0 0 5 0
 8 5 2 1 6 から公知) 、 メチル - 2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジ
 ン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3
 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボキシレート (WO 2 0 0 5 0 8 5 2
 1 6 から公知) 、 メチル - 2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - ピリジン -
 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メ
 チルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボキシレート (WO 2 0 0 5 0 8 5 2 1 6
 から公知) 、 メチル - 2 - [3 , 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロ
 ロ - ピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾ
 イル] - 2 - エチルヒドラジンカルボキシレート (WO 2 0 0 5 0 8 5 2 1 6 から公知)
 、 N - [2 - (5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6
 - メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラ
 ザール - 5 - カルボキサミド (C N 1 0 2 0 5 7 9 2 5 から公知) 、 4 - [5 - (3 , 5
 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキ
 サゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル) ベンズア
 ミド (WO 2 0 0 9 0 8 0 2 5 0 から公知) 、 N - [(2 E) - 1 - [(6 - クロロピリ
 ジン - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1 H) - イリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオ
 ロアセトアミド (WO 2 0 1 2 0 2 9 6 7 2 から公知) 、 1 - [(2 - クロロ - 1 , 3 -
 チアゾール - 5 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1 , 2 -
 a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレエート (WO 2 0 0 9 0 9 9 9 2 9 から公知) 、
 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H -
 ピリド [1 , 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレエート (WO 2 0 0 9 0 9 9 9

10

20

30

40

50

29 から公知)、4 - (3 - {2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] フェノキシ} プロポキシ) - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリミジン (CN 101337940 から公知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2008134969 から公知)、ブチル - [2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 3 - オキソ - 4 - オキサスピロ [4.5] デカ - 1 - エン - 1 - イル] カーボネート (CN 102060818 に開示されている)、3 (E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO 2013144213 から公知)、N - (メチルスルホニル) - 6 - [2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2012000896 から公知)、N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010051926 から公知)。

【0142】

式 (I) の化合物は、いくつかの菌類病原体を処理するために使用されてもよい。本発明により処理することができる菌類病害の病原体の非限定例には、以下が含まれる：

以下のうどんこ病病原体により引き起こされる病害、例えば、ブルメリア属の種、例えば、ブルメリア・グラミス (*Blumeria graminis*)；ポドスファエラ属の種、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (*Podosphaera leucotricha*)；スファエロテカ属の種、例えば、スファエロテカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*)；ウンシヌラ属の種、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*)；エリシフェ属の種、例えばエリシフェ・シコラセアウ (*Erysiphe cichoraceau*)；

以下のさび病病原体によって引き起こされる病害、例えば、ギムノスポランギウム属の種、例えば、ギムノスポランギウム・サピナエ (*Gymnosporangium sabinae*)；ヘミレイア属の種、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)；ファコブソラ属の種、例えば、ファコブソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) またはファコブソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiaae*)；プッシニア属の種、例えば、プッシニア・レコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッシニア・グラミニス (*Puccinia graminis*) またはプッシニア・ストリイホルミス (*Puccinia striiformis*)；ウロミセス属の種、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス (*Uromyces appendiculatus*)；

以下の卵菌類の群に由来する病原体によって引き起こされる病害、例えば、アルブゴ属の種、例えばアルブゴ・カンジダ (*Albugo candida*)；ブレミア属の種、例えば、ブレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*)；ペロノスポラ属の種、例えば、ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) またはペロノスポラ・ブラシカエ (*P. brassicae*)；フィトフトラ属の種、例えば、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)；プラスモパラ属の種、例えば、プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*)；プセウドノスポラ属の種、例えば、プセウドノスポ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) またはプセウドノスポ・クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)；ピシウム属の種、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*)；

以下によって引き起こされる葉枯病および萎凋病、例えば、アルテルナリア属の種、例えば、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*)；セルコスポラ属の種、例えば、セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*)；クラジオスポルム属の種、例えば、クラジオスポリウム・ククメリナム (*Cladospodium cucumerinum*)；コクリオボルス属の種、例えば、コクリオ

10

20

30

40

50

ボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: ドレクスレラ属、異名: ヘルミントスポリウム属); またはコクリオボルス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*); コレトトリクム属の種、例えば、コレトトリクム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*); シクロコニウム属の種、例えば、シクロコニウム・オレアギナム (*Cycloconium oleaginum*); ジアポルテ属の種、例えば、ジアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*); エルシノエ属の種、例えば、エルシノエ・ファウセッチイ (*Elsinoe fawcettii*); グロエオスポリウム属の種、例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロール (*Gloeosporium laeticolor*); グロメラ属の種、例えば、グロメラ・シングラタ (*Glomerella cingulata*); ギイグナルジア属の種、例えば、ギイグナルジア・ビドウェリ (*Guignardia bidwelli*); レプトスファエリア属の種、例えば、レプトスファエリア・マクランズ (*Leptosphaeria maculans*); マグナポルテ属の種、例えば、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*); ミクロドキウム属の種、例えばミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*); ミコスファエレラ属の種、例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*), ミコスファエレラ・アラキジコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) またはミコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*); ファエオスファエリア属の種、例えば、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*); ピレノホラ属の種、例えば、ピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) またはピレノホラ・トリチシレペンティス (*Pyrenophora tritici repentis*); ラムラリア属の種、例えば、ラムラリア・コロ・シグニ (*Ramularia collo-cygni*) またはラムラリア・アレオラ (*Ramularia areola*); リンコスボリウム属の種、例えば、リンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*); セプトリア属の種、例えば、セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) またはセプトリア・リコペルシシ (*Septoria lycopersici*); スタゴノスポラ属の種、例えばスタゴノスポラ・ノドルム (*Stagonospora nodorum*); チフラ属の種、例えば、チフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*); ベンツリア属の種、例えば、ベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*);

10

20

30

以下によって引き起こされる根および茎の病害、例えば、コルチシウム属の種、例えばコルチシウム・グラミネアルム (*Corticium graminearum*); フサリウム属の種、例えば、フサリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*); ガエウマンノミセス属の種、例えば、ガエウマンノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*); プラスモジオホラ属の種、例えばプラスモジオホラ・ブラシカエ (*Plasmodiophora brassicae*); リゾクトニア属の種、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*); サロクラジウム属の種、例えばサロクラジウム・オリザエ (*Sarocladium oryzae*); スクレロチウム属の種、例えばスクレロチウム・オリザエ (*Sarocladium oryzae*); タペシア属の種、例えば、タペシア・アクホルミス (*Tapesia acuformis*); チエラビオプシス属の種、例えば、チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*); ガノデルマ属の種、例えばガノデルマ・ルシドウム (*Ganoderma lucidum*);

40

以下によって引き起こされる穂の病害 (トウモロコシの穂軸を含む)、例えば、アルテルナリア属の種、例えば、アルテルナリア属種; アスペルギルス属の種、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*); クラドスポリウム属の種、例えば、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*); クラビセプス属の種、例えば、クラビセプス・プルプ

50

レア (*Claviceps purpurea*) ; フサリウム属の種、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) ; ジベレラ属の種、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) ; モノグラフェラ属の種、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) ; スタグノスポラ属の種、例えばスタグノスポラ・ノドルム (*Stagnospora nodorum*) ;

以下の黒穂病菌類により引き起こされる病害、例えば、スファセロテカ属の種、例えば、スファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) ; チルレチア属の種、例えば、チルレチア・カリエス (*Tilletia caries*) またはチルレチア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*) ; ウロシスチス属の種、例えば、ウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*) ; ウスチラゴ属の種、例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) ;

以下によって引き起こされる果実の腐敗、例えば、アスペルギルス属の種、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) ; ボトリティス属の種、例えば、ボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) ; ペニシリウム属の種、例えば、ペニシリウム・エクспанスム (*Penicillium expansum*) またはペニシリウム・ブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) ; リゾプス属の種、例えばリゾプス・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*) ; スクレロチニア属の種、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) ; ベルチシリウム属の種、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) ;

以下によって引き起こされる、種子および土壌によって媒介される腐敗病および萎凋病さらにまた実生の病害、例えば、アルテルナリア属の種、例えば、アルテルナリア・ブラシシコラ (*Alternaria brassicicola*) ; アファノマイセス属の種、例えばアファノマイセス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*) ; アスコキタ属の種、例えば、アスコキタ・レンティス (*Ascochyta lentis*) ; アスペルギルス属の種、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) ; クラドスポリウム属の種、例えば、クラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*) ; コクリオボルス属の種、例えば、コクリオボルス・サチプス (分生子形態: ドレクスレラ属、ビポラリス (*Bipolaris*) 異名: ヘルミントスポリウム属) ; コレトトリクム属の種、例えば、コレトトリクム・ココデス (*Colletotrichum coccodes*) ; フサリウム属の種、例えば、フサリウム・クルモルム ; ジベレラ属の種、例えば、ジベレラ・ゼアエ ; マクロホミナ属の種、例えば、マクロホミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) ; ミクロドキウム属の種、例えばミクロドキウム・ニバレ ; モノグラフェラ属の種、例えば、モノグラフェラ・ニバリス ; ペニシリウム属の種、例えば、ペニシリウム・エクспанスム ; ポマ属の種、例えばポマ・リンガム (*Phoma lingam*) ; ホマプシス属の種、例えば、ホマプシス・ソヤエ (*Phomopsis sojae*) ; フィトフトラ属の種、例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) ; プレオスポラ属の種、例えば、プレオスポラ・グラミネア (*Pyrenophora graminea*) ; ピリクラリア属の種、例えば、ピリクラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) ; ピシウム属の種、例えば、ピシウム・ウルチムム ; リゾクトニア属の種、例えば、リゾクトニア・ソラニ ; リゾプス属の種、例えばリゾプス・オリザエ (*Rhizopus oryzae*) ; スクレロチウム属の種、例えばスクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) ; セプトリア属の種、例えば、セプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*) ; チフラ属の種、例えば、チフラ・インカルナタ ; パーティシリウム属の種、例えば、パーティシリウム・ダリアエ (*Verticillium dahliae*) ;

10

20

30

40

50

以下によって引き起こされる、がん腫病、こぶおよび天狗巣病、例えば、ネクトリア属の種、例えば、ネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) ;

以下によって引き起こされる萎凋病、例えば、モニリニア属の種、例えば、モニリニア・ラキサ (*Monilinia laxa*) ;

以下によって引き起こされる葉、花および果実の奇形、例えば、エキソバシディウム属の種、例えば、エキソバシディウム・ベキサンス (*Exobasidium vexans*) ; タフリナ属の種、例えば、タフリナ・デホルマンズ (*Taphrina deformans*) ;

以下によって引き起こされる木本植物の衰退性病害、例えば、エスカ属の種、例えば、ファエモニエラ・クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*)、ファエオアクレモニウム・アレオフィルム (*Phaeoacremonium aleophilum*) またはフォミチポリア・メジテルラネア (*Fomitiporia mediterranea*) ; ガノデルマ属の種、例えばガノデルマ・ボニネンセ (*Ganoderma boninense*) ;

以下によって引き起こされる花および種子の病害、例えば、ボトリティス属の種、例えば、ボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) ;

以下によって引き起こされる植物塊茎の病害、例えば、リゾクトニア属の種、例えば、リゾクトニア・ソラニ ; ヘルミントスポリウム属の種、例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) ;

以下の細菌性病原体によって引き起こされる病害、例えば、キサントモナス属の種、例えば、キサントモナス・カムペストリス pv. オリザエ (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*) ; シュードモナス属の種、例えば、シュードモナス・シリングアエ pv. ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*) ; エルウイニア属の種、例えば、エルウイニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) ; ラルストニア属の種、例えばラルストニア・ソラナセアルム (*Ralstonia solanacearum*) ;

以下によって引き起こされる根および茎基部の菌類病害、例えば、黒色根腐病 (カロネクトリア・クロタラリアエ (*Calonectria crotonariae*))、炭疽病 (マクロフォミナ・ファゼオリナ (*Macrophoma phaseolina*))、赤かび病またはフサリウム萎凋、根腐ならびに鞘および地際部腐病 (フサリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*))、フサリウム・オルトセラス (*Fusarium orthoceras*)、フサリウム・セミテクタム (*Fusarium semitectum*)、フサリウム・エクイセチ (*Fusarium equiseti*)、ミコレプトディスカス根腐病 (ミコレプトディスカス・テレストリス (*Mycleptodiscus terrestris*))、ネオコスモスポラ (ネオコスモスポラ・バシンフェクタ (*Neocosmospora vasinfecta*))、鞘および茎枯病 (ジアボルテ・ファセオロラム (*Diaporthe phaseolorum*))、茎潰瘍 (ジアボルテ・ファセオロラム変種カウリボラ (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*))、フィトフトラ腐敗病 (フィトフトラ・メガスperlマ (*Phytophthora megasperma*))、落葉病 (フィアロホラ・グレガタ (*Phialophora gregata*))、フィチウム腐敗病 (フィチウム・アフアニデルマタム (*Pythium aphanidermatum*))、フィチウム・イレグラレ (*Pythium irregulare*)、フィチウム・デバリアヌム (*Pythium debaryanum*)、フィチウム・ミリオチルム (*Pythium myriotylum*)、フィチウム・ウルチマム (*Pythium ultimum*))、リゾクトニア根腐病、茎腐病および立枯病 (リゾクトニア・ソラニ)、スクレロチニア茎腐病 (スクレロチニア・スクレロチオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*))、スクレロチニア白絹病 (スクレロチニア・ロルフシ (*Sclerotinia rolfii*))、チエラビオブシス根腐病 (チエラビオブシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*))。

10

20

30

40

50

【0143】

本発明により処理することができる植物には、以下：バラ科植物（例えば、リンゴ、西洋ナシ、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモなどの仁果）、リベシオイダエ科植物、クルミ科植物、カバノキ科植物、ウルシ科植物、ブナ科植物、クワ科植物、モクセイ科植物、マタタビ科植物、クスノキ科植物、バショウ科植物（例えば、バナナの木およびプランテーション植物）、アカネ科植物（例えば、コーヒー）、ツバキ科植物、アオギリ科植物、ミカン科植物（例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ）；ブドウ科植物（例えば、ブドウ）；ナス科植物（例えば、トマト、ペッパー）、ユリ科植物、キク科植物（例えば、レタス）、セリ科植物、アブラナ科植物、アカザ科植物、ウリ科植物（例えば、キュウリ）、ネギ科植物（例えば、リーキ、タマネギ）、マメ科植物（例えば、エンドウマメ）；イネ科（*Poaceae* sp.）/イネ科（*Gramineae* sp.）などの主要作物植物（例えば、メイズ、シバ、穀物（コムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、オートムギ、ミレットおよびライコムギなど））、キク科植物（例えば、ヒマワリ）、アブラナ科植物（例えば、シロキャベツ、レッドキャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、チンゲンサイ、コールラビ、ラディッシュ、およびナタネ、カラシ、ホースラディッシュおよびクレス）、マメ科植物（*Fabaceae* sp.）（例えば、マメ、ピーナッツ）、マメ科植物（*Papilionaceae* sp.）（例えば、ダイズ）、ナス科植物（例えば、ジャガイモ）、アカザ科植物（例えば、サトウダイコン、飼料ビート、フダンソウ、ビート根）；アオイ科植物（例えば、ワタ）；庭および雑木林向けの有用植物ならびに観賞植物；ならびにこれらの植物の各々の遺伝改変品種が含まれる。

10

20

【0144】

すべての植物および植物部分は、本発明により処理することができる。植物は、ここでは、望ましいおよび望ましくない野性植物または作物植物（天然の作物植物を含む）などの、すべての植物および植物集団を意味することが理解される。作物植物は、トランスジェニック植物を含む、ならびに植物育種家の権利によって保護可能なおよび保護不可能な植物栽培品種を含む、慣用的な育種および最適化法によって、または生物工学的な方法および遺伝子操作方法もしくはこれらの方法の組合せによって得ることができる植物とすることができる。植物部分は、新芽、葉、花および根などの地上および地中の植物のすべての部分ならびに器官を意味することが理解され、それらの例には、葉、針、柄、茎、葉、果実本体、果実および種子、さらにまた根、塊根および根茎が含まれる。植物部分はまた、収穫された材料、ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば挿し木、塊茎、根茎、接ぎ穂および種子を含む。

30

【0145】

本発明は、種子、特に、式（I）の化合物の少なくとも1つおよびその組成物により処理された種子（休眠中、下塗り後、発芽前、または根および葉が出現している場合でさえも）を処理する方法をさらに含む。本発明の種子は、種子および種子から発芽した植物を植物病原性有害菌類から保護する方法に使用される。これらの方法では、少なくとも1つの本発明の活性成分により処理された種子が使用される。

【0146】

種子、発芽している植物および出芽した実生を、使用される活性成分によって植物自体が損傷を受けないが、植物病原菌による攻撃から可能な最良の保護を実現するよう、使用される活性成分の量を最適化することがやはり望ましい。特に、種子の処理方法は、作物保護組成物の使用を最小限にして、種子および発芽している植物の最適保護を実現するため、トランスジェニック植物の固有の表現型をやはり考慮すべきである。

40

【0147】

したがって、本発明はまた、本発明の組成物により種子を処理することによって、種子、発芽している植物および出芽した実生を動物有害生物および/または植物病原性有害微生物による攻撃から保護する方法に関する。本発明はまた、種子、発芽している植物および出芽した実生を、動物有害生物および/または植物病原性微生物から保護するために種

50

子を処理するための本発明による組成物の使用に関する。本発明は、動物有害生物および/または植物病原性微生物から保護するため、本発明の組成物により処理された種子にさらに関する。

【0148】

本発明の利点の1つは、これらの組成物による種子の処理は、動物有害生物および/または植物病原性有害微生物から、種子自体だけではなく、出芽後に得られた植物も保護することである。このようにして、播種時またはその直後における作物の即時処理および播種前の種子処理によって植物が保護される。本発明の活性成分または組成物は、とりわけ、トランスジェニック種子にも使用することができ、この場合、この種子から成長した植物は、有害生物、除草剤による損傷または非生物学的ストレスに対して作用するタンパク質を発現することができるという、利点も同様に考えられる。本発明の活性成分または組成物、例えば殺虫性タンパク質によるこのような種子の処理は、ある種の有害生物の防除をもたらすことができる。驚くべきことに、さらなる相乗効果をこの場合に観察することができ、これにより、有害生物、微生物、雑草または非生物学的ストレスによる攻撃からの保護の有効性がさらに増大される。

10

【0149】

式(I)の化合物は、農業、温室、森林または園芸において使用される、任意の植物品種の種子の保護に好適である。より詳細には、種子とは、穀物(コムギ、オオムギ、ライムギ、ミレットおよびオートムギなど)、ナタネ、メイズ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、マメ、コーヒー、ビート(例えば、サトウダイコンおよび飼葉ビート)、ピーナッツ、野菜(トマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど)、芝生および観賞植物の種子のことである。コムギ、ダイズ、ナタネ、メイズおよびイネの種子の処理が、特に重要である。

20

【0150】

以下にも記載されている通り、本発明の活性成分または組成物によるトランスジェニック種子の処理は、特に重要である。トランスジェニック種子とは、例えば、殺害虫特性を有するポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能にする、少なくとも1つの非相同性遺伝子を含む植物の種子を指す。トランスジェニック種子におけるこのような非相同性遺伝子は、例えば、バシルス属、リゾビウム属、シュードモナス属、セラチア属、トリコデルマ属、クラビバクテル属、グロムス属またはグリオクラディウム属の種の微生物に由来し得る。これらの非相同性遺伝子は、好ましくは、バシルス属の種に由来し、この場合、遺伝子産物は、ヨーロッパアワノメイガおよび/またはウエスタンコーンルートワームに対して有効である。特に、好ましくは、非相同性遺伝子は、バシルス・ツリングエンシスに由来する。

30

【0151】

本発明の文脈では、本発明の組成物は、単独で、または好適な製剤中でのどちらか一方で適用される。好ましくは、種子は、処理の過程において損傷が起こらないほど十分に安定な状態で処理される。一般に、種子は、収穫時と播種後のある時点との間の任意の時間に処理することができる。それは、植物から分離された種子、および果実の穂軸、殻、柄、皮、毛または果肉から取り除かれた種子を使用するのが慣用的である。例えば、収穫して洗浄し、15重量%未満の水分含量まで乾燥した種子を使用することが可能である。代替的に、乾燥後、例えば、水で処理し、次に、再度乾燥した種子、または下塗り直後の種子、または下塗り条件で保管した種子、または予備発芽後種子、または苗床トレイ、テーブルもしくは紙上に播種した種子を使用することも可能である。

40

【0152】

種子を処理する場合、種子に施用される本発明の組成物の量および/またはさらなる添加物の量は、種子の発芽に害がもたらされないように選択されること、または得られた植物が損傷を受けないようにすることを一般に確実にしなければならない。これは、特に、ある種の施用量で植物毒性作用を示し得る活性成分の場合には、確実にしなければならない。

50

【 0 1 5 3 】

式(Ⅰ)の化合物は、直接施用することができ、すなわち、いかなる他の構成成分も含まず、かつ希釈もされていない。一般に、組成物を好適な製剤の形態で種子に施用することが好ましい。種子処理するための好適な製剤および方法は、当業者に公知である。式(Ⅰ)の化合物は、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、散剤、発泡体剤、スラリー剤などの、種子表面施用に関連する慣用的な製剤に変換することができるか、またはフィルム形成性物質、ペレット形成性物質、微粉鉄または他の金属粉末、顆粒、種子を不活性化させるコーティング材料などの種子の他のコーティング用組成物、さらにまたULV製剤と一緒にすることができる。

【 0 1 5 4 】

10

植栽性を容易にするための種子の処理では、種子は、ポリマーによりコーティングされ得る。ポリマーコーティング剤は、結合剤、ワックスおよび顔料、ならびに懸濁液を安定化するのに有効な量の1種または複数の安定剤からなる。結合剤は、酢酸ビニル-エチレンコポリマー、酢酸ビニルホモポリマー、酢酸ビニル-アクリルコポリマー、ビニルアクリル、アクリル、エチレン-塩化ビニル、ビニルエーテル無水マレイン酸またはブタジエンスチレンからなる群から選択されるポリマーとすることができる。他の同様のポリマーも使用することができる。

【 0 1 5 5 】

これらの製剤は、活性成分または活性成分の組合せ物と慣用的な添加物、例えば慣用的な増量剤および溶媒または希釈剤、色素、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリンさらにまた水とを混合することによって、公知の方法で調製される。

20

【 0 1 5 6 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる有用な色素は、このような目的に慣用的な色素のすべてである。水にやや溶けにくい顔料、または水溶性の色素のどちらか一方を使用することができる。例には、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112およびC、I、ソルベントレッド1という名称によって知られている色素が含まれる。

【 0 1 5 7 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる有用な湿潤剤は、湿潤を促進する、および活性農薬成分の製剤に慣用的に使用されるすべての物質である。ジイソプロピルナフタレンスルホネートまたはジイソブチルナフタレンスルホネートなどのアルキルナフタレンスルホネートが、優先的に使用可能である。

30

【 0 1 5 8 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる有用な分散剤および/または乳化剤は、活性農薬成分の製剤に慣用的に使用される非イオン性、陰イオン性および陽イオン性の分散剤のすべてである。非イオン性分散剤または陰イオン性分散剤、または非イオン性もしくは陰イオン性分散剤の混合物が、優先的に使用可能である。有用な非イオン性分散剤には、とりわけ、エチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテルおよびトリステチルフェノールポリグリコールエーテル、ならびにそれらのリン酸化誘導体または硫酸化誘導体が含まれる。好適な陰イオン性分散剤は、とりわけ、リグノスルホン酸塩、ポリアクリル酸塩およびアリールスルホン酸/ホルムアルデヒド縮合物である。

40

【 0 1 5 9 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる消泡剤は、活性農薬成分の製剤に慣用的に使用されるすべての発泡阻止物質である。シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムが、優先して使用され得る。

【 0 1 6 0 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる保存剤は、農薬組成物中にこのような目的に使用可能なすべての物質である。例には、ジクロロフェンおよびベン

50

ジルアルコールヘミホルマールが含まれる。

【 0 1 6 1 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる二次増粘剤は、農薬組成物中にこのような目的に使用可能なすべての物質である。好ましい例には、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、修飾クレイおよび微粉碎シリカが含まれる。

【 0 1 6 2 】

本発明により使用可能な種子粉衣製剤に存在することができる接着剤は、種子粉衣製品に使用可能な慣用的な結合剤のすべてである。好ましい例には、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースが含まれる。

【 0 1 6 3 】

本発明により使用可能な種子表面施用向けの製剤を使用して、直接または水で予め希釈した後のどちらか一方で、様々な幅広い種類の種子を処理することができる。

例えば、濃縮物、または水で希釈することによって濃縮物から得ることができる調製物は、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギおよびライコムギなどの穀物の種子、さらにまたメイズ、ダイズ、イネ、ナタネ、エンドウ、マメ、ワタ、ヒマワリおよびビートの種子、または幅広い様々な野菜種子を粉衣するために使用することができる。本発明により使用可能な製剤、またはその希釈調製物はまた、トランスジェニック植物の種子に使用することもできる。この場合、追加的な相乗効果もまた、発現によって形成される物質との相互作用時に起こることがある。

【 0 1 6 4 】

本発明により使用可能な製剤、または水を添加することによって該製剤から調製される調製物を用いた種子の処理の場合、種子表面施用に慣用的に使用可能なすべての混合用ユニットが有用である。具体的には、種子表面施用における手順は、種子をミキサに入れること、このままで、または水で事前希釈した後の特定の所望量の製剤を加えること、およびすべての施用された製剤が種子表面に均一に分布されるまですべてを混合することである。適切な場合、その後に乾燥操作が続く。

【 0 1 6 5 】

本発明により使用可能な製剤の施用量は、比較的幅広い範囲内で様々にすることができる。施用量は、製剤中の活性成分の特定の内容物によって、および種子によって導かれる。各単一活性成分の施用量は、一般に、種子 1 キログラムあたり 0 . 0 0 1 ~ 1 5 g の間、好ましくは種子 1 キログラムあたり 0 . 0 1 ~ 5 g の間である。

【 0 1 6 6 】

菌類駆除剤として式 (I) の化合物を使用する場合、施用量は、施用の種類に応じて、比較的幅広い範囲内で様々となり得る。本発明の活性成分の施用量は、以下の通り：

植物部分、例えば葉の処理の場合： 0 . 1 ~ 1 0 0 0 0 g / h a 、好ましくは 1 0 ~ 1 0 0 0 g / h a 、より好ましくは 3 0 ~ 3 0 0 g / h a (散水または点滴によって施用する場合、とりわけ、ロックウールまたはパーライトなどの不活性基材を使用した場合、施用量を低減することさえ可能である) ；

種子処理の場合：種子 1 0 0 k g あたり 0 . 1 ~ 2 0 0 g 、種子 1 0 0 k g あたり好ましくは 1 ~ 1 5 0 g 、より好ましくは種子 1 0 0 k g あたり 2 . 5 ~ 2 5 g 、さらにより好ましくは、種子 1 0 0 k g あたり 2 . 5 ~ 1 2 . 5 g ；

土壌処理の場合： 0 . 1 ~ 1 0 0 0 0 g / h a 、好ましくは 1 ~ 5 0 0 0 g / h a である。

【 0 1 6 7 】

これらの施用量は、単に例に過ぎず、本発明の目的のために限定されない。

【 0 1 6 8 】

一部の場合、式 (I) の化合物は、特定の濃度または施用量で、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤、もしくは植物特性を改善するための作用剤として、または殺微生物剤として、例えば菌類駆除剤、抗かび剤、殺細菌剤、抗ウイルス剤 (ウイロイドに対する組成物を含む) として、または M L O (マイコプラズマ様生物) および R L O (リケッチア様生物

10

20

30

40

50

）に対する組成物として使用することもできる。

【0169】

式（I）の化合物は、植物の生理過程に干渉し、したがって、植物成長調節剤として使用することもできる。

植物成長調節剤は、植物に様々な作用を発揮することがある。この物質の作用は、植物の発達段階、植物品種に関わる施用時、さらにまた植物またはその環境に施用される活性成分の量、および施用のタイプに本質的に依存する。各場合において、成長調節剤は、作物植物に特定の所望の作用を有するはずである。

【0170】

成長を調節する作用は、一層早い発芽、良好な出芽、一層発達した根系および／または根の成長の改善、分げつ能力の向上、さらなる有効分げつ、早咲き、植物長および／またはバイオマスの増大、茎の短小化、新芽成長の改善、仁／穂の数、穂／ m^2 の数、芽茎の数および／または花の数、収穫指数の増大、一層大きな葉、基底葉の低減、葉序の改善、早期成熟／早い果実の仕上がり、均一な熟成、登熟期間の増大、一層優れた果実の仕上がり、一層大きな果実／野菜のサイズ、発芽抵抗および倒伏の低減を含む。

10

【0171】

収量の増加または改善は、ヘクタールあたりの全バイオマス、ヘクタールあたりの収量、仁／果実重量、種子サイズおよび／またはヘクトリットル重量、ならびに以下：

サイズ分布に関する加工性の改善（仁、果実など）、均一な熟成、穀物の水分量、良好なミル粉碎、良好な醸造、良好なビール醸造、果汁収量の増加、収穫性、消化性、沈降価、フォーリングナンバー、鞘の安定性、貯蔵安定性、繊維長／強度／均質性の改善、サイレージ飼育動物のミルク質および／または肉質の向上、調理およびフライへの適応性を含み、

20

果実／穀物品質、サイズ分布（仁、果実など）の改善、保管／保存可能期間の向上、弾力／柔らかさ、味感（芳香、食感など）、等級（サイズ、形状、ベリー数など）、一束あたりの液果／果実の数、さわやかさ、フレッシュ感、ワックスによる被覆量、生理的傷害の頻度、色調などに関連する市場性の改善をさらに含み、

例えば、タンパク質含有量、脂肪酸、油含有量、油品質、アミノ酸組成、糖含有量、酸含有量（pH）、糖／酸比（ブリックス計）、ポリフェノール、デンプン含有量、栄養品質、グルテン含有量／指数、エネルギー含有量、味感などの所望の成分の増加をさらに含み、

30

例えば、より少ないマイコトキシン、より少ないアフラトキシン、ゲオスミンレベル、フェノール性芳香、ラッカーゼ、ポリフェノールオキシダーゼおよびペルオキシダーゼ、硝酸塩含有量などの望ましくない成分の低下をさらに含む、

産物の品質向上を指す。

【0172】

植物成長調節性化合物は、例えば、植物の栄養成長を減速させるために使用することができる。こうして、このような成長の減退は、観葉植物の庭、公園およびスポーツ施設、道路脇、空港において、または果実作物において、草刈りの頻度が低減する可能性がある。例えば、草の場合、経済的に関心が高い。同様に、重要なことは、道路脇、およびパイプラインまたは架空ケーブルの近く、または非常に一般的には、活発な植物の成長が望まれない地域における、草本植物および木本植物の成長の抑制である。

40

【0173】

同様に、穀物の縦方向の成長を阻害するため、成長調節剤の使用が重要である。これは、収穫前の植物の倒伏のリスクを低減する、または完全に排除する。さらに、穀物の場合の成長調節剤は、倒伏をやはり防止する程を強化することができる。稈を短小化および強化するための成長調節剤の使用により、一層多くの肥料量を配置して、穀物作物の倒伏のいかなるリスクもなしに、収量を増加することができる。

【0174】

多くの作物植物では、栄養成長の減退により、植栽をより密にし、したがって、土壌表

50

面を基準にすると、一層多い収量を実現することが可能となる。この方法で得られたより小さな植物の別の利点は、作物の栽培および収穫が容易となることである。

【0175】

栄養植物の成長の低下はまた、栄養素および同化産物が、植物の栄養部分に対してよりも、花および果実形成に対して一層有益であるので、収量の増加および改善をもたらすことができる。

【0176】

代替的に、成長調節剤はまた、栄養成長を促進するために使用することができる。これは、栄養植物部分を収穫する際に、大きな利益がある。しかし、栄養成長の促進はまた、さらなる同化産物が形成される生殖成長を促進することができ、より多くのまたはより大きな果実をもたらす。

10

【0177】

さらに、成長または収量に及ぼす有益な効果は、栄養素の使用効率、とりわけ窒素（N）使用効率、リン（P）使用効率、水使用効率の改善、蒸散、呼吸および/またはCO₂同化率の改善、良好な根粒着生、Ca代謝の改善などにより実現することができる。

【0178】

同様に、成長調節剤は、植物の組成を改変するために使用することができ、ひいては、収穫した産物の品質の改善をもたらすことができる。成長調節剤の影響下では、単為結実果実が形成されることがある。さらに、花の性別に影響を及ぼすことができる。ハイブリッド種子の育種および生成において非常に重要な、無菌花粉を生成することも可能である。

20

【0179】

成長調節剤の使用は、植物の分枝を制御することができる。一方、頂芽優勢を崩すことにより、側芽の成長を促進することが可能であり、これにより、やはり成長の阻害と組み合わせ、特に観葉植物の栽培において非常に望ましいことがある。一方、側芽の成長を阻害することも可能である。この作用は、例えば、タバコの栽培において、またはトマトの栽培において、特に関心が高い。

【0180】

成長調節剤の影響下では、植物に対する葉の量は、植物の落葉が所望の時機に実現するよう制御することができる。このような落葉は、ワタの機械収穫において主な役割を果たすが、他の作物、例えば、ブドウ栽培においても収穫を容易にするため関心が高い。植物の落葉はまた、植物を移植する前に、植物の蒸散を低下させるために行うことができる。

30

【0181】

さらに、成長調節剤は、植物の老化をモジュレートすることができ、これにより、緑色の葉面積の持続時間が長くなり、登熟期が長くなり、収量の質が向上することがある。

【0182】

同様に、成長調節剤は、果実の裂開を調節するために使用することができる。一方、早すぎる果実の裂開を予防することが可能である。一方、果実の裂開、または所望の質量を実現するために花摘み（「摘花」）さえ促進させることも可能である。さらに、機械収穫を可能にするため、または手作業による収穫を容易にするため、果実を切り取るために必要とされる力を軽減するよう、収穫時に成長調節剤を使用することが可能である。

40

【0183】

成長調節剤は、収穫前または収穫後の収穫物質の成熟を速くするまたは他には遅らせることを実現するために使用することもできる。これは、市場の要件を最適調節することが可能になるので、特に有利である。さらに、成長調節剤は、一部の場合、果実の色を改善することができる。さらに、成長調節剤はまた、成熟のある特定の期間内に同期するために使用することができる。これにより、例えば、タバコ、トマトまたはコーヒーの場合、単一操作で機械収穫または手作業収穫を完了するための必要条件が確立される。

【0184】

成長調節剤の使用によって、植物の種子または芽の休息に影響を与えることがさらに可能であり、こうして、パイナップルまたは苗床の観賞植物などの植物は、例えば、それら

50

が発芽、出芽または開花する傾向が通常ない時に、発芽、出芽または開花する。霜のリスクがある地域では、晩霜に起因する被害を回避するため、成長調節剤の手助けによって、種子の出芽または発芽を遅延させることが望ましいことがある。

【 0 1 8 5 】

最後に、成長調節剤は、霜、渇水または土壌の高い塩分濃度に対する植物の耐性を誘発することができる。これにより、この目的のため、通常適切ではない地域での植物栽培が可能となる。

【 0 1 8 6 】

式 (I) の化合物はまた、植物における強力な増強作用を示す。したがって、式 (I) の化合物は、望ましくない微生物による攻撃からの植物の防御を集結させるために使用することができる。

10

【 0 1 8 7 】

本文脈における植物強化 (耐性誘導) 物質は、処理された植物が、その後に、望ましくない微生物を接種された際に、これらの微生物に対して高度な耐性を発現するように植物の防御システムを刺激することが可能な物質である。

【 0 1 8 8 】

さらに、本発明による文脈では、本発明の植物生理学作用は、以下：高温または低温への耐性、渇水耐性および渇水ストレス後の回復、水使用効率 (水の消費量の削減に関連) 、洪水耐性、オゾンストレスおよび UV 耐性、重金属、塩、殺有害生物剤などのような化学物質に対する耐性を含む、非生物的ストレス耐性を含む。

20

【 0 1 8 9 】

菌類への耐性の向上、および線形動物、ウイルスおよび細菌に対する耐性の向上を含む生物ストレス耐性。本発明による文脈では、生物耐性は、菌類への耐性の向上、および線形動物に対する耐性の向上を好ましくは含む。

【 0 1 9 0 】

植物の健康 / 植物の品質および種子の活力、木立の不具合の低減、外観の改善、ストレス期間後の回復の増強、色素沈着の改善 (例えば、クロロフィル含有量、緑の維持効果など) および光合成効率の改善を含めた植物の活力の増大。

【 0 1 9 1 】

さらに、式 (I) の化合物は、収穫物質、およびそれから調製された食物および飼料中のマイコトキシン含有量を低減することができる。マイコトキシンは、特に排他的ではないが、以下；デオキシニバレノール (DON) 、ニバレノール、15 - Ac - DON、3 - Ac - DON、T2 - および HT2 - トキシン、フモニシン、ゼアラレノン、モニリホルミン、フサリン、ジアセオトキシシルベノール (DAS) 、ビューベリシン、エンニアチン、フサロプロリフェリン、フサレノール、オクラトキシン、パツリン、麦角アルカロイドおよびアフラトキシンを含み、これらは、例えば、以下の菌類：F. アクミナツム (*F. acuminatum*) 、F. アシアチクム (*F. asiaticum*) 、F. アベナセウム (*F. avenaceum*) 、F. クロオクウェレンセ (*F. crookwellense*) 、F. クルモルム、F. グラミネアルム (*F. graminearum*) (ギベレルラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*)) 、F. エクイセチ (*F. equiseti*) 、F. フジコロイ (*F. fujikoroii*) 、F. ムサルム (*F. musarum*) 、F. オキシスポルム (*F. oxysporum*) 、F. プロリフェラツム (*F. proliferatum*) 、F. ポアエ (*F. poae*) 、F. プセウドグラミネアルム (*F. pseudograminearum*) 、F. サムブシヌム (*F. sambucinum*) 、F. シルピ (*F. scirpi*) 、F. セミテクトム (*F. semitectum*) 、F. ソラニ (*F. solani*) 、F. スポロトリコイデス (*F. sporotrichoides*) 、F. ラングセチアエ (*F. langsethiae*) 、F. スブグルチナンス (*F. subglutinans*) 、F. トリシンクツム (*F. tricinatum*) 、F. ベルチシルリオイデス (*F. verticilliioides*) などのフサリウム属の種によって、およびさらには A. フラプス (*A. flavu*

30

40

50

s)、A.パラシチクス(A. parasiticus)、A.ノミウス(A. nomius)、A.オクラセウス(A. ochraceus)、A.クラバツス(A. clavatus)、A.テレウス(A. terreus)、A.ベルシコロル(A. versicolor)などのアスペルギルス属の種、P.ベルコスム(P. verrucosum)、P.ビリジカツム(P. viridicatum)、P.シトリヌム(P. citrinum)、P.エキスパンスム(P. expansum)、P.クラビホルメ(P. claviforme)、P.ロクエホルチ(P. roqueforti)などのペニシリウム属の種、C.プルプレア(C. purpurea)、C.フシホルミス(C. fusiformis)、C.パスパリ(C. paspali)、C.アフリカナ(C. africana)などのクラビセプス属の種、スタキボトリス属の種などによって産生され得る。

10

【0192】

式(I)の化合物は、材料の保護において、植物病原菌による攻撃および破壊に対して工業材料を保護するために使用することもできる。

【0193】

さらに、式(I)の化合物は、単独で、または他の活性成分と組み合わせて、防汚組成物として使用することができる。

【0194】

本文脈における工業材料とは、工業において使用するために調製された無生物材料を意味すると理解される。例えば、本発明の組成物によって、微生物による変性または破壊から保護されることになる工業材料は、接着剤、のり、紙、壁紙および厚紙/板紙、織物、カーペット、皮革、木材、繊維および薄織物、塗料およびプラスチック製物品、冷却用潤滑剤、ならびに微生物によって感染または破壊される恐れのある他の材料とすることができる。微生物の増殖により損なわれる恐れのある製造プラントおよび建造物の一部、例えば冷却水循環路、冷却システムおよび暖房システム、ならびに換気装置および空調ユニットが、保護すべき材料の範囲内にあると言及することができる。本発明の範囲内の工業材料は、好ましくは、接着剤、サイズ剤、紙および厚紙、皮革、木材、塗料、冷却用潤滑剤および熱伝導流体、より好ましくは木材を含む。

20

【0195】

式(I)の化合物は、腐朽、腐敗、変色、脱色またはかび形成などの有害作用を防止することができる。

30

【0196】

木材を処理する場合、式(I)の化合物はまた、材木の表面または内部で増殖し易い菌類病害に対して使用することができる。用語「材木」は、すべてのタイプの木材の種、および建築向けにこのような木材の加工品のすべてのタイプ、例えば、ソリッドウッド、高密度木材、ラミネート加工木材および合板を意味する。本発明による材木の処理方法は、主に、本発明による組成物を接触させるステップにある。これには、例えば、直接的な施用、スプレー、浸漬、注入、または任意の他の好適な手段が含まれる。

【0197】

さらに、式(I)の化合物は、海水または淡海水と接触する物体、とりわけ船体、遮蔽物、網、建造物、係留索具および信号システムを付着物から保護するために使用することができる。

40

【0198】

式(I)の化合物はまた、貯蔵品を保護するために使用することができる。貯蔵品は、長期間の保護が望まれる、植物もしくは動物起源の天然物質または自然起源であるそれらの加工製品を意味すると理解される。

【0199】

植物起源の貯蔵品、例えば、茎、葉、塊茎、種子、果実、穀物などの植物もしくは植物部分は、新たに収穫された状態で保護することができるか、または(予備)乾燥、加湿、粉碎、摩砕、圧縮もしくは焙焼によって加工された後に保護することができる。貯蔵品は

50

また、建築用木材、電柱および柵などの未加工木材、または家具などの完成製品の形態にある木材の両方を包含する。動物起源の貯蔵品は、例えば、皮、皮革、毛皮および獣毛である。本発明の組成物は、腐朽、腐敗、変色、脱色またはかび形成などの有害作用を防止することができる。

【0200】

工業材料を劣化または変性させることができる微生物には、例えば、細菌、菌類、酵母、藻および粘液生物が含まれる。式(I)の化合物は、好ましくは、菌類、とりわけかび、材木を変色させる菌類および木材を破壊する菌類(子囊菌、担子菌、不完全菌および接合菌)、ならびに粘液生物および藻に対して作用する。例には、以下の属の微生物:アルテルナリア属(アルテルナリア・テヌイス(*Alternaria tenuis*)など);アスペルギルス属(アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)など);カエトミウム属(カエトミウム・グロボスム(*Chaetomium globosum*)など);コニオホラ属(コニオホラ・プエタナ(*Coniophora puetana*)など);レンチヌス属(レンチヌス・チグリヌス(*Lentinus tigrinus*)など);ペニシリウム属(ペニシリウム・グラウカム(*Penicillium glaucum*)など);ポリボルス属(ポリボルス・ベルシコロール(*Polyporus versicolor*)など);アウレオバシジウム属(アウレオバシジウム・プルランス(*Aureobasidium pullulans*)など);スクレロホマ属(スクレロホマ・ピチオフィラ(*Sclerophoma pityophila*)など);トリコデルマ属(トリコデルマ・ビリデ(*Trichoderma viride*)など);オフィオストマ属の種、セラトシスチス属の種、フミコラ属の種、ペトリエルラ属の種、トリクルス属の種、コリオルス属の種、グロエオフィルム属の種、ブレウロツス属の種、ポリア属の種、セルプラ属の種およびチロミセス属の種、クラドスポリウム属の種、パエシロミセス属の種、ムコル属の種、エスケリキア属(エスケリキア・コリ(*Escherichia coli*)など);シュードモナス属(シュードモナス・アエルギノサ(*Pseudomonas aeruginosa*)など);スタフィロコッカス属(スタフィロコッカス・オーレウス(*Staphylococcus aureus*)など)、カンジダ属の種およびサッカロミセス属の種(サッカロミセス・セレビスエ(*Saccharomyces cerevisiae*)など)が含まれる。

【0201】

さらに、式(I)の化合物はまた、非常に良好な抗かび作用を有する。それらは、とりわけ、皮膚糸状菌および酵母、かびおよび二相性真菌(例えば、カンジダ・アルビカンス(*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*)などのカンジダ属の種)、およびエピデルモフィトン・フロコスム(*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス・ニゲルおよびアスペルギルス・フミガツス(*Aspergillus fumigatus*)などのアスペルギルス属、トリクロフィトン・メンタグロフィテス(*Trichophyton mentagrophytes*)などのトリクロフィトン属の種、ミクロスポロン・カニス(*Microsporon canis*)およびミクロスポロン・アウドウイニイ(*Microsporon audouinii*)などのミクロスポロン属の種に対して非常に幅広い抗かび活性スペクトルを有する。これらの菌類の列挙は、包含されるかびスペクトルの限定を決して構成するものではなく、単に例示的性質に過ぎない。

【0202】

本化合物は、魚類および甲殻類の養殖における重要な菌類病原体、例えばトラウトにおけるサブロレグニア・ディクリナ(*saprolegnia diclina*)、ザリガニにおけるサブロレグニア・パラシチカ(*saprolegnia parasitica*)を防除するためにも使用することができる。

【0203】

したがって、式(I)の化合物は、医療的用途および非医療的用途の両方で使用することができる。

【 0 2 0 4 】

式 (I) の化合物は、そのまま使用することができ、即時使用可能な溶液剤、懸濁液剤、水和剤、ペースト剤、可溶性粉末剤、粉剤および顆粒剤などの、その製剤の形態またはその製剤の形態から調製される使用形態で使用することができる。施用は、慣用的な方法で、例えば、散水、スプレー、噴霧、全面散布、撒布、粉衣、発泡形成、表面塗布などによって行われる。超微量法によって活性成分を展開させること、または土壌に活性成分の調製物 / 活性成分自体を注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【 0 2 0 5 】

好ましくは、野生植物種および植物栽培品種、または交雑もしくはプロトプラスト融合などの従来の生物学的育種法によって得られたもの、さらにまたそれらの一部によって、本発明によるすべての植物およびその部分を処理することが可能である。さらに好ましい実施形態では、適切な場合、従来の方法 (遺伝的に改変された生物) およびその一部と組み合わせ、遺伝子操作方法によって得られたトランスジェニック植物および植物栽培品種が処理される。用語「部分」または「植物の一部」または「植物部分」は、上で説明されている。より好ましくは、市販されているまたは使用中の植物栽培品種の植物が、本発明により処理される。植物栽培品種は、新しい特性 (「形質」) を有しており、慣用的な育種によって、突然変異誘発または組換え DNA 技法によって得られる植物を意味することが理解される。それらは、栽培品種、品種、生物型または遺伝子型とすることができる。

【 0 2 0 6 】

本発明による処理方法は、遺伝子改変生物 (G M O) 、例えば、植物または種子の処理に使用することができる。遺伝子改変植物 (または、トランスジェニック植物) とは、その非相同性遺伝子がゲノムに安定的に一体化された植物のことである。表現「非相同性遺伝子」は、本質的に、提示された、または植物の外部で構築された遺伝子であって、核のゲノム、葉緑体のゲノムまたはミトコンドリアのゲノムの中に導入されると、目的のタンパク質もしくはポリペプチドを発現することにより、またはその植物に存在している他の遺伝子 (複数可) を下方調節もしくはサイレンシングすることにより、形質転換された植物に新しいもしくは改善された農学的特性または別の特性を付与する遺伝子を意味する (例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術、RNA 干渉 - R N A i - 技術またはマイクロRNA - m i R N A - 技術を使用する) 。ゲノム内に位置する非相同性遺伝子は、導入遺伝子とも称される。植物ゲノム内におけるその特定の位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象と称される。

【 0 2 0 7 】

本発明により好ましくは処理される植物および植物栽培品種は、特に有利で有用な形質をこれらの植物に付与する遺伝物質を有するすべての植物 (育種および / または生物工学的手段によって得られるかに関わらない) を含む。

【 0 2 0 8 】

本発明により好ましくは同様に処理される植物および植物栽培品種は、1つまたは複数の生物的ストレスに対して耐性である。すなわち、前記植物は、線形動物、昆虫、コダニ、植物病原菌、細菌、ウイルスおよび / またはウイロイドなどの動物および有害微生物に対する良好な防御を示す。

【 0 2 0 9 】

本発明により同様に処理することができる植物および植物栽培品種は、1つまたは複数の非生物的ストレスに対して耐性がある植物である。非生物的ストレス状態は、例えば、渇水、低温曝露、熱曝露、浸透ストレス、湛水、土壌中の塩分濃度の上昇、無機物への曝露の増大、オゾンへの曝露、強い光への曝露、窒素栄養素の利用の制限、リン栄養素の利用の制限、日陰忌避を含むことができる。

【 0 2 1 0 】

本発明により同様に処理することができる植物および植物栽培品種は、収量の増大という特徴によって特徴付けられる植物である。前記植物における収量増加は、例えば、水の

10

20

30

40

50

使用効率、水の保持効率、窒素使用の改善、炭素同化作用の増強、光合成の改善、発芽効率の向上および成熟の加速などの、改善された植物の生理機能、成長および発育の結果であり得る。収量は、以下に限定されないが、早咲き、ハイブリッド種子生成のための開花制御、実生の活力、植物サイズ、節間の数および距離、根の成長、種子サイズ、果実サイズ、莢サイズ、莢または穂の数、1つの莢または穂あたりの種子数、種子質量、種子登熟の増強、種子散布の低下、莢の裂開および耐倒伏性の低下を含む、改善された植物構造によって、さらに影響を受け得る（ストレス条件下および非ストレス条件下）。さらなる収量の形質には、炭水化物含有量および組成、例えばワタまたはデンプン、タンパク質含有量、油の含有量および組成、栄養価、抗栄養化合物の低減、加工性の改善、ならびに良好な貯蔵安定性などの種子の組成が含まれる。

10

【0211】

本発明により処理することができる植物は、一般に、一層多い収量、一層高い活力、一層高い健康、ならびに生物的ストレスおよび非生物的ストレスに対する一層高い耐性をもたらす、雑種強勢（heterosis）、すなわち雑種強勢（hybrid vigor）の特性を既に呈しているハイブリッド植物である。

【0212】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、除草剤耐性植物、すなわち1種または複数の所与の除草剤に対して耐性にされた植物である。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのような除草剤耐性を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができる。

20

【0213】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、すなわちある特定の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にされている植物である。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのような虫害抵抗性を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができる。

【0214】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、非生物的ストレスに対して耐性がある。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのようなストレス耐性を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができる。

30

【0215】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、収穫された産物の量、品質および/もしくは貯蔵安定性の変化、ならびに/または収穫された産物の特定の成分の特性の変化を示す。

【0216】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、ワタ植物などの、繊維特徴の改変を有する植物である。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのような繊維特徴の改変を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができる。

40

【0217】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、オイルプロファイル特徴の改変を有する、ナタネ植物または関連するアブラナ属植物などの植物である。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのようなオイルプロファイル特性の改変を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができる。

【0218】

本発明により処理し得る植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、種子脱粒特徴を有する、ナタネ植物または関連

50

するアブラナ属植物などの植物である。このような植物は、遺伝的形質転換によって、またはこのような種子脱粒特徴の改変を付与する突然変異を含む植物を選択することによって得ることができ、種子脱粒が遅延または低減されているナタネ植物などの植物を含む。

【 0 2 1 9 】

本発明により処理することができる植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることができる）は、翻訳後タンパク質修飾パターンの改変を有する、タバコ植物などの植物である。

【 0 2 2 0 】

したがって、本発明の化合物は、表 1 および 2 に例示されている。

【 0 2 2 1 】

以下の表は、非限定的に本発明による化合物の例を例示している。以下の実施例では、 $M + 1$ （または $M - 1$ ）は、質量分析法で観察される、それぞれ、分子イオンピークプラスまたはマイナス 1 a.m.u. （原子質量単位）であることを意味する。選択された実施例の $^1\text{H-NMR}$ データは、 $^1\text{H-NMR}$ のピークリストの形態で記載する。各シグナルピークに、 ppm の値および丸カッコ内にプロトン数を一覧表示する。

【 0 2 2 2 】

^1H スペクトルに関するケミカルシフトを較正するため、本発明者らは、テトラメチルシラン、および / またはとりわけ DMSO 中で測定したスペクトルの場合、使用した溶媒のケミカルシフトを使用する。したがって、 NMR ピークリストにおいて、テトラメチルシランのピークが発生し得るが、必ずしもではない。

【 0 2 2 3 】

$^1\text{H-NMR}$ ピークリストは、標準的な $^1\text{H-NMR}$ プリント（ print ）に類似しており、したがって、標準的な NMR 解釈において列挙されている、通常 15 種のピークすべてを含む。

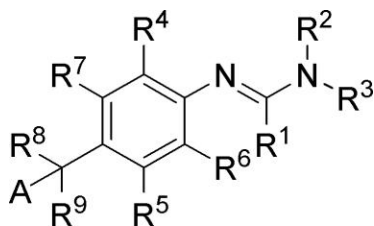
【 0 2 2 4 】

さらに、それらのピークは、同様に、溶媒の標準的な $^1\text{H-NMR}$ プリント、本発明の目的物および / または不純物のピークでもある目的化合物の立体異性体を示し得る。

【 0 2 2 5 】

表 1 は、一般式（I）の化合物を提示している。

【化 5】



(I)

【 0 2 2 6 】

10

20

30

40

50

【表 1】

表 1.

シリアル 番号	化合物名	分析データ
1.	N' - (4 - ベンジル - 2, 5 - ジ メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.51 (b s, 1H), 7.27- 7.23 (m, 2H), 7. 16-7.09 (m, 3H), 6.85 (s, 1H), 6.54 (s, 1H) , 3.84 (s, 2H), , 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 6 H), 1.10 (t, 3H); (M+1):281.5
2.	N - エチル - N' - (4 - (メトキ シ (フェニル) メチル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホル ムイミドアミド	実施例 2 0
3.	N' - (4 - (3, 5 - ジクロロベン ジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホル ムイミドアミド	実施例 1
4.	N' - (4 - (4 - プロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミ ドアミド	実施例 2
5.	N' - (4 - (3, 4 - ジクロロベン ジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホル ムイミドアミド	実施例 3
6.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミ ドアミド	実施例 4
7.	N' - (4 - (4 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミ ドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66-7.43 (1H), 7.31-7.29 (m, 2H), 7.11 (d, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.47-3.32 (2H), 2.90 (s, 3H), 2.0 9 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M +1):316.2
8.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェ ニル) - N - エチル - N - メチルホル ムイミドアミド	実施例 6
9.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミ ドアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56 (s, 1H), 7.04 (d, 2H), 6.97 (d, 2H), 6.82 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 3.79 (d, 2H), 3.33 (d, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.11 (s , 6H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 295.30
10.	N' - (2 - プロモ - 4 - (4 - プ ロモベンジル) - 3, 6 - ジメチル フェニル) - N - エチル - N - メチ ルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆)δ 7.46-7.43 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.05 (d,2H), 6.96 (s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.41 (d, 1H), 3.29- 3.20 (m, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.22-2.18 (m, 3H), 2.07 (d, 3H), 1.08-1.18 (m, 3H); (M +1):438.2
11.	N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミ ドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56 (b s, 1H), 7.30-7.20 (m, 2H), 7.17-7.14 (m, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.90-3.85 (m, 2H), 3.39 (s, 1H), 3.30 (s, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.09-1 .15 (m, 3H); (M+1):316.4

【 0 2 2 7 】

10

20

30

40

50

【表 2】

表 1. (続き)

12.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-(メチルスルホニル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.81 (d, 2H), 7.68-7.44 (1H), 7.36 (d, 2H), 6.90 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.34 (d, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.09 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 359.30
13.	N' - (4-(3-プロモベンジル)-2-クロロ-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (bs, 1H), 7.38-7.34 (m, 1H), 7.29-7.22 (m, 2H), 7.14-7.11 (m, 2H), 6.78 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.45-3.36 (m, 2H), 2.97-2.90 (m, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.13 (s, 3H); (M+1):380.8
14.	N' - (4-(3-プロモベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.25-7.20 (m, 2H), 7.14-7.10 (m, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.35 (s, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.06 (d, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1):361.1
15.	N-エチル-N' - (4-(2-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 7.26- 6.99 (m, 4H), 6.78 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.60-3.36 (2H), 2.90 (s, 3H), 2.15-2.04 (m, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):298.6
16.	N' - (2-クロロ-4-(2-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (d, 1H), 7.29-7.24 (m, 1H), 7.19-7.06 (m, 3H), 6.97 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.40 (s, 2H), 2.93 (d, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):319.2
17.	N' - (2-クロロ-4-(2-クロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (d, 1H), 7.47-7.44 (m, 1H), 7.26 (dt, 2H), 7.04-7.01 (m, 1H), 6.83 (d, 2H), 3.93 (s, 2H), 3.40 (s, 2H), 2.97-2.90 (m, 3H), 2.14 (d, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 336.18
18.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60-7.56 (m, 1H), 7.46-7.42 (m, 1H), 7.26-7.20 (m, 2H), 6.96-6.91 (m, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.59 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.70-3.39 (1H), 3.28-3.10 (1H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 6H), 1.16-1.12 (m, 3H); (M+1):314.8
19.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-(メチルスルフィニル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57-7.55 (m, 3H), 7.30 (d, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.35 (s, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 2.09 (d, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):343.1
20.	N' - (2-クロロ-4-(3, 4-ジクロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.09-7.12 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.93 (d, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):371.1
21.	N' - (2-クロロ-4-(3, 5-ジクロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.15 (s, 3H), 6.79 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.30-3.25 (1H), 3.30 (s, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):370.1

【 0 2 2 8 】

10

20

30

40

50

【表 3】

表 1. (続き)

22.	N' - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.48-7.44 (m, 2H), 7.09-7.06 (m, 3H), 6.78 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.42-3.36 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.96-2.90 (m, 3H), 2.08 (d, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+):380.2
23.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (br s, 1H), 7.26-7.19 (m, 2H), 7.03 (td, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.39-3.46 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.07 (d, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+):
24.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.87 (d, 1H), 7.61-7.57 (m, 1H), 7.47-7.40 (m, 2H), 7.00 (d, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.59 (s, 1H), 3.90 (dd, 2H), 3.40-3.36 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 2.12-2.06 (m, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+):
25.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.96 (d, 1H), 7.70-7.53 (m, 3H), 7.47 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.62 (s, 1H), 4.32 (s, 2H), 3.35 (s, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.07-2.05 (m, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+):
26.	N' - (4 - (2, 5 - ジメチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.04-6.88 (m, 2H), 6.61 (d, 2H), 5.74 (d, 1H), 3.76-3.72 (m, 2H), 3.35 (s, 2H), 2.89 (d, 3H), 2.22 (s, 12H), 1.12 (t, 3H); (M+):309.4
27.	N' - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58-7.52 (m, 2H), 7.07-6.99 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.35 (s, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+):378.4
28.	N' - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 7.31-7.30 (m, 2H), 7.09 (dq, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.35 (s, 1H), 3.28 (d, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+):334.1
29.	N - エチル - N' - (4 - (3 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (d, J = 45.5 Hz, 1H), 7.24-7.28 (m, 1H), 7.06-7.19 (m, 3H), 6.97 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.35-3.42 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.93 (d, J = 27.1 Hz, 3H), 2.14 (s, 6H), 1.11 (t, J = 6.9 Hz, 3H); (M+):299.4
30.	N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (s, 1H), 7.31 (td, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.02-6.90 (m, 3H), 6.78 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.42-3.42 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.93 (d, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+):320.1
31.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (メチルイミノ) (フェニル) メチル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72-7.62 (m, 1H), 7.53-7.49 (m, 2H), 7.40-7.32 (m, 3H), 6.73 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 3.48 (s, 2H), 3.10-3.04 (m, 3H), 2.94 (s, 3H), 2.13 (d, 3H), 1.91 (d, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+):308.4

【 0 2 2 9 】

10

20

30

40

50

【表 4】

表 1. (続き)

32.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(2-メチルベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.17-7.14 (m, 1H), 7.10-7.03 (m, 2H), 6.80-6.77 (m, 1H), 6.59 (d, 2H), 3.78 (d, 2H), 3.42-3.35 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 295.1
33.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(2-フェニル-1, 3-ジチオラン-2-イル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.39-7.37 (m, 2H), 7.27-7.23 (m, 2H), 7.20-7.15 (m, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.48-3.44 (m, 3H), 3.37-3.32 (m, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):
34.	N - (4-(3-クロロ-4-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - 1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.31-7.25 (m, 2H), 7.09 (dq, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.62-3.59 (m, 4H), 3.44 (s, 4H), 2.08 (d, 6H); (M+1):362.2
35.	N - (4-(3-クロロ-4-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - 1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.53 (s, 1H), 7.31-7.23 (m, 2H), 7.08 (dq, 2.3 Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.45-3.34 (m, 4H), 2.07 (d, 6H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.52-1.46 (m, 4H); (M+1):369.9
36.	N - (4-(3-ブロモ-2-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - 1-モルホリノメタンイミン	実施例 16
37.	N - (4-(3-ブロモ-2-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - 1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.54-7.50 (m, 2H), 7.07-6.98 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.46-3.35 (m, 4H), 2.08 (d, 6H), 1.63-1.58 (m, 2H), 1.52-1.46 (m, 4H); (M+1):404.2
38.	N - (2-クロロ-4-(3-フルオロベンジル) - 5-メチルフェニル) - 1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (s, 1H), 7.32 (td, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.03-6.91 (m, 3H), 6.82 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.62-3.60 (m, 4H), 3.55-3.40 (m, 4H), 2.11 (s, 3H); (M+1):347.8
39.	N - (2-クロロ-4-(3-フルオロベンジル) - 5-メチルフェニル) - 1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.31 (td, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.02-6.90 (m, 3H), 6.79 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.52-3.33 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.50 (s, 4H); (M+1):346.5
40.	N - (2-クロロ-4-(2-クロロベンジル) - 5-メチルフェニル) - 1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 1H), 7.27 (dt, 2H), 7.03 (dd, 1H), 6.85 (d, 2H), 3.94 (s, 2H), 3.61 (t, 4H), 3.53-3.43 (m, 4H), 2.13 (s, 3H); (M+1):363.
41.	N' - (4-(3-ブロモ-2-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.47-7.45 (m, 2H), 7.11-7.01 (m, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.07-2.12 (m, 6H); (M+1):351.1
42.	N' - (2-クロロ-4-(3-フルオロベンジル) - 5-メチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (d, 1H), 7.31 (td, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.02-6.92 (m, 3H), 6.72 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 2.77 (d, 3H), 2.10 (s, 3H); (M+1):291.8

【0230】

10

20

30

40

50

【表 5】

表 1. (続き)

43.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(3-メチルベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.15 (t, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.91 (t, 2H), 6.77 (s, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.40 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.23 (d, 3H), 2.12 (d, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):314.8
44.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(4-メチルベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.22-7.12 (m, 1H), 7.16-7.10 (m, 2H), 7.02-6.99 (m, 2H), 6.76 (s, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.35-3.42 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):316.2
45.	N-エチル-N' - (4-(3-メトキシベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (s, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.73-6.70 (m, 1H), 6.67-6.65 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.69 (d, 3H), 3.35-3.29 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.13-1.08 (m, 3H); (M+1): 311.2
46.	N' - (2,5-ジメチル-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (s, 1H), 7.63-7.37 (m, 4H), 6.93 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.62-3.37 (2H), 2.87-2.96 (m, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 349.2
47.	N' - (4-(3-シアノベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64-7.45 (m, 5H), 6.88 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1):306.2
48.	N' - (4-(4-シアノベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73-7.71 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.29 (d, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.51-3.33 (1H), 3.30-3.15 (1H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1):306.17
49.	N' - (2,5-ジメチル-4-(3-ニトロベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.06-8.02 (m, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.64-7.54 (m, 3H), 6.92 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.99 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.10 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1):326.2
50.	N' - (2,5-ジメチル-4-(2-ニトロベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.95 (dd, 1H), 7.61-7.47 (m, 3H), 7.14 (d, 1H), 6.61 (d, 2H), 4.09 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.04 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):326.2
51.	N' - (2,5-ジメチル-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 7.41-7.36 (m, 1H), 7.15-7.02 (m, 3H), 6.88 (d, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.92 (d, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.92 (d, 3H), 2.09-2.06 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):364.2
52.	N-エチル-N' - (4-(3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.09 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 367.17

10

20

30

40

【0231】

【表 6】

表 1. (続き)

53.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.43 (dd, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.63 (s, 2H), 3.86 (s, 2H), 3.37 (s, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.10-2.03 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1):362.4
54.	N-エチル-N' - (4-(4-メトキシベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56 (s, 1H), 7.00 (d, 2H), 6.83-6.79 (m, 3H), 6.53 (s, 1H), 3.75 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.35 (d, 1H), 3.28 (d, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):311.14
55.	N-(4-(2-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (s, 1H), 7.26-7.20 (m, 1H), 7.17-7.12 (m, 1H), 7.08 (td, 1H), 7.01 (td, 1H), 6.79 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.62-3.59 (m, 4H), 3.45 (d, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H); (M+1):326.2
56.	N-(4-(4-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.13-7.12 (m, 4H), 6.85 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.60 (t, 4H), 3.43 (s, 4H), 2.08 (s, 6H); (M+1):326.4
57.	N-エチル-N' - (4-(4-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.54 (s, 1H), 7.14-7.03 (m, 4H), 6.84 (s, 1H), 6.56 (d, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.35-3.29 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):398.1
58.	N-(4-(2-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.53 (s, 1H), 7.24-7.21 (m, 1H), 7.16-7.12 (m, 1H), 7.08 (td, 1H), 7.01 (dd, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.45-3.36 (m, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.52-1.47 (m, 4H); (M+1):325.2
59.	N-(4-(2-クロロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.55 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 1H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.46-3.36 (m, 4H), 2.08 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.64-1.38 (m, 2H), 1.53-1.47 (m, 4H); (M+1):341.2
60.	N-(4-(4-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-1-(ピペリジン-1-イル)メタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.52 (s, 1H), 7.13-7.03 (m, 4H), 6.84 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.82 (d, 2H), 3.46-3.34 (m, 4H), 2.08 (s, 6H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.52-1.46 (m, 4H); (M+1):325.18
61.	N' - (4-(2-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メトキシ-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.86 (s, 1H), 7.26-7.21 (m, 1H), 7.18-7.01 (m, 3H), 6.82 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.09 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.08 (s, 3H); (M+1):301.2
62.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メトキシ-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.88 (s, 1H), 7.46-7.41 (m, 1H), 7.24 (dd, 2H), 6.96 (dd, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.10 (d, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H); (M+1):318.3

10

20

30

40

【0232】

【表 7】

表 1. (続き)

63.	N-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-1-モルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 1H), 7.23 (dd, 2H), 6.93 (dd, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.61 (t, 4H), 3.44 (s, 4H), 2.08 (s, 3H), 2.06 (s, 3H); (M+1): 343.4
64.	N-シアノ-N'-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆): δ 8.60 (d, 1H), 7.30-7.04 (m, 5H), 6.93 (d, 2H), 3.91-3.89 (m, 2H), 2.21(s, 3H), 2.08 (s, 3H); (M+1): 282.14
65.	N'-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-シアノホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.61 (s, 1H), 7.48-7.45 (m, 1H), 7.29-7.28 (m, 3H), 7.01-6.98 (m, 2H), 6.81 (d, 1H), 3.98-3.95 (m, 2H), 2.15 (s, 6H); (M+1):299.1
66.	N'-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-イソプロピルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.41 (s, 1H), 7.26-7.20 (m, 1H), 7.17-7.00 (m, 3H), 6.82-6.77 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 3.98 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.15-1.11(m, 6H); (M+1):300.2
67.	N'-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-イソプロピルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.44 (dt, 2H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.95 (dd, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 3.93 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 2.06 (s, 6H), 1.20-1.15 (d, 6H); (M+1):315.4
68.	N'-(2-クロロ-4-(4-シアノベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70-7.58 (m, 3H), 7.52-7.50 (m, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.47-3.36 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):325.8
69.	N'-(2-クロロ-4-(4-メトキシベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.21-7.17 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 6.77-6.73 (m, 2H), 6.68-6.66 (m, 2H), 3.82 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.32-3.24 (1H), 2.93 (d, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 331.4
70.	N'-(2-クロロ-4-(3-メトキシベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	(¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (d, 1H), 7.04-7.01 (m, 3H), 6.85-6.82 (m, 2H), 6.76 (s, 1H), 3.77 (s, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.38 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):331.5
71.	N'-(2-クロロ-5-メチル-4-(3-ニトロベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.05 (dt, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.61-7.56 (m, 3H), 7.17 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.36 (s, 1H), 2.94 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):345.8
72.	N'-(2-クロロ-4-(3-シアノベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70-7.65 (m, 2H), 7.58 (s, 1H), 7.45-7.52 (m, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.36-3.42 (m, 2H), 2.93 (d, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 326.2
73.	N'-(4-(ジフルオロ(フェニル)メチル)-2-ヨード-3,6-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.53-7.43 (m, 4H), 7.39-7.37 (m, 3H), 3.57-3.30 (m, 2H), 2.83 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.19 (t, 3H); (M+1): 443.05

10

20

30

40

【0233】

【表 8】

表 1. (続き)

74.	N' - (4-ベンジル-2-クロロ-5-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.27 (t, 2H), 7.19-7.11 (m, 3H), 7.05 (s, 1H), 6.77 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.40 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):290.9
75.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(2-ニトロベンジル)フェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.98 (dd, 1H), 7.72-7.62 (m, 2H), 7.49-7.53 (m, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.82 (d, 2H), 4.13 (s, 2H), 3.35-3.42 (m, 2H), 2.94 (d, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):346.06
76.	N' - (2-クロロ-4-(4-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69-7.57 (m, 1H), 7.40-7.22 (m, 1H), 7.19-7.04 (m, 6H), 6.77 (s, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.42-3.37 (m, 2H), 2.93 (d, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):319.2
77.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(4-(トリフルオロメチル)チオ)ベンジル)フェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69-7.58 (m, 3H), 7.27 (t, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.95 (d, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1); 401.4
78.	N' - (2-クロロ-4-(3-クロロベンジル)-5-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (d, 1H), 7.33-7.23 (m, 2H), 7.15-7.08 (m, 3H), 6.78 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.42-3.35 (m, 1H), 2.94 (d, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1); 336.2
79.	N' - (2-クロロ-4-(4-クロロベンジル)-5-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (d, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.13 (d, 2H), 7.08 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.35-3.42 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):335.1
80.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70-7.41 (m, 5H), 7.13 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.98 (s, 2H), 3.35-3.42 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):368.6
81.	N' - (4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル) -N-イソプロピル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.26-7.20 (m, 1H), 7.17-7.14 (m, 1H), 7.12-7.10 (m, 1H), 7.01 (td, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.80-3.65 (1H), 2.81 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.15 (s, 6H); (M+1):328.8
82.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル) -N-イソプロピル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.67 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 1H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.91 (d, 2H), 3.86-3.58 (1H), 2.81 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.16-1.12 (m, 6H); (M+1): 329.2
83.	N-アリル-N' - (4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル) -N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.62 (s, 1H), 7.23 (ddd, 1H), 7.17-7.12 (m, 1H), 7.08 (td, 1H), 7.01 (td, 1H), 6.79 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 5.84 (dt, 2H), 5.21-5.17 (m, 1H), 3.92-3.89 (m, 2H), 3.83 (s, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H); (M+1):311.2

【0234】

10

20

30

40

50

【表 9】

表 1. (続き)

84.	N-アリル-N'-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.45-7.43 (m, 1H), 7.25-7.20 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.61 (s, 1H), 5.88-5.81 (m, 2H), 5.22-5.17 (m, 1H), 3.94 (s, 2 H), 3.89-3.80 (m, 2 H), 2.88 (s, 3H), 2.07 (d, 6H); (M+1):327
85.	N-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-1-チオモルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (s, 1H), 6.98-7.25 (m, 4H), 6.79 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.83-3.67 (m, 6H), 2.61-2.59 (m, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.06 (s, 3H); (M+1):343.2
86.	N-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-1-チオモルホリノメタンイミン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (s, 1H), 7.45-7.44 (m, 1H), 7.23 (dd, 2H), 6.96-6.94 (m, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.73 (d, 4H), 2.62-2.59 (m, 4H), 2.07 (s, 6H); (M+1):359.1
87.	N-(シクロプロピルメチル)-N'-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.23-7.20 (m, 4H), 6.77 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.04 (d, 5H), 2.10-2.06 (m, 6H), 1.21 (s, 1H), 0.49-0.44 (m, 2H), 0.21 (s, 2H); (M+1): 325.4
88.	N-(シクロプロピルメチル)-N'-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-イソプロピルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75-7.53 (1H), 7.24-6.99 (m, 4H), 6.78 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.57 (1H), 3.20 (s, 2H), 2.09 (d, 6H), 1.22 (d, 6H), 1.17-0.98 (1H), 0.46-0.27 (m, 4H); (M+1): 353.4
89.	N'-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-イソプロピルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (s, 1H), 7.44-7.41 (m, 1H), 7.24-7.21 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.82-3.57 (m, 1H), 3.21 (d, 2H), 2.07-2.00 (s, 6H), 1.23-1.19 (m, 6H), 1.00 (m, 1H), 0.45 (d, 2 H), 0.29 (d, 2H); (M+1): 369.2
90.	N'-(4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-シアノ-N-(シアノメチル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.16 (s, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.25-7.18 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.95-6.91 (m, 2H), 4.59 (s, 2H), 4.05 (s, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.15 (s, 3H); (M+1):337.4
91.	N-シアノ-N-(シアノメチル)-N'-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.14 (bs, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.10-6.99 (m, 5H), 4.58 (s, 2H), 3.97 (s, 2H), 2.29 (s, 6H); (M+1):321.2
92.	N'-(2,5-ジメチル-4-(4-(トリフルオロメチル)チオ)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 7.52 (d, 2H), 7.43 (s, 1H), 7.15 (d, 2 H), 6.89 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.93 (s, 2 H), 3.38 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.27(s, 3 H), 2.12 (s, 3H), 1.26-1.20 (m, 3H); (M+1): 381.16
93.	N'-(2,5-ジメチル-4-(2-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (bs, 1H), 7.52 (t, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.61 (s, 1H), 4.00 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.05 (d, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1):349.2

10

20

30

40

【0235】

【表 10】

表 1. (続き)

94.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64-7.60 (m, 3H), 7.31 (d, 2H), 6.88 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.35-3.39 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):348.4
95.	N' - (2-クロロ-4-(4-クロロ-3-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.95 (s, 1H), 7.69-7.58 (m, 1H), 7.50-7.46 (m, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.87-6.78 (m, 2H), 4.13 (s, 2H), 3.47-3.28 (m, 2H), 2.84 (s, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):353.10
96.	N' - (4-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンジル)-2-クロロ-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.92 (s, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.66 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.81 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):437.15
97.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.40-7.26 (m, 3H), 7.09 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):383.2
98.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (s, 1H), 7.39 (t, 1H), 7.11-7.06 (m, 2H), 6.93 (s, 1H), 6.56 (d, 1H), 3.76 (s, 2H), 3.19-3.10 (m, 2H), 2.67 (s, 3H), 1.86 (s, 3H), 0.92 (t, 3H); (M+1):387.10
99.	N' - (2-クロロ-4-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (bs, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.16 (td, 1H), 7.06 (dd, 1H), 6.83 (d, 2H), 3.90 (s, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 352.95
100.	N' - (2-クロロ-4-(2-シアノベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (dd, 1H), 7.72-7.61 (m, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.83 (s, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 326.50
101.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75-7.35 (m, 5H), 7.12 (d, 1H), 6.96-6.75 (m, 1H), 4.09-3.78 (m, 2H), 3.53-3.24 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.63-2.42 (s, 3H), 2.29-1.87 (m, 3H), 1.32-1.07 (m, 3H); (M+1):369.50
102.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(2-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 7.38-7.26 (m, 3H), 7.09 (d, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.81 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.43-3.32 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 385.75
103.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4-(2-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79-7.88 (m, 1H), 7.71-7.75 (m, 2H), 7.55-7.63 (m, 2H), 7.44 (t, 1H), 7.04 (d, 1H), 6.85 (d, 2H), 4.03 (s, 2H), 3.34-3.46 (m, 2H), 2.94 (d, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):
104.	N' - (2, 5-ジメチル-4-(4-メチル-3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (bs, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.28 (dd, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 363.4

10

20

30

40

【0236】

【表 1 1】

表 1. (続き)

1 0 5.	N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (b s, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.11 (m, 1H), 6.95 (dd, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.35-3.28 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 333.15
1 0 6.	N' - (4 - (3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.91 (s, 1H), 7.77 (s, 2H), 7.62 (bs, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.36 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.11 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1):417.4
1 0 7.	N' - (4 - (3 - (1 - シアノエチル) ベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56(bs, 1H), 7.30-7.26(m, 1H), 7.18(d, 2H), 7.03 (d, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.54(s, 1H), 4.23 (q, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.34(m, 2H), 2.89(s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.48 (d, 3H), 1.09 (t, 3H); (M+1): 334.4
1 0 8.	N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - メチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (bs, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.78 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):329.2
1 0 9.	N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロ - 3 - メチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56 (b s, 1H), 7.01-6.83 (m, 4H), 6.53 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.10-2.07 (m, 6H), 1.09 (t, 3H); (M+1):313.35
1 1 0.	N' - (4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (b s, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.12 (td, 1H), 6.96 (dd, 1H), 6.64 (d, 2H), 3.86 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1):333.2
1 1 1.	N' - (4 - (3 - (ジメチルアミノ) ベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.56 (b s, 1H), 7.06-7.01 (m, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.57-6.49 (m, 3H), 6.35 (d, 1H), 3.76 (s, 2H), 3.37 (m, 2H), 2.90-2.86 (m, 3H), 2.83 (s, 6H), 2.14 (s, 6H), 1.12 (t, 3H); (M+1):324.2
1 1 2.	N' - (4 - (2, 3 - ジメチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (b s, 1H), 7.00-6.92 (m, 2H), 6.66 (d, 1H), 6.56 (d, 2H), 3.78 (s, 2H), 3.48-3.32 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.14 (s, 6H), 2.04 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1):309.15
1 1 3.	N' - (4 - (3, 4 - ジメチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (bs, 1H), 7.02-6.98 (m, 1H), 6.89-6.78 (m, 3H), 6.53 (s, 1H), 3.74 (s, 2H), 3.51-3.29(m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.14 (s, 6H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 309.1
1 1 4.	N' - (4 - (3, 5 - ジメチルベンジル) - 2, 5 - ジメチルフエニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.57 (bs, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.49-3.20 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.21 (s, 6H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 309.15

10

20

30

40

【 0 2 3 7】

【表 1 2】

表 1. (続き)

1 1 5.	N' - (4 - (2 - シアノベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.81 (d, 1H), 7.60 (td, 2H), 7.39 (t, 1H), 7.13 (d, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.47-3.20 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 306.05
1 1 6.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (bs, 1H), 7.33-7.25 (m, 3H), 7.01 (d, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.47-3.20 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 365.05
1 1 7.	N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (4 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (bs, 1H), 7.28-7.20 (m, 4H), 6.87 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.47-3.20(m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 365.1
1 1 8.	N' - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (bs, 1H), 7.42-7.38 (m, 1H), 7.11 (t, 1H), 7.00- 6.96 (m, 1H), 6.79 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.47-3.21(m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.09 (s,6H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 333.6
1 1 9.	N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - フルオロ - 3 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (bs, 1H), 7.12-7.02 (m, 3H), 6.95-6.91 (m, 1H), 6.76 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.41 (q, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.14-1.09 (m, 3H); (M+1): 333.20
1 2 0.	N' - (2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - 3 - メチルベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.11-7.01 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 350.90
1 2 1.	N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (4 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (bs, 1H), 7.25 (dd, 4H), 7.11 (s, 1H), 6.77 (d, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.41-3.30 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):385.1
1 2 2.	N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (bs, 1H), 7.20-7.17 (m, 1H), 7.15-7.08 (m, 2H), 6.86-6.80 (m, 2H), 6.73 (s, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.42-3.29 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):315.1
1 2 3.	N' - (2 - クロロ - 4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 7.46-7.42 (m, 1H), 7.15 (t, 1H), 7.05-7.01 (m, 2H), 6.80 (d, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.42-3.30 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):353.4
1 2 4.	N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 7.43-7.37 (m, 1H), 7.19-7.10 (m, 4H), 6.78 (d, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.42-3.30 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):385.4
1 2 5.	N' - (2 - クロロ - 4 - (2 - クロロ - 3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (bs, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 6.88-6.83 (m, 3H), 3.98 (s, 2H), 3.42-3.39 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):354.1

【 0 2 3 8】

10

20

30

40

50

【表 1 3】

表 1. (続き)

1 2 6.	N' - (2-クロロ-4-(3-クロロ-2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.97 (dd, 1H), 7.66 (bs, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.83 (s, 1H), 4.01 (s, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.97-2.91 (m, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):421.1
1 2 7.	N' - (4-(シアノ(フェニル)メチル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (s, 1H), 7.41-7.37 (m, 2H), 7.33-7.27 (m, 3H), 7.07 (s, 1H), 6.62 (s, 1H), 5.72 (s, 1H), 3.39-3.25 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 306.10
1 2 8.	N' - (2-クロロ-4-(2,3-ジクロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.66 (bs, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.29 (t, 1H), 6.98 (dd, 1H), 6.85 (d, 2H), 3.99 (s, 2H), 3.38-3.31 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):370.0
1 2 9.	N' - (2-クロロ-4-(3,5-ジフルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.04 (tt, 1H), 6.82-6.79 (m, 3H), 3.89 (s, 2H), 3.42 (s, 1H), 3.31-3.22 (m, 2H), 2.97-2.90 (m, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1):336.8
1 3 0.	N' - (2-クロロ-4-(3,5-ジメチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.64 (bs, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.80-6.71 (m, 4H), 3.76 (s, 2H), 3.43-3.24(m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.20 (s, 6H), 2.11 (s, 3H), 1.10-1.15 (m, 3H); (M+1):329.1
1 3 1.	N' - (4-(2-クロロ-3-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (bs, 1H), 7.30-7.23(m, 2H), 6.79-6.77 (m, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.50-3.22 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 333.55
1 3 2.	N' - (4-(3,5-ジフルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.59 (bs, 1H), 7.00 (tt,1H), 6.88 (s, 1H), 6.80-6.75 (m, 2H), 6.56 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.36-3.22 (m, 2H), , 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 317.15
1 3 3.	N' - (4-(2,3-ジクロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (b s, 1H), 7.52-7.48 (m, 1H), 7.28-7.24 (m, 1H), 6.89 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.61 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.48-3.23 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 349.1
1 3 4.	N' - (4-(3-クロロ-2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.94 (d, 1H), 7.61 (bs, 1H), 7.37 (dd, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.97 (s, 2H), 3.38-3.25 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.12 (s, 6H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 401.25
1 3 5.	N' - (4-(3-クロロ-5-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.60 (b s, 1H), 7.21 (dt, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.95-6.90 (m, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.47-3.21 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 333.15

【 0 2 3 9】

10

20

30

40

50

【表 1 4】

表 1. (続き)

1 3 6.	N' - (2-クロロ-4-(4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70-7.59 (m, 3H), 7.39 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.41-3.26(m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 403.15
1 3 7.	N' - (2-クロロ-4-(3-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71-7.59 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.16-7.13 (m, 2H), 6.80 (s, 1H), 3.98 (s, 2H), 3.42 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 387.15
1 3 8.	N' - (2-クロロ-4-(3, 4-ジフルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.64 (bs, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.18-7.14 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.41 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1):337.15
1 3 9.	N' - (2-クロロ-4-(3-フルオロ-4-メチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.63 (bs, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.84 (d, 2H), 6.77 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.40-3.25 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H);(M+1):337.15
1 4 0.	N' - (2-クロロ-4-(3-フルオロ-5-メチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.64 (bs, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.83 (d, 1H), 6.78 (s, 2H), 6.69 (d, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.40 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H);(M+1): 333.2
1 4 1.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(3-メチルベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.76 (bs, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.16 (t, 1H), 7.12-7.07 (m, 1H), 7.02 (m, 3H), 3.91 (s, 2H), 3.33-3.45 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.09-1.15 (m, 3H); (M+1):335.15
1 4 2.	N' - (4-(4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.59-7.55 (m, 3H), 7.34 (dd, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.29 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.05 (s, 6H), 1.07 (t, 3H); (M+1): 383.2
1 4 3.	N' - (4-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.61 (bs, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.11 (td, 1H), 6.71-6.67 (m, 2H), 6.61 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.49-3.21(m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 333.2
1 4 4.	N-エチル-N' - (4-(3-フルオロ-4-メチルベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.57 (bs, 1H), 7.14 (t, 1H), 6.84-6.79 (m, 3H), 6.54 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.48-3.29 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.12 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 313.25
1 4 5.	N' - (4-(4-クロロ-3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.60-7.54 (m, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.50-3.27 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.12 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 399.2
1 4 6.	N' - (4-(3, 4-ジフルオロベンジル)-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.58 (bs, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.10 (t, 1H), 6.92-6.85 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.44-3.20 (m, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.12 (s, 6H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 317.3

【 0 2 4 0】

10

20

30

40

50

【表 15】

表 1. (続き)

147.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(4-メチルベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.72 (bs, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.08-7.02 (m, 5H), 3.87 (s, 2H), 3.35 (s, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.06-1.12 (m, 3H); (M+1):335.1
148.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(3-フルオロベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.77 (bs, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.34-7.30 (m, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.04-6.99 (m, 3H), 3.98 (s, 2H), 3.46 (s, 2H), 2.99 (s, 3H), 1.15-1.09 (m, 3H); (M+1):339.05
149.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(2-フルオロベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.77 (bs, 1H), 7.32-7.28 (m, 1H), 7.19-7.10 (m, 5H), 3.98 (s, 2H), 3.46-3.40 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.09-1.15 (m, 3H); (M+1):339.1
150.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(2-クロロベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.79 (bs, 1H), 7.47 (dt, 1H), 7.32-7.26 (m, 2H), 7.16-7.13 (m, 1H), 7.10-7.05 (m, 2H), 4.05 (s, 2H), 3.39 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 1.09-1.15 (m, 3H); (M+1):356.9
151.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(2-メチルベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.79 (bs, 1H), 7.20-7.08 (m, 4H), 6.90-6.93 (m, 2H), 3.92 (s, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.09-1.15 (m, 3H); (M+1):335
152.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(3-クロロベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.77 (bs, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.09-7.35 (m, 5H), 3.97 (s, 2H), 3.46-3.36 (m, 2H), 2.99 (m, 3H), 1.09-1.15 (m, 3H); (M+1):357.3
153.	N' - (4-(2, 6-ジクロロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.60-7.49 (m, 3H), 7.35 (dd, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.10 (s, 1H), 4.06 (s, 2H), 3.46-3.21 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.32-2.29 (s, 3H), 1.92 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 349.1
154.	N' - (4-(2-プロモベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.61 (dd, 2H), 7.27 (td, 1H), 7.14 (td, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.46-3.24 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 361
155.	N' - (4-(2-クロロ-6-フルオロベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.59-7.50 (m, 1H), 7.40-7.33 (m, 2H), 7.29-7.23 (m, 1H), 6.60 (s, 1H), 6.28 (s, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.44-3.27 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 333.15
156.	N-エチル-N' - (4-(3-フルオロ-5-メトキシベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.58 (bs, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.61 (dt, 1H), 6.55 (s, 1H), 6.51 (s, 1H), 6.43 (d, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.67 (s, 3H), 3.35-3.18 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 6H), 1.14-1.08 (t, 3H); (M+1): 329.6
157.	N-エチル-N' - (4-(5-フルオロ-2-メチルベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.59 (bs, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.90 (td, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.61 (s, 1H), 6.49 (dd, 1H), 3.76 (s, 2H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.05 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 313.6

【0241】

10

20

30

40

50

【表 16】

表 1. (続き)

158.	N-エチル-N'-(4-(3-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.66 (t, 1H), 7.59 (bs, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.35-3.13 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 367.55
159.	N'-(4-(2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.72-7.60 (m, 3H), 7.26 (d, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.63 (s, 1H), 3.99 (s, 2H), 3.50-3.32 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.03-2.11 (m, 6H), 1.09-1.14 (m, 3H); (M+1): 384.1
160.	N'-(4-(2,5-ジクロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.62 (bs, 1H), 7.52-7.48 (m, 1H), 7.31 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.62 (s, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.53-3.33 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 350
161.	N'-(4-(2,4-ジフルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.63 (bs, 1H), 7.21-7.15 (m, 1H), 7.06-7.00 (m, 1H), 6.97 (td, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.53-3.33 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 317.4
162.	N'-(4-(2,4-ジクロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.63 (m, 2H), 7.32 (dd, 1H), 6.95-6.92 (m, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.06 (s, 6H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 350
163.	N-エチル-N'-(4-(2-フルオロベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (bs, 1H), 7.28-7.20 (m, 2H), 7.15-7.07 (m, 2H), 7.02 (d, 2H), 6.79 (d, 2H), 3.88 (d, 2H), 3.35-3.14 (m, 2H), 2.86 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M+1): 271.35
164.	N'-(4-(2-クロロベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (bs, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.20-7.31 (m, 3H), 7.01 (d, 2H), 6.80 (d, 2H), 3.97 (s, 2H), 3.35-3.18 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 1.09 (t, 3H); (M+1): 287.45
165.	N'-(2-クロロ-4-(5-フルオロ-2-メチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.73 (bs, 1H), 7.22 (dd, 1H), 6.94 (td, 1H), 6.82 (d, 2H), 6.59 (dd, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 333.30
166.	N'-(2-クロロ-4-(2,5-ジクロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.74 (bs, 1H), 7.54-7.50 (m, 1H), 7.38-7.32 (m, 1H), 7.03-6.99 (m, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.31-3.42 (m, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 370.30
167.	N'-(2-クロロ-4-(4-フルオロ-2-メチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71 (bs, 1H), 7.05 (dd, 2H), 6.92 (td, 1H), 6.86 (dd, 1H), 6.82 (s, 1H), 3.77 (s, 2H), 3.41-3.30 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 334.10

【0242】

10

20

30

40

【表 17】

表 1. (続き)

168.	N' - (2-クロロ-4-(2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.74-7.62 (m, 3H), 7.38 (s, 1H), 6.86 (s, 2H), 4.03 (s, 2H), 3.49-3.31 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 404.25
169.	N' - (2-クロロ-4-(3-フルオロ-5-メトキシベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (bs, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.67-6.60 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.47 (d, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.49-3.42 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 349.20
170.	N' - (2-クロロ-4-(2,3-ジメチルベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71 (bs, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.99 (t, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.73 (d, 1H), 6.66 (s, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.41-3.33 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 329.55
171.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-2-メチル-4-(3-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (bs, 1H), 7.14 (t, 1H), 6.98-6.93 (m, 4H), 6.61 (d, 1H), 3.77 (s, 2H), 3.31-3.39 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 299.55
172.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-4-(3-フルオロベンジル)-2-メチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (bs, 1H), 7.33-7.27 (m, 1H), 7.02-6.96 (m, 4H), 6.63 (d, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 303.55
173.	N' - (4-(3-クロロベンジル)-5-フルオロ-2-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (bs, 1H), 7.29 (t, 1H), 7.24-7.20 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.29-3.41 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 319.50
174.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-5-フルオロ-2-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71 (bs, 1H), 7.44-7.40 (m, 1H), 7.28-7.21 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 1H), 6.84 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.40-3.38 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 319.15
175.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-2-メチル-4-(4-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.68 (bs, 1H), 7.09-7.02 (m, 4H), 6.92 (d, 1H), 6.61 (d, 1H), 3.76 (s, 2H), 3.39-3.32 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 299.60
176.	N' - (2-クロロ-4-(3-クロロ-5-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71 (bs, 1H), 7.24 (dt, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.96-6.94 (m, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.42-3.31 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 354.25
177.	N' - (2-クロロ-4-(4-クロロ-3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (bs, 2H), 7.32 (s, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.42-3.31 (m, 2H), 2.90 (d, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 420.00

【0243】

10

20

30

40

50

【表 18】

表 1. (続き)

178.	N' - (2-クロロ-4-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (bs, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.15 (td, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.82 (dd, 2H), 3.93 (s, 2H), 3.43-3.41 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 354.30
179.	N' - (2-クロロ-4-(2, 4-ジクロロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.83 (s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.35-3.31 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 370.80
180.	N' - (2-クロロ-4-(2, 4-ジフルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.24-7.18 (m, 1H), 7.14-7.08 (m, 1H), 7.01 (td, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.42-3.27 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 338.10
181.	N' - (2-クロロ-4-(4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H); (M+1): 388.15
182.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.82 (bs, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.09-7.22 (m, 4H), 4.02 (s, 2H), 3.46-3.31 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 1.15-1.09 (m, 3H); (M+1): 406.90
183.	N' - (2, 5-ジクロロ-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (bs, 1H), 7.57-7.51 (m, 3H), 7.49-7.41 (m, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.44-3.31 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 1.15-1.09 (t, 3H); (M+1): 390.00
184.	N' - (2-クロロ-4-(2-クロロ-6-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.43-7.37 (m, 2H), 7.32-7.26 (m, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.43 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.39-3.30 (s, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.11 (m, 3H); (M+1): 354.25
185.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-4-(2-フルオロベンジル)-2-メチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (bs, 1H), 7.28-7.07 (m, 4H), 6.90 (d, 1H), 6.63 (d, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.41-3.30 (m, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 303.10
186.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-2-メチル-4-(2-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (bs, 1H), 7.15-7.05 (m, 3H), 7.01-6.98 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.40-3.27 (m, 2H), 2.90 (m, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M+1): 299.10
187.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ(4-(トリフルオロメチル)フェニル)メチル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.80 (s, 2H), 7.54-7.52 (m, 2H), 7.29 (s, 1H), 6.88 (d, 2H), 5.99 (s, 1H), 3.46-3.33 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 394.20
188.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ(3-(トリフルオロメチル)フェニル)メチル)-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77-7.61 (m, 5H), 7.29 (s, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.99 (s, 1H), 3.38-3.33 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 394.25

【0244】

10

20

30

40

50

【表 19】

表 1. (続き)

189.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ (4-フルオロフェニル)メチル) -5-メチルフェニル)-N-エチ ル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (s, 1H), 7.34 (dd, 2H), 7.28-7.22 (m, 3H), 6.86 (d, 1H), 5.83 (s, 1H), 3.45-3.32 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 344.15
190.	N' - (2-クロロ-4-(3- クロロ-4-フルオロフェニル) (シ アノ)メチル)-5-メチルフェ ニル)-N-エチル-N-メチルホ ルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.71 (s, 1H), 7.51-7.45 (m, 2H), 7.35-7.30 (m, 2H), 6.88 (d, 1H), 5.86 (s, 1H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.95 (d, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 378.15
191.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ (p-トリル)メチル)-5-メチ ルフェニル)-N-エチル-N-メ チルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.69 (s, 1H), 7.23-7.16 (m, 5H), 6.85 (d, 1H), 5.74 (s, 1H), 3.44-3.30 (m, 2H), 2.95 (d, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), (M+1): 340.55
192.	N' - (2-クロロ-4-(2- クロロフェニル) (シアノ)メチ ル)-5-メチルフェニル)-N-エ チル-N-メチルホルムイミドア ミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.72 (s, 1H), 7.58-7.55 (m, 1H), 7.47-7.43 (m, 2H), 7.40-7.36 (m, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.91 (d, 1H), 5.88 (s, 1H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 357.90
193.	N' - (2-クロロ-4-(4- クロロフェニル) (シアノ)メチ ル)-5-メチルフェニル)-N-エ チル-N-メチルホルムイミドア ミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (s, 1H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.26 (s, 1H), 6.87 (d, 1H), 5.85 (s, 1H), 3.46-3.34 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 360.15
194.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ (3-フルオロフェニル)メチル) -5-メチルフェニル)-N-エチ ル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (s, 1H), 7.48 (td, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.23-7.19 (m, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.87 (d, 1H), 5.86 (s, 1H), 3.38-3.32 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 344.20
195.	N' - (2-クロロ-4-(2, 6- ジクロロベンジル)-5-メチル フェニル)-N-エチル-N-メチ ルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (bs, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.40-7.36 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.24 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.89 (m, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 370.60
196.	N-エチル-N' - (5-フルオロ -2-メチル-4-(3-(トリフ ルオロメチル)ベンジル)フェ ニル)-N-メチルホルムイミ ドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.70 (bs, 1H), 7.55-7.47 (m, 4H), 7.02 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.40-3.37 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 353.35
197.	N' - (2-シクロプロピル-4- (3-フルオロベンジル)-5-メ チルフェニル)-N-エチル-N- メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.60 (bs, 1H), 7.25-7.30 (m, 1H), 6.94-6.98 (m, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.84 (dd, 1H), 6.52 (s, 1H), 6.48 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.27-3.35 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.22-2.32 (m, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.78-0.83 (m, 2H), 0.51-0.55 (m, 2H); (M+1): 325.40
198.	N' - (2-シクロプロピル-5- メチル-4-(3-メチルベンジ ル)フェニル)-N-エチル-N-メ チルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.59 (bs, 1H), 7.11 (t, 1H), 6.95-6.93 (m, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.84 (d, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 3.77-3.60 (m, 5H), 2.91 (s, 3H), 2.26-2.28 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.78-0.82 (m, 2H), 0.50-0.54 (m, 2H); (M+1): 321.55

【0245】

10

20

30

40

【表 20】

表 1. (続き)

199.	N' - (4 - (3-クロロベンジル) - 2-シクロプロピル-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.61 (bs, 1H), 7.27 (t, 1H), 7.21-7.19 (m, 1H), 7.07 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 6.52 (s, 1H), 6.49 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.50-3.32 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.23-2.32 (m, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.83-0.79 (m, 2H), 0.55-0.51 (m, 2H); (M+1): 342.10
200.	N-エチル-N' - (4 - (3-フルオロ-5-メチルベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.58 (bs, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.79 (d, 1H), 6.77 (s, 1H), 6.64 (d, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.47-3.20 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.09 (s, 6H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 313.6
201.	N-エチル-N' - (4 - (2-フルオロ-4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63-7.48 (m, 3H), 7.21 (t, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.34 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.08 (s, 6H), 1.14-1.08 (m, 3H), (M+1): 367.4
202.	N' - (2, 5-ジメチル-4 - (ピリジン-2-イルメチル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.39-8.36 (m, 2H), 7.58 (bs, 2H), 7.27 (ddd, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.36-3.22 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.13 (s, 6H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 333.55
203.	N' - (2-クロロ-4 - (2, 6-ジフルオロベンジル) - 5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (bs, 1H), 7.42-7.29 (m, 1H), 7.15-7.08 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.41-3.28 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 388.00
204.	N' - (2-クロロ-5-メチル-4 - (ピリジン-3-イルメチル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.41-8.38 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 7.49 (dt, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.42-3.29 (m, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 302.50
205.	N-エチル-N' - (2-フルオロ-5-メチル-4 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (br s, 1H), 7.56-7.27 (m, 4H), 6.86 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.48-3.25 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.20-0.98 (m, 3H) (M+1): 353.50
206.	N-エチル-N' - (2-フルオロ-5-メチル-4 - (3 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (bs, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.18-7.15 (m, 2H), 7.09 (s, 1H), 6.88 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.37-3.29 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.16-1.09 (m, 3H), (M+1): 369.5
207.	N-エチル-N' - (2-フルオロ-5-メチル-4 - (2 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル) フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.36-7.28 (m, 3H), 7.08 (d, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.42-3.41 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 369.5
208.	N' - (4 - (3-クロロベンジル) - 2-フルオロ-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.24 (dt, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.87 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.36-3.29 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 319.5

10

20

30

40

【0246】

【表 2 1】

表 1. (続き)

209.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(3-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (bs, 1H), 7.31 (td, 1H), 7.04-6.84 (m, 5H), 3.87 (s, 2H), 3.38-3.30 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 303.55
210.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-5-メチル-4-(3-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (bs, 1H), 7.15 (t, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.93-6.89 (m, 2H), 6.82-6.75 (m, 2H), 3.80 (s, 2H), 3.35-3.30 (m, 2H), 2.95-2.88 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 299.5
211.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-5-メチル-4-(4-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (bs, 1H), 7.07 (d, 2H), 7.00 (d, 2H), 6.79-6.74 (m, 2H), 3.78 (s, 2H), 3.39-3.30 (m, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H), (M+1): 299.5
212.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-5-メチル-4-(2-メチルベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.19-7.17 (m, 1H), 7.14-7.09 (m, 2H), 6.86-6.84 (m, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.47 (d, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.28-3.21 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 299.6
213.	N'-(4-(2-クロロベンジル)-2-フルオロ-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.76 (bs, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.24 (dt, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.87 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.36-3.29 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 320.05
214.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(2-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (bs, 1H), 7.29-7.23 (m, 1H), 7.19-7.14 (m, 1H), 7.13-7.05 (m, 2H), 6.79 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.39-3.30 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 303.55
215.	N'-(2,5-ジメチル-4-(Z)-(メチルイミノ)(オトリル)メチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.63 (bs, 1H), 7.29-6.97(m, 4H), 6.73 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.08-3.04 (s, 3H), 2.95 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.14 (td, 3H); (M+1): 322.25
216.	N-エチル-N'-(4-(3-フルオロベンジル)-5-メチル-2-(メチルスルホニル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.38-7.31 (m, 1H), 7.01-7.06 (m, 1H), 6.98-6.92 (m, 3H), 3.99 (s, 2H), 3.46-3.44 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.18 (t, 3H); (M+1): 363.45
217.	メチルN-(2-ブromo-4-(4-ブromoベンジル)-3,6-ジメチルフェニル)ホルムイミデート	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.78 (bs, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.08-7.04 (m, 3H), 3.93 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), (M+1): 411.85
218.	N'-(4-(3-クロロベンジル)-5-メチル-2-(メチルスルホニル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.34 (t, 1H), 7.26-7.28 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 3.99 (s, 2H), 3.47-3.35 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.18 (t, 3H); (M+1): 379.40

【0247】

10

20

30

40

50

【表 2 2】

表 1. (続き)

2 1 9.	N' - (2-ブromo-3, 6-ジメチル-4-(2-メチルベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.37 (bs, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.13-7.09 (m, 2H), 6.77-6.71 (m, 2H), 3.91 (s, 2H), 3.39-3.28 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.11 (s, 3H); (M+1): 374.45
2 2 0.	N' - (2-クロロ-4-(2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル)-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.72-7.61 (m, 4H), 6.85 (d, 1H), 6.24 (s, 1H), 3.99 (s, 2H), 3.42-3.31 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 387.40
2 2 1.	N' - (2-シクロプロピル-4-(2-フルオロベンジル)-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.62 (bs, 1H), 7.27-7.21 (m, 1H), 7.18-7.13 (m, 1H), 7.11-7.06 (m, 1H), 6.97 (td, 1H), 6.55 (s, 1H), 6.43 (s, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.27-2.22 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), 0.86-0.76 (m, 2H), 0.48 (m, 2H); (M+1): 325.60
2 2 2.	N' - (2-シクロプロピル-5-メチル-4-(4-メチルベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.58 (bs, 1H), 7.03 (d, 2H), 6.94 (d, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 3.75 (s, 2H), 3.45-3.35 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.26-2.20 (m, 4H), 2.04 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.82-0.77 (m, 2H), 0.53-0.47 (m, 2H); (M+1): 321.65
2 2 3.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2-シクロプロピル-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.61 (s, 1H), 7.45-7.41 (m, 1H), 7.24-7.19 (m, 2H), 6.89-6.86 (m, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.33 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.46-3.26 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.25-2.20 (m, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.79-0.75 (m, 2H), 0.44-0.41 (m, 2H); (M+1): 341.55
2 2 4.	N' - (2-シクロプロピル-5-メチル-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.62 (bs, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.15-7.10 (m, 2H), 7.03 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.48 (s, 1H), 3.88 (s, 2H), 3.50-3.31 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.32-2.28 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 1.11 (t, 3H), 0.84-0.78 (m, 2H), 0.52-0.49 (m, 2H); (M+1): 391.55
2 2 5.	N-エチル-N' - (2-フルオロ-4-(4-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.92 (bs, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.11 (d, 2H), 7.04-6.98 (m, 3H), 4.00 (s, 2H), 3.47-3.36 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.16-1.09 (m, 3H); (M+1): 353.55
2 2 6.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.93 (bs, 1H), 7.51-7.41 (m, 1H), 7.40-7.35 (m, 1H), 7.33-7.27 (m, 2H), 7.06-7.03 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.47-3.33 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 374.35
2 2 7.	N-エチル-N' - (2-フルオロ-4-(2-フルオロベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.92 (bs, 1H), 7.37-7.32 (m, 1H), 7.31-7.21 (m, 1H), 7.21-7.16 (m, 1H), 7.15-7.11 (m, 1H), 7.08-7.04 (m, 1H), 6.92 (d, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.44-3.31 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 357.55

【 0 2 4 8】

10

20

30

40

50

【表 2 3】

表 1. (続き)

2 2 8.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(2-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.92 (bs, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.22-7.13 (m, 3H), 6.93-6.90 (m, 1H), 6.62 (d, 1H), 4.01 (s, 2H), 3.54-3.45 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 353.55
2 2 9.	N'-(4-(3-クロロベンジル)-2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.94 (bs, 1H), 7.37-7.27 (m, 3H), 7.19 (s, 1H), 7.15-7.09 (m, 2H), 4.07 (s, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 374.35
2 3 0.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(3-フルオロベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.94 (bs, 1H), 7.38-7.32 (m, 2H), 7.12 (d, 1H), 7.07-7.02 (m, 1H), 6.98-6.92 (m, 2H), 4.08 (s, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 357.55
2 3 1.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(3-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.94 (bs, 1H), 7.36-7.31 (m, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.05-6.91 (m, 4H), 4.01 (s, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.16 (s, 3H); (M+1): 353.55
2 3 2.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.95 (bs, 1H), 7.60-7.52 (m, 2H), 7.49 (s, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.16 (d, 1H), 4.17 (s, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 407.50
2 3 3.	N-エチル-N'-(2-フルオロ-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.94 (bs, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.35 (t, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.17-7.12 (m, 3H), 4.12 (s, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 423.50
2 3 4.	N-エチル-N-メチル-N'-(5-メチル-4-(2-メチルベンジル)-2-(メチルスルホニル)フェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.17-7.09 (m, 2H), 6.99 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.45-3.35 (m, 5H), 2.91 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.19 (t, 3H); (M+1): 359.50
2 3 5.	N-エチル-N-メチル-N'-(5-メチル-4-(4-メチルベンジル)-2-(メチルスルホニル)フェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.87 (bs, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.10 (d, 2H), 7.01 (d, 2H), 6.94 (d, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.35-3.47 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.13-1.18 (t, 3H); (M+1): 359.45
2 3 6.	N'-(5-クロロ-4-(シアノ(5-フルオロ-2-メチルフェニル)メチル)-2-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.33 (dd, 2H), 7.16 (td, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.96-7.02 (m, 1H), 5.86 (s, 1H), 3.46-3.34 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.08 (t, 3H); (M-1): 356.00
2 3 7.	メチル2-(2-クロロ-4-(エチル(メチル)アミノ)メチレン)アミノ)-5-メチルフェニル)-2-(3-クロロフェニル)アセテート	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.69 (s, 1H), 7.39-7.32 (m, 2H), 7.29 (s, 1H), 7.20 (dt, 1H), 6.91 (d, 2H), 5.37 (s, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 394.75

【0 2 4 9】

10

20

30

40

50

【表 2 4】

表 1. (続き)

2 3 8.	N' - (4 - (1 - (4 - プロモフェニル) ビニル) - 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.52-7.48 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.84 (s, 1H), 5.24 (s, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 391.00
2 3 9.	2 - (2 - クロロ - 4 - ((エチル (メチル) アミノ) メチレン) アミノ) - 5 - メチルフェニル) - 2 - (3 - フルオロフェニル) - N, N - ジメチルプロパンアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (s, 1H), 7.37-7.31 (m, 1H), 7.08 (td, 1H), 6.99-7.03 (m, 2H), 6.92 (d, 2H), 3.35-3.46 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.93 (s, 1.12 (t, 3H), (M+1): 404.50
2 4 0.	2 - (2 - クロロ - 4 - ((エチル (メチル) アミノ) メチレン) アミノ) - 5 - メチルフェニル) - 2 - (5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N, N - ジメチルアセトアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.73 (s, 1H), 7.25 (dd, 1H), 7.04-6.92 (m, 2H), 6.73 (s, 1H), 6.56 (dd, 1H), 5.50 (s, 1H), 3.44-3.23 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 2.65 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), (M+1): 405.05
2 4 1.	N' - (5 - クロロ - 4 - ((4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) (シアノ) メチル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.92 (s, 1H), 7.55-7.45 (m, 2H), 7.38-7.28 (m, 2H), 7.01-6.92 (m, 1H), 5.92 (s, 1H), 3.52-3.40 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.12-1.05 (m, 3H)
2 4 2.	N' - (2, 5 - ジフルオロ - 4 - (2 - フルオロベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.85 (bs, 1H), 7.31-7.12 (m, 4H), 6.96-6.85 (m, 2H), 3.89 (s, 2H), 3.43-3.32 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 1.07 (t, 3H); (M+1): 307.5
2 4 3.	N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジフルオロフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (bs, 1H), 7.33-7.29 (m, 1H), 7.25 (t, 2H), 7.16 (d, 1H), 7.07 (dd, 1H), 6.89-6.83 (m, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.44-3.33 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 1.13-1.06 (m, 3H); (M+1): 324
2 4 4.	N' - (2, 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (bs, 1H), 7.08-7.05 (m, 4H), 6.96 (dd, 1H), 6.84 (dd, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.06 (t, 3H); (M+1): 303.55
2 4 5.	N' - (2, 5 - ジフルオロ - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.83 (bs, 1H), 7.16 (t, 1H), 7.00-6.96 (m, 4H), 6.85 (dd, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.13-1.06 (m, 3H); (M+1): 303.55
2 4 6.	N' - (4 - (2 - クロロベンジル) - 5 - シアノ - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77 (bs, 1H), 7.50-7.45 (m, 1H), 7.34-7.22 (m, 3H), 7.18-7.16 (m, 1H), 6.98 (s, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.45-3.36 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 326.4
2 4 7.	N' - (5 - シアノ - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 2 - メチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77 (bs, 1H), 7.32-7.27 (m, 1H), 7.23-7.13 (m, 4H), 7.10 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.14 (t, 3H), (M+1): 310.35
2 4 8.	N' - (5 - シアノ - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.80 (bs, 1H), 7.25-7.12 (m, 4H), 6.95 (t, 2H), 4.02 (s, 2H), 3.41 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.14 (t, 3H), (M+1): 306.55

【 0 2 5 0 】

10

20

30

40

50

【表 2 5】

表 1. (続き)

2 4 9.	N' - (4 - (3-クロロベンジル) - 5-シアノ-2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77 (bs, 1H), 7.34 (td, 1H), 7.29-7.27 (m, 2H), 7.23 (d, 2H), 7.19 (m, 1H), 4.04 (s, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.14 (t, 3H); (M+1): 327
2 5 0.	N' - (5-シアノ-4 - (3-フルオロベンジル) - 2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.79 (bs, 1H), 7.40-6.98 (m, 6H), 4.00 (s, 2H), 3.45-3.33 (m, 2H), 3.04 (m, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), (M+1): 310.5
2 5 1.	N' - (5-シアノ-2-メチル-4 - (3-メチルベンジル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75(bs, 1H), 7.39-7.00 (m, 6H), 4.00 (s, 2H), 3.50-3.35 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.33 (s, 6H), 1.24 (t, 3H), (M+1): 306.6
2 5 2.	N' - (5-シアノ-2-メチル-4 - (4-メチルベンジル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.76 (bs, 1H), 7.40-7.09 (m, 6H), 3.97 (s, 2H), 3.44-3.36 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.30 (s, 6H), 1.24 (t, 3H); (M+1): 306.6
2 5 3.	N' - (4 - (2-クロロベンジル) - 2, 5-ジフルオロフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.84 (bs, 1H), 7.46-7.43 (m, 1H), 7.31-7.20 (m, 3H), 6.86 (dd, 2H), 3.96 (s, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 1.06 (t, 3H); (M+1): 324
2 5 4.	N' - (2, 5-ジフルオロ-4 - (2-メチルベンジル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.84 (bs, 1H), 7.17-7.09 (m, 3H), 7.04-7.01 (m, 1H), 6.89 (dd, 1H), 6.72 (dd, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.29 (m, 3H), 1.06 (t, 3H); (M+1): 303.55
2 5 5.	N' - (5-クロロ-4 - (2-クロロベンジル) - 2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR ¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.49-7.24 (m, 3H), 7.04-6.87 (m, 3H), 4.03 (s, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.33 (m, 3H), 1.24-1.11 (m, 3H); (M+1): 336.45
2 5 6.	N' - (5-クロロ-4 - (2-フルオロベンジル) - 2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.68 (bs, 1H), 7.30-7.24 (m, 1H), 7.20-7.06 (m, 3H), 6.97 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.34 (s, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.13 (t, 3H); (M+1): 319.5
2 5 7.	N' - (5-クロロ-2-メチル-4 - (2-メチルベンジル) フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.39-7.07 (m, 2H), 6.91-6.87 (m, 3H), 6.77 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.24 (t, 3H); (M+1): 316.05
2 5 8.	N' - (5-クロロ-4 - (3-クロロベンジル) - 2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.72 (bs, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.24-7.22 (m, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.86 (s, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.40-3.25 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 336.45
2 5 9.	N' - (5-クロロ-4 - (3-フルオロベンジル) - 2-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (bs, 1H), 7.30 (td, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.01-6.92 (m, 3H), 6.86 (s, 1H), 3.95 (s, 2H), 3.40-3.24 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.16 (t, 3H); (M+1): 319.5

10

20

30

40

【 0 2 5 1】

【表 2 6】

表 1. (続き)

2 6 0.	N' - (5-クロロ-2-メチル-4-(3-メチルベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.16-7.12 (m, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.00-6.93 (m, 3H), 6.84 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.40-3.24 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.11 (t, 3H); (M+1): 316.05
2 6 1.	N' - (5-クロロ-2-メチル-4-(4-メチルベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.05 (dd, 4H), 6.99 (d, 1H), 6.83 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.37-3.24 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 315.5
2 6 2.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-2-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.80 (bs, 1H), 7.49-7.47 (m, 1H), 7.29-7.25 (m, 2H), 7.09 (s, 1H), 6.87 (d, 1H), 6.44 (s, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.47-3.37 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.34-2.15 (m, 1H), 1.13 (t, 3H), 0.89 (d, 2H), 0.49 (d, 2H); (M+1): 395.05
2 6 3.	N' - (2-シクロプロピル-4-(3-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.17-6.84 (m, 5H), 6.62 (s, 1H), 4.00 (s, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.41-2.30 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.34-1.12 (t, 3H), 0.86-0.93 (m, 2H), 0.59-0.52 (m, 2H); (M+1): 375.55
2 6 4.	N' - (2-シクロプロピル-4-(4-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.06 (d, 2H), 7.01-6.98 (m, 1H), 6.94 (d, 2H), 6.60 (s, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.39 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), 0.91-0.87 (m, 2H), 0.57-0.53 (m, 2H); (M+1): 375.6
2 6 5.	N' - (4-(3-クロロベンジル)-2-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77 (bs, 1H), 7.31-7.27 (m, 1H), 7.23 (dd, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.01 (d, 2H), 6.67 (s, 1H), 4.01 (s, 2H), 3.46-3.34 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.41 (m, 1H), 1.13 (t, 3H), 0.94-0.89 (m, 2H), 0.62-0.58 (m, 2H); (M+1): 396
2 6 6.	N' - (2-シクロプロピル-4-(3-フルオロベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.77 (bs, 1H), 7.30 (td, 1H), 7.03-6.97 (m, 2H), 6.89 (d, 1H), 6.86-6.83 (m, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.02 (s, 2H), 3.46-3.34 (m, 2H), 2.96 (d, 3H), 2.40 (d, 1H), 1.13 (t, 3H), 0.93-0.89 (m, 2H), 0.61-0.58 (m, 2H); (M+1): 379.55
2 6 7.	N' - (2-シクロプロピル-4-(4-シクロプロピルベンジル)-3,6-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.41 (bs, 1H), 6.97 (d, 4H), 6.76 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.33 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.88-1.81 (m, 1H), 1.58-1.54 (m, 1H), 1.13 (t, 3H), 0.92-0.85 (m, 4H), 0.62-0.58 (m, 2H), 0.26 (td, 2H); (M+1): 361.65
2 6 8.	N' - (2-シクロプロピル-4-(2-メチルベンジル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.80 (bs, 1H), 7.20-7.07 (m, 4H), 6.77 (d, 1H), 6.33 (s, 1H), 3.97 (s, 2H), 3.46-3.37 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.36 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.24-1.13 (m, 3H), 0.84-0.89 (m, 2H), 0.40 (dd, 2H); (M+1): 375.45

10

20

30

40

【0 2 5 2】

【表 27】

表 1. (続き)

269.	N' - (2, 5-ジフルオロ-4-(3-フルオロベンジル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.84(bs, 1H), 7.37-7.31 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 6.91-6.85 (m, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.46-3.36 (m, 2H), 2.95 (s, 3H), 1.15 (t, 3H); (M+1): 307.5
270.	N' - (4-(2-クロロベンジル)ナフタレン-1-イル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.49 (bs, 1H), 7.86-7.76 (m, 2H), 7.52-7.39 (m, 3H), 7.31-7.14 (m, 2H), 7.05-6.73 (m, 3H), 4.42 (s, 2H), 3.58-3.38 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 1.18 (t, 3H); (M+1): 337.45
271.	N-エチル-N-メチル-N' - (4-(2-メチルベンジル)ナフタレン-1-イル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.47 (s, 1H), 7.87-7.74 (m, 2H), 7.47-7.41 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 1H), 7.12 (t, 1H), 7.03 (t, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.80 (d, 2H), 4.29 (s, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.17 (m, 3H); (M+1): 317.6
272.	N' - (2-クロロ-4-(シアノ(3-(トリフルオロメチル)フェニル)メチル)-5-メチルフェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド塩酸塩	¹ H-NMR(400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 12.71 (s, 1H), 8.18 (bs, 1H), 7.70-7.41 (m, 6H), 5.46 (s, 1H), 3.80-3.23 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.18 (t, 3H); (M+1): 394.05
273.	N-エチル-N-メチル-N' - (5-メチル-4-(3-メチルベンジル)-2-(メチルスルホニル)フェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.88 (bs, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.38-7.31 (m, 1H), 7.01-7.06 (m, 1H), 6.98-6.91 (m, 3H), 3.99 (s, 2H), 3.46-3.34 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.10 (s, 3H); 1.13-1.18 (m, 3H); (M+1):359.45
274.	N-エチル-N' - (4-(2-フルオロベンジル)-5-メチル-2-(メチルスルホニル)フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.88 (bs, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.33-7.27 (m, 1H), 7.22-7.09 (m, 3H), 6.97 (d, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.47-3.33 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.18 (t, 3H);(M+1):363.45
275.	N' - (4-(2-クロロベンジル)-5-メチル-2-(メチルスルホニル)フェニル) - N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.48-7.45 (m, 1H), 7.32-7.28 (m, 3H), 7.08-7.06 (m, 1H), 6.98 (d, 1H), 4.01 (s, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 2.94 (m, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.17 (t, 3H); (M+1): 379.45
276.	N-エチル-N-メチル-N' - (5-メチル-2-(メチルスルホニル)-4-(3-(トリフルオロメチル)ベンジル)フェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.57-7.49 (m, 4H), 7.40 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.46-3.38 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.12-1.17 (t, 3H); (M+1): 413.45
277.	N-エチル-N-メチル-N' - (5-メチル-2-(メチルスルホニル)-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル)ホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.89 (bs, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.14-7.10 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 4.02 (s, 2H), 3.46-3.32 (m, 5H), 2.94 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.17 (t, 3H); (M+1): 429.50
278.	N-エチル-N' - (5-フルオロ-2-メチル-4-(3-(トリフルオロメトキシ)ベンジル)フェニル) - N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (bs, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.17-7.14 (m, 2H), 7.00 (d, 1H), 6.40 (d, 1H), 3.89 (s, 2H), 3.40-3.34 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.10 (t, 3H); (M+1): 369.40

* Chemdraw Professional 16.0を使用して生成した化合物名

【0253】

表 2 は、R^x、R^y、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹およびAが定義されている、一般式(Ia)の化合物を提供する。

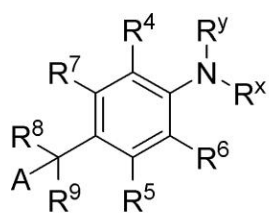
10

20

30

40

【化 6】



(Ia)

【 0 2 5 4 】

10

20

30

40

50

【表 2 8】

表 2.

シリアル 番号	化合物名	分析データ
1.	N' - (2-ブロモ-4-(4-クロロベンゾイル)-3, 6-ジメチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.70 (dt, 2H), 7.58-7.62 (m, 2H), 7.42 (bs, 1H), 7.08 (s, 1H), 3.46 - 3.30 (s, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.11-1.20 (m, 3H), (M+1): 408.8
2.	N' - (4-シクロプロピル-2, 5-ジメチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.54 (bs, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.48-3.19 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.78-1.74 (m, 1H), 1.10 (t, 3H), 0.83-0.78 (m, 2H), 0.48 (td, 2H); (M+1): 231.2
3.	N' - (4-ブロモ-2-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)フェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.75 (bs, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.46-2.41 (m, 1H), 1.15 (s, 3H), 0.96 (m, 2H), 0.75-0.71 (m, 2H), (M+1): 350.95
4.	N' - (4-ブロモ-2-フルオロ-5-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.74 (bs, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.01-6.97 (m, 1H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.98 (m, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.14-1.07 (m, 3H); (M+1): 275
5.	N' - (4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.85 (bs, 1H), 7.50-7.46 (m, 1H), 7.14-7.07 (m, 1H), 3.39 (m, 2H), 3.00 (s, 3H), 1.17-1.07 (m, 3H), (M+1): 279
6.	N' - (4-ブロモ-5-クロロ-2-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.71 (bs, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.03 (s, 1H), 3.33-3.43 (sm, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.12 (t, 3H), (M+1): 290
7.	N' - (4-ブロモ-5-シアノ-2-メチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	(M+1): 280.20
8.	N' - (2, 5-ジメチルフェニル) -N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	(M+1): 190.2
9.	4-(4-クロロベンジル)-2, 5-ジメチルアニリン	(M+1): 245.80
10.	2, 5-ジメチル-4-(4-(メチルチオ)ベンジル)アニリン	(M+1): 257.6
11.	4-(3, 5-ジクロロベンジル)-2, 5-ジメチルアニリン	(M+1): 280.2
12.	2-ブロモ-4-(4-ブロモベンジル)-3, 6-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.83 (s, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.84 (s, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)
13.	4-(3-クロロベンジル)-2, 5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.27 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.18-7.22 (m, 1H), 7.05-7.08 (m, 2H), 6.71 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 4.61 (s, 2H), 3.76 (s, 2H), 1.97 (d, J = 14.5 Hz, 6H)
14.	4-(2-フルオロベンジル)-2, 5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.21 (ddd, J = 15.3, 5.6, 1.8 Hz, 1H), 7.04-7.15 (m, 2H), 6.98 (td, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 6.62 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 4.59 (s, 2H), 3.74 (s, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.96 (d, J = 11.3 Hz, 3H)

10

20

30

40

【0255】

【表 2 9】

表 2. (続き)

15.	4-(3-プロモベンジル)-2,5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.32-7.34 (m, 1H), 7.18-7.22 (m, 2H), 7.09 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.40 (s, 1H), 4.60 (s, 2H), 3.75 (s, 2H), 1.98 (s, 6H)
16.	4-(2-クロロベンジル)-2,5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.43 (dd, J = 5.6, 3.6 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 5.8, 3.5 Hz, 2H), 6.91 (dd, J = 5.4, 3.7 Hz, 1H), 6.50 (d, J = 42.8 Hz, 2H), 4.63 (s, 2H), 3.82 (s, 2H), 1.98 (d, J = 17.3 Hz, 6H)
17.	2-クロロ-4-(2-クロロベンジル)-5-メチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.45 (dd, J = 6.6, 1.8 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.94 (s, 1H), 6.59 (s, 1H), 5.10 (s, 2H), 3.76 (s, 2H), 2.01 (s, 3H)
18.	2-クロロ-4-(2-フルオロベンジル)-5-メチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.22-7.26 (m, 1H), 7.03-7.18 (m, 3H), 6.83 (s, 1H), 6.61 (s, 1H), 5.10 (s, 2H), 3.78 (s, 2H), 2.06 (s, 3H)
19.	4-(3-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.27 (dd, J = 14.4, 7.8 Hz, 1H), 6.91-6.97 (m, 2H), 6.84 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 6.70 (s, 1H), 6.40 (s, 1H), 4.60 (s, 2H), 3.76 (s, 2H), 2.00 (dd, J = 14.5, 5.2 Hz, 6H)
20.	4-(3-クロロ-4-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルアニリン	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.19-7.29 (m, 2H), 7.04-7.08 (m, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.40 (s, 1H), 4.61 (s, 2H), 3.73 (s, 2H), 1.97 (s, 6H)
21.	N'-(4-プロモ-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	(M+1):269.2
22.	N-(2-クロロ-5-メチル-4-(4-(トリフルオロメチル)チオ)ベンジル)フェニル)ホルムアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.80-9.77 (m, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.63 (d, 2H), 7.33-7.26 (m, 3H), 4.00 (s, 2H), 2.15 (d, 3H); (M+1): 357.90
23.	N-(4-(2-フルオロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)アセトアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.17 (s, 1H), 7.24-7.04 (m, 5H), 6.86 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 2.01 (s, 3H); (M+1): 272.3
24.	N'-(4-プロモ-2-シクロプロピル-5-メチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.72 (s, 1H), 3.40-3.20 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.28-2.18 (m, 4H), 1.11 (t, 3H), 0.86-0.82 (m, 2H), 0.59-0.52 (m, 2H); (M+1): 296.75
25.	N'-(2-シクロプロピル-5-メチル-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド	¹ H-NMR(400 MHz, DMSO-d ₆) δ 7.65 (bs, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 3.39-3.41 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.27-2.19 (m, 1H), 1.29-1.22 (m, 12H), 1.12 (t, 3H), 0.79-0.85 (m, 2H), 0.47-0.51 (m, 2H); (M+1): 343.25

* Chemdraw Professional 16.0を使用して生成した化合物名

【0256】

一般式(I)によって、ならびに/または表1および2において定義されている本発明の化合物は、公知の方法で、スキーム1~4に記載されている様々な方法で調製することができる。

10

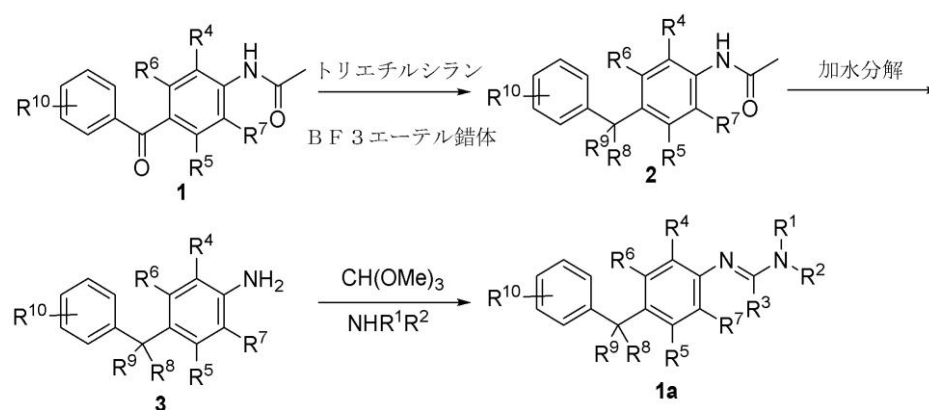
20

30

40

50

【化 7】
スキーム 1



10

【0257】

式1aの化合物は、US 20110130282に明記されている通り、式3の化合物をオルトギ酸トリメチルにより処理し、次いで様々な二級アミン(HNR¹R²)との反応によって合成することができる。

【0258】

化合物1は、式1aの化合物の合成の重要な中間体である。以下などの、式1の化合物を合成する文献に様々な方法が記載されている。

20

方法1: Helvitachimica Act XXIX (1946年)、1413~1424頁およびTetrahedron、56巻(2000年)、7199~7203頁に記載されている、ジクロロメタンの存在下での触媒ZnCl₂またはAlCl₃を使用する、対応する塩化ベンゾイルから。

【0259】

方法2: (a) Tetrahedron、56巻(2000年)、7199~7203頁に記載されている、トリフルオロメタンスルホン酸; (b) Synthesis、13巻(2004年)、2165~2168頁に記載されている、グラファイトおよびメタンスルホン酸; (c) Helvetica Chimica act、88巻(2005年) 2282~2287頁に記載されている、グラファイトおよびp-トルエンスルホン酸; (d) Synthesis、10巻(2000年)、1427~1430頁に記載されている、1-パーフルオロブタンスルホン酸などの酸触媒の存在下、対応する安息香酸から。

30

【0260】

方法3: Green chemistry、4巻(2002年)、129~133頁、またはTetrahedron、56巻(2000年)、663~6465頁またはBulletin chemical society of Jpn、73巻(2000年)、2325~2333頁に記載されている、トリフルオロメタンスルホン酸銅、トリフルオロメタンスルホン酸ガリウム、またはトリフルオロメタンスルホン酸アンチモン、またはトリフルオロメタンスルホン酸イッテルビウム、またはトリフルオロメタンスルホン酸スカンジウム、またはトリフルオロメタンスルホン酸ビスマスなどのトリフルオロメタンスルホン酸金属塩の存在下で、安息香酸の対応する誘導体から。

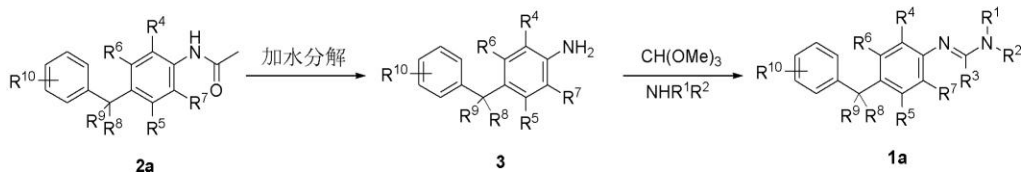
40

【0261】

方法4: Tetrahedron letters 49巻(2008年)、6715~6719頁に記載されている、そのまま、またはシリカゲルに吸着させたP₂O₅の存在下、対応する置換安息香酸から。

50

【化 8】
スキーム 2

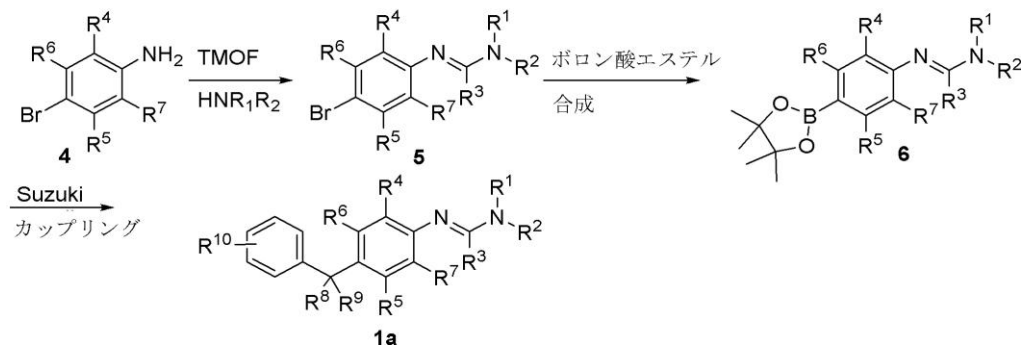


【 0 2 6 2 】

式 1 a の化合物は、適切に置換されている 2 a を使用し、スキーム 1 に記載されているものと同じ方法に従い合成することができる。対応する中間体 2 a は、(J . O r g . C h e m . 1 9 8 3 年、4 8 巻、4 0 9 7 ~ 9 8 頁、J . O r g . C h e m . 1 9 8 3 年、4 8 巻、4 0 8 7 ~ 4 0 9 6 頁) に記載されている通り、フェニルアセトニトリルから、水酸化ナトリウムまたはナトリウム *tert* -ブトキシドまたは水素化ナトリウムのような塩基の存在下、次いで水性 K O H の存在下での H ₂ O ₂ / m C P B A による酸化によって合成することができる。

10

【化 9】
スキーム 3



20

【 0 2 6 3 】

式 1 a の化合物はまた、B i o o r g a n i c & M e d i c i n a l C h e m i s t r y L e t t e r s 、1 4 巻 (4 号) 、1 0 2 3 ~ 1 0 2 6 頁 ; 2 0 0 4 年 に明記されている通り、式 6 の化合物を対応する置換ベンジルハロゲン化物により処理することによる S u z u k i 反応を使用して合成することができる。

30

【 0 2 6 4 】

式 6 の化合物は、ジオキサン中、酢酸パラジウムおよび P d C l ₂ (d p p f) D C M 錯体を使用して、ブロモ誘導体 5 をビス (ピンコラト) ジボランにより処理することによって、良好な収率で合成することができる。

【化 10】
スキーム 4



40

【 0 2 6 5 】

式 1 の化合物は、S y n t h e s i s 、1 3 巻、(2 0 0 7 年) 、1 9 7 0 ~ 1 9 8 0 頁に記載されている通り、炭酸ナトリウムのような塩基、パラジウムをベースとする触媒

50

、およびドデシル硫酸ナトリウムなどの界面活性剤の存在下、式 7 を有するフェニルボロン酸誘導体を式 8 の化合物（X は、カルボン酸の活性体、例えば塩化物であり、Y は、ニトロ基または NHCOCH_3 基などのアミン基の前駆体を表す）で処理することによって合成することができる。

【0266】

本発明は、以下の非限定例にさらに例示されている。新規化合物の構造は、NMR および/または以下に提示されている他の適切な分析によって確認した。

【実施例 1】

【0267】

N' - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

10

工程 A : N - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド

ジクロロメタン (15 ml) 中の N - (4 - (3, 5 - ジクロロベンゾイル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.9 g, 2.68 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (2.78 ml, 17.40 mmol) を加えた。この反応混合物を 10 分間、攪拌した。この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (2.090 g, 14.72 mmol) を滴下して加えた。この反応混合物を室温で 36 時間、攪拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 x 200 ml) により抽出した。合わせた有機相を無水 Na_2SO_4 により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の N - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.7 g) が固体として得られた。LCMS (M + H) 323.23

20

【0268】

工程 B : 4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン

水 (10 ml) : エタノール (10 ml) 中の N - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.9 g, 2.79 mmol) の懸濁液に、水酸化ナトリウム (3.35 g, 84 mmol) を投入し、この反応混合物を 36 時間、加熱して還流した (100)。反応の完了後、この反応混合物をジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na_2SO_4 により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の 4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.4 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 281.29

30

【0269】

工程 C : N' - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.017 g, 0.089 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (10.00 ml) 中の 4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.500 g, 1.784 mmol) の溶液を 103 で 4 時間、攪拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、これを次に、1, 4 - ジオキサン (10 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1.551 ml, 17.84 mmol) を加え、この反応混合物を 2 時間、103 まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望の N' - (4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.210 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 350.35, ^1H - NMR (400 MHz, DMSO - d6) 7.61 (bs, 1H), 7.40 (t, , 1H), 7.12 (d, , 2H), 6.90 (s, 1

40

50

H), 6.58 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.49 - 3.32 (bs, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)

【実施例 2】

【0270】

N' - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

工程 A: N - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミドの調製

ジクロロメタン (30 ml) 中の N - (4 - (4 - ブロモベンゾイル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (1.5 g, 4.33 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (3.02 g, 26.0 mmol) を加えた。この反応物を 10 分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (3.69 g, 26.0 mmol) を滴下して加えた。添加の完了後、この反応混合物を室温で 36 時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 × 200 ml) により抽出した。合わせた有機 (organic) 相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン: 酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の N - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.7 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 333.24

【0271】

工程 B: 4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリンの調製

エタノール (21 ml) - 水 (9 ml) 中の (4 - アミノ - 2, 5 - ジメチルフェニル) (4 - ブロモフェニル) メタノン (0.7 g, 2.301 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (3.87 g, 69.0 mmol) を投入し、反応混合物を 36 時間、加熱して還流した (100)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン: 酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の 4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.45 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 291.20

【0272】

工程 C: N' - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.013 g, 0.069 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (15.00 ml) 中の 4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.4 g, 1.378 mmol) の溶液を 103 で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体を得られ、次にこれを、1, 4 - ジオキサン (15 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1.198 ml, 13.78 mmol) を加え、この反応混合物を 103 で 2 時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物を得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン: 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望の N' - (4 - (4 - ブロモベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.4 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, クロロホルム - D) 7.42 (bs, 1H), 7.35 (d, 2H), 6.98 (d, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.84 (s, 2H), 3.59 - 3.18 (bs, 2H), 3.01 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.21 (t, 3H)

【実施例 3】

【0273】

N' - (4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程A: N - (4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミドの調製

ジクロロメタン (30 ml) 中の N - (4 - (3, 4 - ジクロロベンゾイル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.6 g, 1.785 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (1.245 g, 10.71 mmol) を加えた。この反応混合物を 10 分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (1.520 g, 10.71 mmol) を滴下して加えた。添加の完了後、反応混合物を室温で 36 時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 × 200 ml) により抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の N - (4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (0.4 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 323.23

10

【0274】

工程B: 4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリンの調製

エタノール (10 ml) - 水 (3 ml) 中の (4 - アミノ - 2, 5 - ジメチルフェニル) (3, 4 - ジクロロフェニル) メタノン (0.5 g, 1.700 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (2.86 g, 51.0 mmol) を投入し、反応混合物を 36 時間、加熱して還流した (100 °)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の 4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.2 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 281.20

20

【0275】

工程C: N' - (4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

30

p - トルエンスルホン酸一水和物 (5.09 mg, 0.027 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (10.00 ml) 中の 4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.150 g, 0.535 mmol) の溶液を 103 ° で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、次にこれを、1, 4 - ジオキサン (10 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (0.465 ml, 5.35 mmol) を加え、反応混合物を 103 ° で 2 時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望の N' - (4 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.13 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.60 (bs, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.09 (dd, 8.0 Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.48 - 3.30 (bs, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.11 (t, 3H).

40

【実施例4】

【0276】

N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程A: N - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミド

50

ジクロロメタン (30 ml) 中の N - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンゾイル) フェニル) アセトアミド (1.5 g, 5.33 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (2.98 g, 25.6 mmol) を加えた。10 分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (4.16 g, 29.3 mmol) を滴下して加えた。添加の完了後、反応混合物を室温 (room temperature) で 36 時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 × 200 ml) により抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の N - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミド (0.8 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 268.37

【0277】

工程 B : 2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) アニリンの調製

エタノール (21 ml) - 水 (9 ml) 中の N - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミド (0.7 g, 2.62 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (4.41 g, 79 mmol) を投入し、この反応混合物を 36 時間、加熱して還流した (100 °)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の 2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) アニリン (0.4 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 226.34

【0278】

工程 C : N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.013 g, 0.067 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (10 ml) 中の 2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) アニリン (0.3 g, 1.331 mmol) の溶液を 103 ° で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、これを次に、1, 4 - ジオキサン (10 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1.157 ml, 13.31 mmol) を加え、反応混合物を 103 ° で 2 時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物が得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望の N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (3 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.160 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.58 (bs, 1H), 7.13 (t, 7.6 Hz, 1H), 6.96 (d, 7.9 Hz, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.89 (d, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.42 (bs, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.10 (2s, 6H), 1.11 (t, 3H)

【実施例 5】

【0279】

N' - (4 - (4 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程 A : N - (4 - (4 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミドの調製

ジクロロメタン (40 ml) 中の N - (4 - (4 - クロロベンゾイル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (1.8 g, 5.96 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (4.16 g, 35.8 mmol) を加えた。この反応混合物を 10 分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (5.08 g, 35.8 mmol)

1) を滴下して加えた。添加の完了後、反応混合物を室温で36時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン(3×200ml)により抽出した。合わせた有機相を無水Na₂SO₄により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望のN-(4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)アセトアミド(1.5g)が固体として得られた。LCMS(M+H)288.79.

【0280】

工程B：4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルアニリンの調製

10

エタノール(21ml)-水(9ml)中のN-(4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)アセトアミド(1.3g、4.52mmol)の懸濁液に、水酸化カリウム(7.60g、136mmol)を投入し、この反応混合物を36時間、加熱して還流した(100)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水Na₂SO₄により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルアニリン(0.8g)が固体として得られた。LCMS(M+H)246.75

【0281】

20

工程C：N'-(4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミドの調製

p-トルエンスルホン酸一水和物(0.027g、0.142mmol)を含むオルトギ酸トリメチル(10.00ml)中の4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルアニリン(0.7g、2.85mmol)の溶液を103で4時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、これを次に、1,4-ジオキサン(10ml)に溶解した。N-エチルメチルアミン(2.476ml、28.5mmol)を加え、この反応混合物を2時間、103まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物が得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望のN'-(4-(4-クロロベンジル)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド(0.3g)がガム状物として得られた。¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆) 7.66-7.43(bs, 1H), 7.30(d, 2H), 7.14-7.08(d, 2H), 6.85(s, 1H), 6.54(s, 1H), 3.82(s, 2H), 3.47-3.32(bs, 2H), 2.99-2.79(s, 3H), 2.09(s, 3H), 2.06(s, 3H), 1.10(t, 3H)

30

【実施例6】

【0282】

N'-(2,5-ジメチル-4-(4-(メチルチオ)ベンジル)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムイミドアミド

40

工程A：N-(2,5-ジメチル-4-(4-(メチルチオ)ベンジル)フェニル)アセトアミドの調製

ジクロロメタン(30ml)中のN-(2,5-ジメチル-4-(4-(メチルチオ)ベンゾイル)フェニル)アセトアミド(1.7g、5.42mmol)の懸濁液に、0でトリエチルシラン(3.78g、32.5mmol)を加えた。この反応物を10分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体(4.62g、32.5mmol)を滴下して加えた。添加の完了後、この反応混合物を室温で36時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン(3×200ml)により抽出した。合わせた有機相を無水Na₂SO₄により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エ

50

チルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望のN - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) アセトアミド (0 . 7 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 297 . 90

【 0 2 8 3 】

工程B : 2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) アニリンの調製

エタノール (21 ml) - 水 (9 ml) 中のN - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) アセトアミド (0 . 7 g , 2 . 338 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (3 . 93 g , 70 . 1 mmol) を投入し、この反応混合物を36時間、加熱して還流した (100) 。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水Na₂SO₄により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン : 酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) アニリン (0 . 4 g) が固体として得られた。LCMS (M + H) 256 . 90

【 0 2 8 4 】

工程C : N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0 . 011 g , 0 . 058 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (10 ml) 中の2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) アニリン (0 . 3 g , 1 . 166 mmol) の溶液を103 で4時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、これを次に、1 , 4 - ジオキサン (10 . 00 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1 . 013 ml , 11 . 66 mmol) を加え、この反応混合物を103 で2時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン : 酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望のN' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0 . 21 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz , DMSO - d₆) 7 . 59 - 7 . 44 (bs , 1 H) , 7 . 12 (d , 2 H) , 7 . 01 (d , 2 H) , 6 . 83 - 6 . 78 (s , 1 H) , 6 . 51 (s , 1 H) , 3 . 75 (s , 2 H) , 3 . 42 - 3 . 30 (bs , 2 H) , 2 . 87 (s , 3 H) , 2 . 39 (s , 3 H) , 2 . 06 (s , 3 H) , 2 . 05 (s , 3 H) , 1 . 07 (t , 3 H)

【 実施例 7 】

【 0 2 8 5 】

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程A : N - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミドの調製

ジクロロメタン (30 ml) 中のN - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンゾイル) フェニル) アセトアミド (1 . 4 g , 4 . 98 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (3 . 47 g , 29 . 9 mmol) を加えた。この反応混合物を10分間、撹拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エーテル錯体 (4 . 24 g , 29 . 9 mmol) を滴下して加えた。添加の完了後、反応混合物を室温で36時間、撹拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 × 200 mL) により抽出した。合わせた有機相を無水Na₂SO₄により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン : 酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望のN - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミド (0 . 9 g) が固体として得られた。LCMS (M + H) 268 . 37

10

20

30

40

50

【0286】

工程B：2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) アニリンの調製

エタノール (21 ml) - 水 (9 ml) 中の N - (2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) アセトアミド (0.7 g、2.62 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (4.41 g、79 mmol) を投入し、反応混合物を36時間、加熱して還流した (100)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na_2SO_4 により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) アニリン (0.28 g) がガム状物として得られた。LCMS (M + H) 226.37

10

【0287】

工程C：N' - (2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.013 g、0.067 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (10 ml) 中の2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) アニリン (0.3 g、1.331 mmol) の溶液を103 で4時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体を得られ、これを次に、1，4 - ジオキサン (10 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1.157 ml、13.31 mmol) を加え、この反応混合物を103 で2時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物を得られ、次にこれを、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望のN' - (2，5 - ジメチル - 4 - (4 - メチルベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.160 g) がガム状物として得られた。 ^1H - NMR (400 MHz, DMSO - d6) 7.56 (bs, 1H), 7.04 (d, 2H), 6.97 (d, 2H), 6.82 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.33 (bs, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.14 - 2.04 (2s, 6H), 1.10 (t, 3H)

20

【実施例8】

【0288】

30

N' - (2 - ブロモ - 4 - (4 - ブロモベンジル) - 3，6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程Aおよび工程Bは、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

【0289】

工程C：N' - (2 - ブロモ - 4 - (4 - ブロモベンジル) - 3，6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.013 g、0.068 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (30.0 ml) 中の4 - (ブロモ - (4 - ブロモフェニル) メチル) - 2，5 - ジメチルアニリン (0.5 g、1.355 mmol) の溶液を103 で4時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体を得られ、これを次に、1，4 - ジオキサン (30 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (1.178 ml、13.55 mmol) を加え、反応混合物を103 で2時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物を得られ、次に、これを溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望のN' - (2 - ブロモ - 4 - (4 - ブロモベンジル) - 3，6 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.2 g) がガム状物として得られた。 ^1H - NMR (400 MHz, DMSO - d6) 7.45 (d, 2H), 7.40 - 7.23 (bs, 1H), 7.05 (d, 2H), 6.96 (s, 1H), 3.96 - 3.86 (s, 2H), 3.50 - 3.36 (bs, 1H), 3.29 - 3.19 (bs, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.11 (b

40

50

s, 3 H)

【実施例 9】

【0290】

N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程 A : N - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミドの調製

ジクロロメタン (40 ml) 中の N - (4 - (3 - クロロベンゾイル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (3.8 g, 12.59 mmol) の懸濁液に、0 でトリエチルシラン (8.05 g, 69.3 mmol) を加えた。この反応混合物を 10 分間、
 10 攪拌した後、この反応混合物に三フッ化ホウ素エチルエーテル錯体 (8.04 g, 56.7 mmol) を滴下して加えた。添加後、この反応混合物を室温で 36 時間、攪拌した。反応の完了後、この反応混合物を固体炭酸水素ナトリウムで中和し、次に、ジクロロメタン (3 x 200 ml) により抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。この混合物をろ過して、減圧下で濃縮した。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の N - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (2.5 g) が固体として得られた。LCMS (M + H) 288.79

【0291】

工程 B : 4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリンの調製

エタノール (80 ml) - 水 (20 ml) 中の N - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) アセトアミド (4.6 g, 15.98 mmol) の懸濁液に、水酸化カリウム (26.9 g, 480 mmol) を投入し、反応混合物を 36 時間、加熱して還流した (100)。反応の完了後、この反応混合物を室温まで冷却し、ジクロロメタンにより抽出した。合わせた有機相を無水 Na₂SO₄ により脱水した。次に、この混合物をろ過して、減圧下で蒸発させた。次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用する、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって残留物を精製すると、所望の 4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (2.5 g) が固体として得られた。LCMS (M + H) 246.75

【0292】

工程 C : N' - (4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.031 g, 0.163 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (30.0 ml) 中の 4 - (3 - クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルアニリン (0.8 g, 3.26 mmol) の溶液を 103 で 4 時間、攪拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると中間体得られ、これを次に、1, 4 - ジオキサン (30 ml) に溶解した。N - エチルメチルアミン (2.83 ml, 32.6 mmol) を加え、この反応混合物を 103 で 2 時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物が得られ、これを次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望の N' - (4 - (3 -
 40 クロロベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.3 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.68 - 7.42 (bs, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 3.85 (s, 2H), 3.49 - 3.34 (bs, 1H), 3.32 - 3.19 (bs, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)

【実施例 10】

【0293】

N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N -

10

20

30

40

50

エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) アニリン (0 . 3 g 、 1 . 0 3 7 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 5 m l) 溶液に p - トルエンスルホン酸一水和物 (0 . 0 2 0 g 、 0 . 1 0 4 m m o l) を加え、100 で4時間、加熱した。反応の完了後、揮発物を蒸発させた。この残留物を1 , 4 - ジオキサン (1 5 . 0 0 m l) に溶解し、N - エチルメチルアミン (0 . 2 7 0 m l 、 3 . 1 1 m m o l) を加えた。この反応混合物を100 で4時間、加熱し、反応の完了後、ジオキサンを蒸発させて、残留物に分取 H P L C による精製を施すと、N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルホニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (2 4 0 m g) がガム状物として得られた。1 H N M R (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) = 7 . 8 1 (d , 2 H ,) , 7 . 5 5 (b s , 1 H) , 7 . 3 6 (d , 2 H ,) , 6 . 8 9 (s , 1 H) , 6 . 5 6 (s , 1 H) , 3 . 9 5 (s , 2 H) , 3 . 3 5 - 3 . 2 9 (m , 2 H) , 3 . 1 5 (s , 3 H) , 2 . 9 0 (s , 3 H) , 2 . 1 0 (s , 3 H) , 2 . 0 8 (s , 3 H) , 1 . 1 0 (t , 3 H ,) ; L C M S (M + H) 3 5 9 . 1 5

【実施例 1 1】

【0294】

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルチオ) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0 . 3 g 、 0 . 9 1 9 m m o l) のエタノール (5 m l) 溶液に、oxone (0 . 2 8 2 g 、 0 . 9 1 9 m m o l) を加え、65 で2時間、加熱した。反応の完了後、この反応混合物をろ過して、ろ液を蒸発させると残留物が得られ、次に、これをカラムにより精製すると、N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 - (メチルスルフィニル) ベンジル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0 . 2 5 g) が得られた。1 H N M R (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 5 7 - 7 . 5 5 (m , 3 H) , 7 . 2 9 (d , 2 H ,) , 6 . 8 8 (s , 1 H) , 6 . 5 5 (s , 1 H) , 3 . 9 0 (s , 2 H) , 3 . 3 5 - 3 . 2 9 (m , 2 H) , 2 . 9 0 (s , 3 H) , 2 . 6 8 (s , 3 H) , 2 . 0 9 (s , 3 H) , 2 . 0 8 (s , 3 H) , 1 . 1 0 (t , 3 H ,) ; L C M S (M + H) 3 4 3 . 2 0

【実施例 1 2】

【0295】

N' - [4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - メチルイミドホルムアミド

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N' - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミドの調製

4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (1 . 5 g 、 4 . 8 7 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (0 . 9 2 6 g 、 4 . 8 7 m m o l) を加え、103 で4時間、撹拌した。次に、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体を得られた。この中間体に、1 , 4 - ジオキサン (1 0 . 0 0 m l) およびメチルアミン (2 0 . 0 2 m l 、 4 0 . 0 m m o l) を加えた。この反応混合物を再度、2 . 0 時間、103 まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、粗生成物を得られた。ヘキサン：酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーでこの粗生成物を精製すると、所望の N' - (4

10

20

30

40

50

- (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド (4 0 0 m g) がガム状物として得られた。¹ H - NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 6 1 (s , 1 H) , 7 . 5 6 - 7 . 4 9 (m , 1 H) , 7 . 0 5 (t , 1 H) , 7 . 0 3 - 6 . 9 6 (m , 1 H) , 6 . 8 1 (s , 1 H) , 6 . 6 1 (s , 1 H) , 3 . 8 8 (s , 2 H) , 3 . 6 4 - 3 . 5 7 (m , 4 H) , 3 . 5 4 - 3 . 3 4 (4 H) , 2 . 1 1 (s , 3 H) , 2 . 0 7 (s , 3 H)

【実施例 1 3】

【 0 2 9 6 】

N ' - [2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル] - N - メチルイミドホルムアミド

10

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N ' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミドの調製

2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルアニリン (1 . 0 g 、 4 . 0 0 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (0 . 0 3 8 g 、 0 . 2 0 0 m m o l) を加え、1 0 3 で 4 時間、撹拌した。次に、反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体を得られた。この中間体に、1 , 4 - ジオキサン (1 0 . 0 0 m l) およびメチルアミン (2 0 . 0 2 m l 、 4 0 . 0 m m o l) を加えた。この反応混合物を再度、2 時間、1 0 3 に加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、粗生成物を得られた。ヘキサン：酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N ' - (2 - クロロ - 4 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - メチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド (6 0 0 m g) がガム状物として得られた。¹ H - NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 6 0 (d , 1 H) , 7 . 3 1 (t d , 1 H) , 7 . 2 2 - 7 . 1 2 (1 H) , 7 . 0 9 (s , 1 H) , 7 . 0 5 - 6 . 8 8 (m , 3 H) , 6 . 7 2 (s , 1 H) , 3 . 8 8 (s , 2 H) , 2 . 7 7 (d , 3 H) , 2 . 1 0 (s , 3 H)

20

【実施例 1 4】

【 0 2 9 7 】

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチル - N - [(Z) - モルホリン - 4 - イルメチリデン] アニリン

30

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミンの調製

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (0 . 3 g 、 1 . 1 3 7 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (1 0 . 8 2 m g 、 0 . 0 5 7 m m o l) を加え、1 0 3 で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物を得られ、これを 1 , 4 - ジオキサン (1 0 . 0 0 m l) に溶解した。モルホリン (0 . 9 9 1 m l 、 1 1 . 3 7 m m o l) を加え、反応混合物を再度、2 時間、1 0 3 まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、残留物を得られた。溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーによってこれを精製すると、所望の N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン (2 7 0 m g) がガム状物として得られた。¹ H - NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 6 1 (s , 1 H) , 7 . 3 7 - 7 . 2 6 (m , 1 H) , 7 . 2 4 (d d , 1 H) , 7 . 1 5 - 7 . 0 0 (m , 1 H) , 6 . 8 8 (s , 1 H) , 6 . 6 0 (s , 1 H) , 3 . 8 3 (s , 2 H) , 3 . 6 8 - 3 . 5 5 (m , 4 H) , 3 . 4 4 (b r , 4 H) , 2 . 1 0 (s , 3 H) , 2 . 0 7 (s , 3 H)

40

【実施例 1 5】

【 0 2 9 8 】

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチル - N - [(Z) - ピペリ

50

ジン - 1 - イルメチリデン] アニリン

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミンの調製

4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (0 . 3 g 、 1 . 1 3 7 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (1 0 . 8 2 m g 、 0 . 0 5 7 m m o l) を加え、1 0 3 で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると、残留物が得られた。この残留物に 1 , 4 - ジオキサン (1 0 m l) およびピペリジン (0 . 9 6 9 g 、 1 1 . 3 7 m m o l) を加え、反応混合物を 2 時間、1 0 3 まで加熱した。反応の完了後、揮発物を減圧下で蒸発させると、粗製化合物が得られた。ヘキサン : 酢酸エチルを用いるフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン (3 0 1 m g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 5 3 (s , 1 H) , 7 . 2 9 (d d , 1 H) , 7 . 2 4 (d d , 1 H) , 7 . 1 5 - 7 . 0 0 (m , 1 H) , 6 . 8 6 (s , 1 H) , 6 . 5 6 (s , 1 H) , 3 . 8 2 (s , 2 H) , 3 . 5 9 - 3 . 3 2 (4 H) , 2 . 0 9 (s , 3 H) , 2 . 0 6 (s , 3 H) , 1 . 6 7 - 1 . 5 4 (m , 2 H) , 1 . 5 4 - 1 . 4 1 (m , 4 H)

【実施例 1 6】

【 0 2 9 9 】

4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチル - N - [(Z) - モルホリン - 4 - イルメチリデン] アニリン

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミンの調製

4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (0 . 2 5 g 、 0 . 8 1 1 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (7 . 7 1 m g 、 0 . 0 4 1 m m o l) を加え、1 0 3 で 4 時間、撹拌した。次に、反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体を得られた。この中間体に 1 , 4 - ジオキサン (1 0 m l) およびモルホリン (0 . 7 1 m l 、 8 . 1 1 m m o l) を加え、2 時間、1 0 3 まで加熱した。反応の完了後、揮発物を減圧下で蒸発させると、粗生成物が得られた。ヘキサン : 酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - モルホリノメタンイミン (2 5 0 m g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) 7 . 6 1 (s , 1 H) , 7 . 5 6 - 7 . 4 9 (m , 1 H) , 7 . 0 5 (t , 1 H) , 7 . 0 3 - 6 . 9 6 (m , 1 H) , 6 . 8 1 (s , 1 H) , 6 . 6 1 (s , 1 H) , 3 . 8 8 (s , 2 H) , 3 . 6 4 - 3 . 5 7 (m , 4 H) , 3 . 5 4 - 3 . 3 4 (4 H) , 2 . 1 1 (s , 3 H) , 2 . 0 7 (s , 3 H)

【実施例 1 7】

【 0 3 0 0 】

4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチル - N - [(Z) - ピペリジン - 1 - イルメチリデン] アニリン

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミンの調製

4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (0 . 2 5 g 、 0 . 8 1 1 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (1 0 m l) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (7 . 7 1 m g 、 0 . 0 4 1 m m o l) を加え、1 0 3 で 4 時間、撹拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体を得られた。この中間体に 1 , 4 -

ジオキサン (10 ml) およびピペリジン (0.691 g、8.11 mmol) を加え、この反応混合物を再度、2 時間、103 °C まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、粗生成物が得られた。ヘキサン：酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N - (4 - (3 - ブロモ - 2 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - 1 - (ピペリジン - 1 - イル) メタンイミン (280 mg) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.54 (s, 1H), 7.53 - 7.47 (m, 1H), 7.05 (t, 1H), 7.03 - 6.94 (m, 1H), 6.79 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.59 - 3.32 (4H), 2.10 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.66 - 1.55 (m, 2H), 1.55 - 1.41 (m, 4H)

10

【実施例 18】

【0301】

N - エチル - N' - [4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - メチルイミドホルムアミド

工程 A および工程 B は、上記の実施例に記載されている通りに実施した。

工程 C : N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミドの調製

4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルアニリン (0.3 g、1.308 mmol) のオルトギ酸トリメチル (10 ml) 溶液に、p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.012 g、0.065 mmol) を加え、103 °C で4 時間、撹拌した。次に、反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体得られた。この中間体に1, 4 - ジオキサン (10 ml) および N - エチルメチルアミン (1.137 ml、13.08 mmol) を加え、この反応混合物を再度、2 時間、103 °C まで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると、粗生成物が得られた。ヘキサン：酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N - エチル - N' - (4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド (0.3 g) がガム状物として得られた。

20

【実施例 19】

【0302】

N - エチル - N' - [4 - (3 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - メチルイミドホルムアミド

工程 A : N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 , 4 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロラン - 2 - イル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

N' - (4 - ブロモ - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド (2.7 g、10.03 mmol) の1, 4 - ジオキサン (27 ml) 溶液に、ジボランピナコロン (5.09 g、20.06 mmol) および酢酸カリウム (3.94 g、40.1 mmol) を加えた。窒素ガスを20 分間、パージし、次に、窒素環境下で触媒 PdCl₂ (dppf) - CH₂Cl₂ 付加物 (0.819 g、1.003 mmol) を加え、この反応混合物を2 時間、110 °C まで加熱した。次に、反応混合物を減圧下で濃縮すると、粗生成物が得られた。ヘキサン：酢酸エチルを使用するフラッシュクロマトグラフィーによってこの粗生成物を精製すると、所望の N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 , 4 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロラン - 2 - イル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (2.5 g) がガム状物として得られた。

40

LCMS (M + H) 317.25

【0303】

工程 B : N - エチル - N' - (4 - (3 - メトキシベンジル) - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミドの調製

N' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (4 , 4 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 , 3 , 2 - ジオキ

50

サボロラン - 2 - イル)フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (0.45 g、1.423 mmol)、1 - (ブロモメチル) - 3 - メトキシベンゼン (0.429 g、2.134 mmol) および炭酸カリウム (0.590 g、4.27 mmol) の1, 4 - ジオキサン (10 ml) - 水 (0.01 ml) 溶液に20分間、窒素をパージした。Pd (Ph₃P)₄ (0.164 g、0.142 mmol) を加え、この反応混合物を2時間、110 °Cまで加熱した。反応の完了後、反応混合物を減圧下で濃縮し、分取HPLCにより粗生成物を精製すると、所望のN - エチル - N' - (4 - (3 - メトキシベンジル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド (0.3 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.59 - 7.44 (bs, 1H), 7.12 (d, 2H), 7.01 (d, 2H), 6.83 - 6.78 (s, 1H), 6.51 (s, 1H), 3.75 (s, 2H), 3.42 - 3.30 (bs, 2H), 2.87 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)

10

【実施例20】

【0304】

N - エチル - N' - (4 - (メトキシ(フェニル)メチル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド

p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.029 g、0.154 mmol) を含むオルトギ酸トリメチル (20 ml) 中の(4 - アミノ - 2, 5 - ジメチルフェニル)(フェニル)メタノール (0.7 g、3.08 mmol) の溶液を103 °Cで4時間、撹拌した。次に、反応混合物を減圧下で濃縮すると、中間体を得られた。この中間体に1, 4 - ジオキサン (20 ml) およびN - エチルメチルアミン (2.68 ml、30.8 mmol) を投入し、この反応混合物を再度、2時間、103 °Cまで加熱した。反応の完了後、この反応混合物を減圧下で濃縮すると残留物を得られ、これを次に、溶離液としてヘキサン：酢酸エチルを使用するシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにより精製すると、所望のN - エチル - N' - (4 - (メトキシ(フェニル)メチル) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - メチルホルムイミドアミド (0.4 g) がガム状物として得られた。¹H - NMR (400 MHz, DMSO - d₆) 7.60 (bs, 1H), 7.36 - 7.18 (m, 5H), 7.03 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 5.35 (s, 1H), 3.48 - 3.34 (bs, 1H), 3.32 - 3.24 (bs, 1H), 3.20 (s, 3H), 2.91 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)

20

30

【実施例21】

【0305】

N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド

工程A：N - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)フェニル)アセトアミドの調製

N - (4 - ベンゾイル - 2, 5 - ジメチルフェニル)アセトアミド (1.5 g、5.61 mmol) の無水CH₂Cl₂ (25 ml) 溶液に、エタン - 1, 2 - ジチオール (1.057 g、11.22 mmol) を加え、酢酸 (0.642 ml、11.22 mmol) を0 °Cまで冷却し、次に、三フッ化ホウ素エーテル錯体 (0.782 ml、6.17 mmol) を加えて、反応混合物を室温で一晩、撹拌した。反応混合物をジクロロメタンにより希釈し、次いで、反応混合物をNaOH水溶液に滴下して注ぎ入れることによりクエンチし、混合物を分離し、合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水して濃縮した。粗生成物をカラムクロマトグラフィーによって精製すると、所望のN - (2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)フェニル)アセトアミド (1.8 g) が得られた。LCMS (M + H)⁺ 344.50

40

【0306】

工程B：2, 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)アニ

50

リンの調製：

N - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニル) アセトアミド (2 . 7 5 g , 8 . 0 1 m m o l) のエタノール (2 5 m l) および水 (2 0 . 0 0 m l) 溶液に、水酸化カリウム (8 . 9 8 g , 1 6 0 m m o l) の溶液を加え、反応混合物を 1 5 時間、9 0 で加熱した。反応混合物を減圧下で蒸発させた。残留物を水 (1 5 0 m l) により希釈し、酢酸エチル (3 × 1 5 0 m l) により抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムにより脱水して、濃縮した。粗製化合物をカラムクロマトグラフィーによって精製すると、所望の生成物である 2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) アニリン (1 . 2 g) が得られた。LCMS (M + H) 3 0 2

10

【 0 3 0 7 】

工程 C : N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミドの調製

2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) アニリン (2 7 0 m g , 0 . 8 9 6 m m o l) のオルトギ酸トリメチル (2 5 m l) 溶液に PTSA (1 0 m g) を加え、この反応混合物を 1 0 3 で 4 時間、加熱した。溶媒を減圧下で蒸発させた。この残留物にジオキサン (2 5 . 0 0 m l) を投入し、次いで反応混合物に N - エチルメチルアミン (0 . 7 7 9 m l , 8 . 9 6 m m o l) を加え、反応混合物を 1 0 3 で 2 時間、加熱した。出発原料の完全な変換後、反応混合物を減圧下で濃縮し、粗製化合物を分取 HPLC によって精製すると、所望の N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - (2 - フェニル - 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムイミドアミド (2 2 0 m g) が得られた。¹H - NMR (4 0 0 M H z , DMSO - d 6) 7 . 7 9 (s , 1 H) , 7 . 6 4 (s , 1 H) , 7 . 3 8 (d , 2 H) , 7 . 2 3 - 7 . 2 7 (m , 2 H) , 7 . 1 6 - 7 . 2 0 (m , 1 H) , 6 . 5 2 (s , 1 H) , 3 . 5 1 - 3 . 4 0 (3 H) , 3 . 4 0 - 3 . 3 2 (3 H) , 2 . 9 1 (s , 3 H) , 2 . 2 0 (s , 3 H) , 1 . 7 4 (s , 3 H) , 1 . 1 1 (t , 3 H)

20

【 0 3 0 8 】

本明細書に記載されている通り、一般式 (I) の化合物は、重要な農作物に攻撃をする多数の植物病原菌に関して発揮される非常に高い殺菌活性を示す。以下のうちの 1 つまたは複数に対する、本発明の化合物の活性を評価した：

30

【 0 3 0 9 】

生物試験の実施例 (インビトロ試験)

実施例 1 : ピリキュラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*) (イモチ病) : 化合物を 0 . 3 % DMSO に溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む 5 m l の培地を 6 0 m m の滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した 5 m m サイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、2 5 の温度および 6 0 % 相対湿度で 7 日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、3 0 0 p p m の化合物 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、54、55、56、57、58、59、60、61、63、64、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、92、93、94、95、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、148、149、15

40

50

0、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、188、189、190、193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、230、231、232、233、234、237、238、239、242、243、244、245、246、247、248、249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、269、270、271および273は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、75%を超える防除をもたらした。

【0310】

実施例2：リゾクトニア・ソラニ（イネ鞘枯病／ジャガイモ黒あざ病）：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、25の温度および60%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、300ppmの化合物1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、39、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、54、55、56、57、58、59、60、61、63、66、67、68、69、70、71、72、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、92、93、94、95、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、189、191、193、196、197、198、199、200、201、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、230、231、232、239、243、244、245、246、247、248、249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、259、261、262、263、264、265、267、269、270、271および273および33は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、80%を超える防除をもたらした。

【0311】

実施例3：ボトリティス・シネレア（*Botrytis cinerea*）（灰色かび病）：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、22の温度および90%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試

10

20

30

40

50

験において、300ppmの化合物1、3、4、5、6、7、8、9、10、11、13、14、15、16、17、18、21、22、23、26、27、28、29、30、32、35、37、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、63、65、66、67、69、70、71、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、92、93、94、95、97、98、99、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、113、114、116、117、118、119、120、121、123、124、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、149、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、189、190、191、193、195、196、197、198、199、200、201、204、206、207、208、209、210、211、212、213、214、217、219、220、221、222、223、224、225、230、232、233、234、235、236、238、239、242、244、245、246、247、248、249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、269、270、271、272および273は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、80%超をもたらした。

【0312】

実施例4：アルテルナリア・ソラニ（トマト/ジャガイモの夏疫病）：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロス寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、25℃の温度および60%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、300ppmの化合物1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、37、39、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、63、66、67、68、69、70、71、72、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、184、185、186、195、196、197、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、218、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、230、231、232、233、234、237、238、239、242、243、244、245、246、247、248、249、250、251、252、253、254、255、256、2

10

20

30

40

50

57、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、269、270、271、272および273は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、75%を超える防除をもたらした。

【0313】

実施例5：コレトリクム・カプシシ (*Colletotrichum capsici*) (炭疽病)：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、25℃の温度および60%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、300ppmの化合物1、3、4、5、6、7、8、9、10、11、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、25、26、27、28、29、30、32、34、35、37、39、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、57、58、59、60、63、66、67、69、70、71、72、74、75、76、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、92、93、94、95、99、100、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、142、143、144、145、146、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、184、185、186、195、196、197、198、199、200、201、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、220、221、222、223、225、239、243、245、246、249、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、269および270は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、80%を超える防除をもたらした。

【0314】

実施例6：セプトリア・リコペルシシ (*Septoria lycopersici*) (トマトの斑点病)：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、25℃の温度および70%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、300ppmの化合物1、3、4、5、6、7、8、9、13、14、15、16、17、18、20、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、37、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、63、64、66、67、68、69、70、71、72、74、81、82、83、84、86、92、93、94、102、104、105、106、108、109、110、111、112、113、114、116、117、118、128、129、130、131、133、134、135、138、139、142、143、144、145、146、154、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、185、186、195、196、197、198、199、200、201、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、220、221、222、223、224、225、228、229、243、244、245、246、248、249、2

50、252、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、270および271は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、70%を超える防除をもたらした。

【0315】

実施例7：フサリウム・クルモルム（穀物の裾腐病）：化合物を0.3% DMSOに溶解し、次に、ペトリ皿に分注する直前に、ポテトデキストロース寒天培地に加えた。所望の濃度で化合物を含む5mlの培地を60mmの滅菌ペトリプレートに分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している有毒培養プレートの外縁から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを成育箱中、25℃の温度および60%相対湿度で7日間、温置し、肥大成長を測定した。これらの試験において、300ppmの化合物1、4、5、6、7、9、11、14、15、16、17、18、22、23、26、27、28、29、30、31、32、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、63、66、67、68、69、70、71、72、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、87、92、93、94、99、104、105、108、109、110、111、112、113、114、117、118、119、120、121、129、132、136、137、138、139、142、143、144、145、146、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、165、167、169、170、171、172、173、174、175、176、178、179、180、181、185、186、189、196、197、198、199、200、201、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、220、221、222、223、224、225、239、249、250、252、253、256、257、258、259、260、261、262、263、269および271は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、75%の防除をもたらした。

【0316】

生物試験実施例（温室）

実施例A：イネにおけるピリキュラリア・オリザエ

化合物を2% DMSO / アセトンに溶解し、次に、50mlの較正済みスプレー体積になるまで水と混合した。この50mlのスプレー溶液をさらに施用するためスプレーボトルに注ぎ入れた。

【0317】

化合物の予防活性を試験するため、温室で育てた健全な若いイネ実生 / 植物に、ホローコーンノズルを使用して、明記した施用量においてスプレー用キャビネット内で活性化化合物の調製物をスプレーした。処理して1日後、 1.4×10^6 のピリキュラリア・オリザエ接種材料を含有する孢子懸濁液（滅菌水）を植物に接種した。次に、病害発現のため、接種済み植物を24℃の温度および95%相対湿度の温室チャンバに維持した。

【0318】

化合物の成績の目視評価は、処理した植物に対して、施用後3、7、10および15日目に病害重症度（0～100%のスケール）を等級付けすることによって行った。処理での病害等級を未処理対象と比較することによって、化合物の有効性（%防除）を計算した。スプレーした植物は、壊死、萎黄病および成長阻害のような症状を記録することによって、化合物の植物毒性作用についても評価した。これらの試験において、500ppmの化合物26、44、48、51、63、87、93、94、96、103、110、112、120、133、135、148、149および183は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、70～100%の防除をもたらした。これらの化合物のいずれも、イネ農作物に対していかなる植物毒性も示さなかった。

【0319】

実施例B：コムギにおけるフサリウム・クルモルムの試験

化合物を2% DMSO / アセトンに溶解し、次に、50mlの較正済みスプレー体積に

なるまで水と混合した。この 50 ml のスプレー溶液をさらに施用するためスプレーボトルに注ぎ入れた。

【0320】

化合物の予防活性を試験するため、温室で育てた健常な若いコムギ植物に、ホローコーンノズルを使用して、明記した施用量においてスプレー用キャビネット内で活性化化合物の調製物をスプレーした。処理して1日後、 2×10^6 のフサリウム・クルモルム接種材料を含有する孢子懸濁液（2%麦芽）を植物に接種した。次に、病害発現のため、接種済み植物を 24 の温度および 80 ~ 90 % 相対湿度の温室チャンバに維持した。

【0321】

化合物の成績の目視評価は、処理した植物に対して、施用後 3、7、10 および 15 日目に病害重症度（0 ~ 100 % のスケール）を等級付けすることによって行った。処理での病害等級を未処理対象と比較することによって、化合物の有効性（% 防除）を計算した。スプレーした植物は、壊死、萎黄病および成長阻害のような症状を記録することによって、化合物の植物毒性作用についても評価した。これらの試験において、500 ppm の化合物 1、7、12、13、16、17、18、19、22、23、28、30、32、33、35、41、42、57、75、76、77、81、96、101、136、149、157、160、172 および 183 は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、70 ~ 100 % の防除をもたらした。これらの化合物のいずれも、コムギ農作物に対していかなる植物毒性も示さなかった。

10

【0322】

実施例 C：トマトにおけるボトリティス・シネラ（*Botrytis cinerea*）試験

化合物を 2 % DMSO / アセトンに溶解し、次に、50 ml の校正済みスプレー体積になるまで水と混合した。この 50 ml のスプレー溶液をさらに施用するためスプレーボトルに注ぎ入れた。

20

【0323】

化合物の予防活性を試験するため、温室で育てた健常な若いマメノチリ植物に、ホローコーンノズルを使用して、明記した施用量においてスプレー用キャビネット内で活性化化合物の調製物をスプレーした。処理して1日後、 1.2×10^6 のボトリティス・シネラ接種材料を含有する孢子懸濁液（2%麦芽）を植物に接種した。次に、病害発現のため、接種済み植物を 18 ~ 20 の温度および 90 ~ 100 % 相対湿度の温室チャンバに維持した。

30

【0324】

化合物の成績の目視評価は、処理した植物に対して、施用後 3、7、10 および 15 日目に病害重症度（0 ~ 100 % のスケール）を等級付けすることによって行った。処理での病害等級を未処理対象と比較することによって、化合物の有効性（% 防除）を計算した。スプレーした植物は、壊死、萎黄病および成長阻害のような症状を記録することによって、化合物の植物毒性作用についても評価した。これらの試験において、500 ppm の化合物 1、2、3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、14、15、17、18、19、22、23、24、25、27、28、29、31、32、40、43、59、90、94、101、102、103、104、105、133、166、170、179、180 および 184 は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、70 ~ 100 % の防除をもたらした。これらの化合物のいずれも、トマト作物に対していかなる植物毒性も示さなかった。

40

【0325】

実施例 D：トマトにおけるアルテルナリア・ソラニ試験

化合物を 2 % DMSO / アセトンに溶解し、次に、50 ml の校正済みスプレー体積になるまで水と混合した。この 50 ml のスプレー溶液をさらに施用するためスプレーボトルに注ぎ入れた。

【0326】

化合物の予防活性を試験するため、温室で育てた健常な若いトマト植物に、ホローコー

50

ンノズルを使用して、明記した施用量においてスプレー用キャビネット内で活性化合物の調製物をスプレーした。処理して1日後、 0.24×10^6 のアルテルナリア・ソラニ接種材料を含有する孢子懸濁液（2%麦芽）を植物に接種した。次に、病害発現のため、接種済み植物を22～24の温度および90～95%相対湿度の温室チャンバに維持した。
【0327】

化合物の成績の目視評価は、処理した植物に対して、施用後3、7、10および15日目に病害重症度（0～100%のスケール）を等級付けすることによって行った。処理での病害等級を未処理対象と比較することによって、化合物の有効性（%防除）を計算した。スプレーした植物は、壊死、萎黄病および成長阻害のような症状を記録することによって、化合物の植物毒性作用についても評価した。これらの試験において、500 ppmの化合物2、8、9、23、25、27、29、31、32、35、36、40、41、42、48、50、68、71、97、115、128、160、161、170、174、175、176、178、179、180および180は、広範囲にわたる病害発生を示した未処理照合品に比べると、70～100%の防除をもたらした。これらの化合物のいずれも、トマト作物に対していかなる植物毒性も示さなかった。

10

【0328】

以下の表3は、先行技術（WO200046184）において報告された化合物と本発明の化合物との比較分析を示している。

【0329】

20

30

40

50

【表 3 0】

表 3.

化合物	用量/ ppm	<u>PYRIOR</u>	<u>RHIZO</u>	<u>BOTRCI</u>	<u>ALTESO</u>	<u>COLLCA</u>	<u>CORYCA</u>	<u>FUSACU</u>
		%阻害						
比較化合物：N'－(4－(シアノ(3－(トリフルオロメチル)フェニル)メチル)－2,5－ジメチルフェニル)－N, N－ジメチルホルムイミドアミド	300	100	80.9	77.3	79.8	41.3	58.7	0
本発明の化合物：N'－(4－ベンジル－2－クロロ－5－メチルフェニル)－N－エチル－N－メチルホルムイミドアミド	300	100	100	94.5	100	100	71.2	94.5
本発明の化合物：N'－(4－ベンジル－2,5－ジメチルフェニル)－N－エチル－N－メチルホルムイミドアミド	300	100	100	100	100	100	100	100
本発明の化合物：N'－(2－クロロ－4－(2－フルオロベンジル)－5－メチルフェニル)－N－エチル－N－メチルホルムイミドアミド	300	100	100	100	100	100	100	100
本発明の化合物：N－エチル－N'－(4－(2－フルオロベンジル)－2,5－ジメチルフェニル)－N－メチルホルムイミドアミド	300	100	100	100	100	100	100	100
本発明の化合物：N'－(4－(シアノ(3－(トリフルオロメチル)フェニル)メチル)－2,5－ジメチルフェニル)－N－エチル－N－メチルホルムイミドアミド	300	100	100	100	100	100	64.4	0

【 0 3 3 0】

10

20

30

40

50

【表 3 1】

表 4.

病原体の科学名	病原体のEPPOコード
アルタナリア・ソラニ (<i>Alternaria solani</i>)	ALTESO
ボトリティス・シネレア (<i>Botrytis cinerea</i>)	BOTRCI
コレトトリクム・カプシシ (<i>Colletotrichum capsici</i>)	COLLCA
ピリキュラリア・オリザエ (<i>Pyricularia oryzae</i>)	PYRIOR
リゾクトニア・ソラノ (<i>Rhizoctonia solano</i>)	RHIZSO
フサリウム・クルモルム (<i>Fusariumculmorum</i>)	FUSACU
コリネスポラ・カッシイコラ (<i>Corynespora cassicola</i>)	CORYCA

10

【0331】

上記の比較および分析から、本発明の化合物は、予想外なことに、比較化合物の生物活性と比較すると、試験した病原体に対して一層高い生物活性を示すと結論付けることができる。

20

【0332】

ある種の好ましい態様を参照して本発明を記載したが、本明細書の考察から、他の態様が当業者には明白となろう。物質と方法のどちらも、本発明の範囲から逸脱することなく、多数の修正を行うことができることは当業者に明白であろう。

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

A 0 1 P 3/00

C 0 7 D 295/13 (2006.01)

C 0 7 D 295/13

ネコ スカイパーク, エー - 1 0 2

(72)発明者 モア マヘシュ パラカス

インド共和国 マハーラーシュトラ, ディストリクト アフマドナガー, タルカ - コパルガウン, エーノビー - ナテガアン

(72)発明者 デサイ アビナッシュ

インド共和国 5 0 0 0 7 6 テランガーナ, ハイバラバード, マラプूर, ブラフマ プリ コロニー, エイチ . エヌオー 1 - 6 - 4 0 - 1 1 / エー

(72)発明者 ケイル マノージ ガナパト

インド共和国 4 2 5 0 0 2 マハーラーシュトラ, ジャルガウン, ニュー バグワン ナガー, 1 5 / 3

(72)発明者 マンジュナサ サウラー ジー

インド共和国 5 6 0 0 7 8 バンガロール, ジェー पी ナガー セブンス フェーズ, プリゲード ガーデニア, ゴールデンマジック, イー - 7 1 4

(72)発明者 ヴェンカテッシュ ハガラバディー エム

インド共和国 5 6 0 0 7 2 バンガロール, ナガーバウイ ロード, バイレーブシュワラナガー, セカンド メイン ロード, ナンバー 8

(72)発明者 アウトカール サントーシュ シュリダール

インド共和国 4 4 4 3 0 2 マハーラーシュトラ, ディストリクト アコラ, タルカ バラプル, ポスト ビアラ

(72)発明者 ガーグ ルチ

インド共和国 2 2 1 0 1 0 ウッター プラデーシュ, ワーラーナシー, マームアガンジ, トウルシプル, 3 8 / 4 7 シー - 1 - ケー

(72)発明者 サマンタ ジャティン

インド共和国 7 4 3 3 4 7 ウェスト ベンガル, パーガナス, サウス 2 4, ポリス ステーション パタル プラティマ, ポスト ダーパチャッティ, ビレッジ ヒンタムニプル, ハリ パダ サマンタ内

(72)発明者 クラウゼナー アレクサンダー ジー . エム .

ドイツ連邦共和国 5 0 2 5 9 プルハイム, シフゲスウェグ 1 8

(72)発明者 ボシュアーニー コンスタンティン

ドイツ連邦共和国 4 0 2 3 3 デュッセルドルフ, メンデルスゾーンシュトラッセ 2 5

合議体

審判長 阪野 誠司

審判官 富永 保

審判官 齊藤 真由美

(56)参考文献 特表 2 0 0 2 - 5 3 6 3 5 4 号公報 (J P , A)

特表 2 0 1 0 - 5 2 0 9 0 1 号公報 (J P , A)

特表 2 0 1 0 - 5 2 0 9 0 5 号公報 (J P , A)

米国特許出願公開第 2 0 1 1 / 0 0 8 2 0 3 6 (U S , A 1)

特表 2 0 2 0 - 5 1 3 4 1 3 (J P , A)

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

A 0 1 N、A 0 1 P

R E G I S T R Y (S T N)

C A p l u s (S T N)