(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第4639805号
(P4639805)

(45)発行日　平成23年2月23日(2011.2.23)　(24)登録日　平成22年12月10日(2010.12.10)

(51)Int.Cl.		F I		
C07H 17/08	(2006.01)	C07H	17/08	CSPL
A01N 43/24	(2006.01)	A01N	43/24	
A01P 7/04	(2006.01)	A01P	7/04	

請求項の数 8　(全 62 頁)

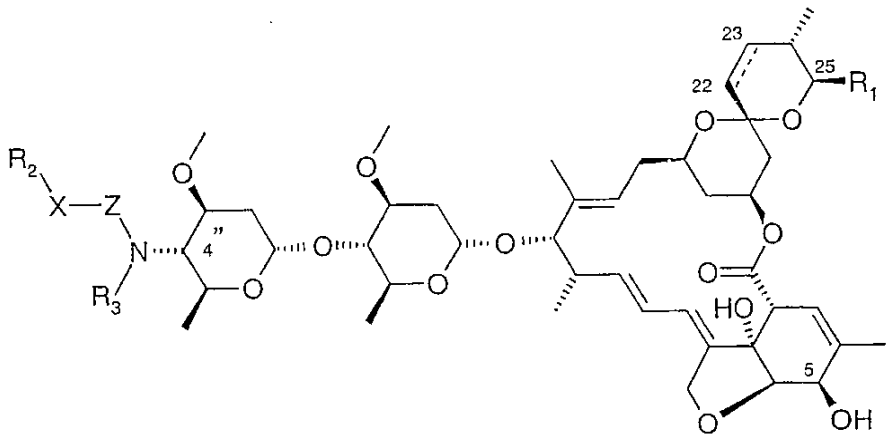
(21)出願番号	特願2004-503482 (P2004-503482)
(86)(22)出願日	平成15年5月6日(2003.5.6)
(65)公表番号	特表2005-530776 (P2005-530776A)
(43)公表日	平成17年10月13日(2005.10.13)
(86)国際出願番号	PCT/EP2003/004740
(87)国際公開番号	WO2003/095468
(87)国際公開日	平成15年11月20日(2003.11.20)
審査請求日	平成18年5月1日(2006.5.1)
(31)優先権主張番号	774/02
(32)優先日	平成14年5月7日(2002.5.7)
(33)優先権主張国	スイス(CH)

(73)特許権者　510298241
メリアル　リミティド
イギリス国，エセックス　シーエム１９　５ティージー，ハーロウ，ハーロウ　ビジネス　パーク，サンドリンガム　アベニュ，サンドリンガム　ハウス
(74)代理人　100099759
弁理士　青木　篤
(74)代理人　100077517
弁理士　石田　敬
(74)代理人　100087871
弁理士　福本　積
(74)代理人　100087413
弁理士　古賀　哲次

最終頁に続く

(54)【発明の名称】４”位にアミノスルホニルオキシ置換基を有するアベルメクチン誘導体

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
４”位にＳ配置を有する式
【化１】



(I)

｛ここで、炭素原子２２位と２３位との間の結合は単結合又は二重結合であり；
R_1はC_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキル；又はC_2－C_{12}アルケニルであり；
R_2はH、C_1－C_{12}アルキル、C_2－C_{12}アルケニル、C_2－C_{12}アルキニル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－C（＝O）－R_5、アリール又はヘテロアリールであり；ここで、当該C_1－C_{12}アルキル、C_2－C_{12}アルケニル、C_2－C_{12}アルキニル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、アリール及びヘテロアリール置換基は、非置換又は一～五置換であってもよい；
R_3はH、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_{12}シクロアルキル、C_2－C_{12}アルケニル又はC_1－C_{12}アルキニルであり；ここで、当該C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_{12}シクロアルキル、C_2－C_{12}アルケニル及びC_2－C_{12}アルキニル置換基は、非置換又は一～五置換であってもよい；
Xは結合、O、NR_4又はSであり；
ZはC＝S又はSO_2であり；
R_4は、H、C_1－C_8アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、ベンジル又は－C（＝O）R_5であり；あるいは
R_2とR_4は一緒に、３～７員のアルキレン又はアルケニレン架橋であり、ここで、当該アルキレン又はアルケニレン架橋は非置換又は一～三置換であり：そして当該３～７員のアルキレン－又はアルケニレン－架橋のメチレン基のうちの１つは、O，NH，S，S（＝O）又はSO_2で置換されてもよく；そして
R_2，R_3及びR_4のもとで定義した上述のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルキレン、アルケニレン、アリール及びヘテロアリール遊離基の置換基は、OH、＝O、ハロゲン、ハロ－C_1－C_2アルキル、CN、NO_2、－N_3、置換されていないか又は１～３個のメチル基で置換されたC_3－C_8シクロアルキル；ノルボルニレニル；置換されていないか又は１～３個のメチル基で置換されたC_3－C_8シクロアルケニル；C_3－C_8ハロシクロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_3－C_8シクロアルキルチオ、C_1－C_{12}ハロアルキルチオ、C_1－C_{12}アルキルスルフィニル、C_3－C_8シクロアルキルスルフィニル、C_1－C_{12}ハロアルキルスルフィニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルフィニル、C_1－C_{12}アルキルスルホニル、C_3－C_8シクロアルキルスルホニル、C_1－C_{12}ハロアルキルスルホニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルホニル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、NH（C_1－C_6アルキル）、N（C_1－C_6アルキル）$_2$、－C（＝O）R_5、－NHC（＝O）R_6、＝NO－C_1－C_6アルキル、－P（＝O）（OC_1－C_6アルキル）$_2$；アリール、ヘテロシクリル、アリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ；並びにアリール、ヘテロシクリル、アリールオキシ及びヘテロシクリルオキシであって、当該環での置換の可能性に依存して、OH、＝O、ハロゲン、CN、NO_2、－N_3、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_{12}ハロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_1－C_{12}ハロアルキルチオ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、ジメチルアミノ－C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、フェノキシ及びフェニル－C_1－C_6アルキルから成る群から選択される置換基によって一～五置換されているもの；置換されていないか、又はハロゲン、メトキシ、トリフルオロメチル及びトリフルオロメトキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で置換されているフェノキシ；置換されていないか、又はハロゲン、メトキシ、トリフルオロメチル及びトリフルオロメトキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で芳香環が置換されているフェニル－C_1－C_6アルコキシ；フェニル－C_2－C_6アルケニル、フェニル－C_2－C_6アルキニル、メチレンジオキシ、－C（＝O）R_5、－O－C（＝O）R_6、－NH－C（＝O）R_6、NH_2、NH（C_1－C_{12}アルキル）、N（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、C_1－C_6アルキルスルフィニル、C_3－C_8シクロアルキルスルフィニル、C_1－C_6ハロアルキルスルフィニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルフィニル、C_1－C_6アルキルスルホニル、C_3－C_8シクロアルキルスルホニル、C_1－C_6ハロアルキルスルホニル及びC_3－C_8ハロシ

クロアルキルスルホニル；から成る群から選択され、
R_5は、H、OH、SH、NH_2、NH（C_1－C_{12}アルキル）、N（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキルC_1－C_{12}ハロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_2－C_8アルケニルオキシ、C_2－C_8アルキニルオキシ；フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、NH－フェニル、N（C_1－C_6アルキル）－フェニル、NH－C_1－C_6アルキル－C（＝O）－R_7、N（C_1－C_6アルキル）－C_1－C_6アルキル－C（＝O）－R_7；又は各々が芳香環内で、ハロゲン、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル及びC_1－C_6ハロアルコキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で置換されているフェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、NH－フェニル又はN（C_1－C_6アルキル）－フェニル；であり、
R_6は、H、C_1－C_{12}アルキル、C_1－C_{12}ハロアルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、フェニル、ベンジル、NH_2、NH（C_1－C_{12}アルキル）、N（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、－NH－フェニル又はN（C_1－C_{12}アルキル）－フェニルであり；そして
R_7は、H、OH、C_1－C_{12}アルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_8アルケニルオキシ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、NH_2、NH（C_1－C_{12}アルキル）、N（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、－NH－フェニル又は－N（C_1－C_{12}アルキル）－フェニルである｝の化合物、
あるいは、Ｅ／Ｚ異性体、Ｅ／Ｚ異性体の混合物又は互変異性体であって、遊離型又は塩型のもの。

【請求項２】
R_2がC_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキルである、式１の、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】
活性成分として、式（Ｉ）の、請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、及び少なくとも１つの補助剤を含んで成る、殺虫組成物。

【請求項４】
害虫の防除方法であって、害虫又はその一部に対して請求項３に記載の組成物を散布することを含んで成る、防除方法。

【請求項５】
請求項３に記載の少なくとも１つの補助剤を含んで成る組成物の調製方法であって、活性成分と補助剤とをよく混合し、そして／あるいはすりつぶすことを含んでなる方法。

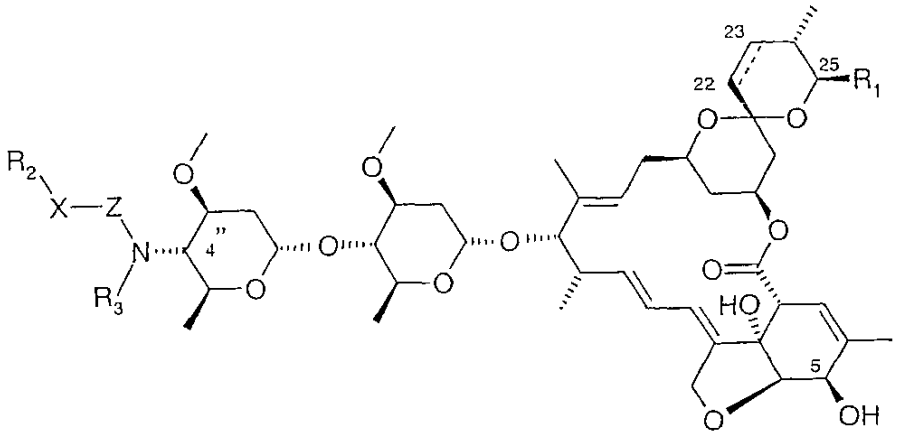
【請求項６】
請求項３に記載の組成物の調製のための、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。

【請求項７】
害虫の防除における請求項３に記載の組成物の使用。

【請求項８】
請求項４に記載の方法であって、植物繁殖材料の保護のために繁殖材料又は繁殖材料の植え付け部位を請求項３に記載の組成物で処理することを含んで成る方法。

【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、４”位にＳ配置を有する式

【化１】



(I)

{ここで、炭素原子２２位と２３位との間の結合は単結合又は二重結合であり；
R_1はC_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキル；又はC_2－C_{12}アルケニルであり；
R_2はH、C_1－C_{12}アルキル、C_2－C_{12}アルケニル、C_2－C_{12}アルキニル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、－C（＝O）－R_5、アリール又はヘテロアリールであり；ここで、当該C_1－C_{12}アルキル、C_2－C_{12}アルケニル、C_2－C_{12}アルキニル、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、アリール及びヘテロアリール置換基は、非置換又は一～五置換であってもよい；
R_3はH、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_{12}シクロアルキル、C_2－C_{12}アルケニル又はC_1－C_{12}アルキニルであり；ここで、当該C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_{12}シクロアルキル、C_2－C_{12}アルケニル及びC_2－C_{12}アルキニル置換基は、非置換又は一～五置換であってもよい；
Xは結合、O、NR_4又はSであり；
ZはC＝O、C＝S又はSO_2であり；
R_4は、H、C_1－C_8アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、ベンジル又は－C（＝O）R_5であり；あるいは
R_2とR_4は一緒に、３～７員のアルキレン又はアルケニレン架橋であり、ここで、当該アルキレン又はアルケニレン架橋は非置換又は一～三置換であり：そして当該３～７員のアルキレン－又はアルケニレン－架橋のメチレン基のうちの１つは、O，NH，S，S（＝O）又はSO_2で置換されてもよく；そして
R_2，R_3及びR_4のもとで定義した上述のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルキレン、アルケニレン、アリール及びヘテロアリール遊離基の置換基は、OH、＝O、ハロゲン、ハロ－C_1－C_2アルキル、CN、NO_2、－N_3、置換されていないか又は１～３個のメチル基で置換されたC_3－C_8シクロアルキル；ノルボルニレニル；置換されていないか又は１～３個のメチル基で置換されたC_3－C_8シクロアルケニル；C_3－C_8ハロシクロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、C_3－C_8シクロアルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_3－C_8シクロアルキルチオ、C_1－C_{12}ハロアルキルチオ、C_1－C_{12}アルキルスルフィニル、C_3－C_8シクロアルキルスルフィニル、C_1－C_{12}ハロアルキルスルフィニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルフィニル、C_1－C_{12}アルキルスルホニル、C_3－C_8シクロアルキルスルホニル、C_1－C_{12}ハロアルキルスルホニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルホニル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、NH（C_1－C_6アルキル）、N（C_1－C_6アルキル）$_2$、－C（＝O）R_5、－NHC（＝O）R_6、＝NO－C_1－C_6アルキル、－P（＝O）（OC_1－C_6アルキル）$_2$；アリール、ヘテロシクリル、アリールオ

キシ、ヘテロシクリルオキシ；並びにアリール、ヘテロシクリル、アリールオキシ及びヘテロシクリルオキシであって、当該環での置換の可能性に依存して、ＯＨ、＝Ｏ、ハロゲン、ＣＮ、NO_2、－N_3、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキル、C_1－C_{12}ハロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_1－C_{12}ハロアルキルチオ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキル、ジメチルアミノ－C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、フェノキシ及びフェニル－C_1－C_6アルキルから成る群から選択される置換基によって一～五置換されているもの；置換されていないか、又はハロゲン、メトキシ、トリフルオロメチル及びトリフルオロメトキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で芳香環が置換されているフェノキシ；置換されていないか、又はハロゲン、メトキシ、トリフルオロメチル及びトリフルオロメトキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で置換されているフェニル－C_1－C_6アルコキシ；フェニル－C_2－C_6アルケニル、フェニル－C_2－C_6アルキニル、メチレンジオキシ、－Ｃ（＝Ｏ）R_5、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）R_6、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）R_6、NH_2、ＮＨ（C_1－C_{12}アルキル）、Ｎ（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、C_1－C_6アルキルスルフィニル、C_3－C_8シクロアルキルスルフィニル、C_1－C_6ハロアルキルスルフィニル、C_3－C_8ハロシクロアルキルスルフィニル、C_1－C_6アルキルスルホニル、C_3－C_8シクロアルキルスルホニル、C_1－C_6ハロアルキルスルホニル及びC_3－C_8ハロシクロアルキルスルホニル；から成る群から選択され、

R_5は、Ｈ、ＯＨ、ＳＨ、NH_2、ＮＨ（C_1－C_{12}アルキル）、Ｎ（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、C_1－C_{12}アルキル、C_3－C_8シクロアルキルC_1－C_{12}ハロアルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_{12}ハロアルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_{12}アルキルチオ、C_2－C_8アルケニルオキシ、C_2－C_8アルキニルオキシ；フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ＮＨ－フェニル、Ｎ（C_1－C_6アルキル）－フェニル、ＮＨ－C_1－C_6アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_7、Ｎ（C_1－C_6アルキル）－C_1－C_6アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_7；又は各々が芳香環内で、ハロゲン、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6ハロアルキル及びC_1－C_6ハロアルコキシから互いに独立して選択される１～３個の置換基で置換されているフェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ＮＨ－フェニル又はＮ（C_1－C_6アルキル）－フェニル；であり、

R_6は、Ｈ、C_1－C_{12}アルキル、C_1－C_{12}ハロアルキル、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、フェニル、ベンジル、NH_2、ＮＨ（C_1－C_{12}アルキル）、Ｎ（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、－ＮＨ－フェニル又はＮ（C_1－C_{12}アルキル）－フェニルであり；そして

R_7は、Ｈ、ＯＨ、C_1－C_{12}アルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_8アルケニルオキシ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、NH_2、ＮＨ（C_1－C_{12}アルキル）、Ｎ（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、－ＮＨ－フェニル又は－Ｎ（C_1－C_{12}アルキル）－フェニルである｝の化合物、

及び、適用可能な場合には、Ｅ／Ｚ異性体、Ｅ／Ｚ異性体の混合物及び／又は互変異性体であって、遊離型又は塩型のもの；

但し、Ｚは、Ｘが結合であり、R_2がＣＨ$_3$又は２－アミノエチルであり、R_3が水素であり、炭素原子２２位と２３位との間の結合が二重結合であり、且つR_1がｉ－プロピル又はｓｅｃ－ブチルである場合にはＣ＝Ｏではない；

それらの化合物並びにそれらの異性体及び互変異性体の調製法並びに使用；式（Ｉ）の化合物の調製のための出発材料；活性成分が式（Ｉ）の化合物及びそれらの互変異性体から選択されている殺虫組成物；並びに当該組成物を用いる防除法、に関する。

【０００２】

幾つかのマクロライド化合物が文献において害虫防除のために提案されている。しかしながら、特に昆虫及びダニ目のメンバーの防除のための殺虫特性を有する追加の化合物を提供する必要性が存在するという理由により、それらの既知の化合物の生物学的特性は完全には満足行くものではない。この問題は、本発明に従い、４”位にあるＳ配置が存在する式（Ｉ）の本化合物の提供によって解決される。

【０００３】

本発明により特許を請求する化合物は、アベルメクチン誘導体である。アベルメクチンは、当業者にとって既知である。それらは、微生物種ストレプトマイセス・アベルミチリス(Streptomyces avermitilis)の発酵によって得られる構造的に密接に関連した殺虫活性化合物群である。アベルメクチン誘導体は、常用の化学合成を介して得ることができる。

【０００４】

ストレプトマイセス・アベルミチリス(Streptomyces avermitilis)から得ることのできるアベルメクチンは、Ａ１ａ、Ａ１ｂ、Ａ２ａ、Ａ２ｂ、Ｂ１ａ、Ｂ１ｂ、Ｂ２ａ及びＢ２ｂと表示される。記号表示「Ａ」の化合物は５位にメトキシラジカルを有し、「Ｂ」で表される化合物はＯＨ基を有する。「ａ」の系は、置換基R_1（２５位）がsec-ブチルラジカルである化合物を含んで成り、「ｂ」の系には、２５位にイソプロプルラジカルが存在する。当該化合物名中にある数字の１は、原子２２位と２３位が二重結合によって結合していることを示し、数字の２は、それらが単結合によって結合しており、且つ炭素原子２３がＯＨ基を有することを示す。上記表記は、天然のアベルメクチンに相当する特定の構造の型を示すために、本発明の記載において適切に維持されている。本発明に従い、Ｂ１系の化合物及び炭素原子２２位と２３位の間に単結合を有する関連化合物並びに他の置換基、例えばシクロヘキシル又は１－メチルブチルをR_1位に有する化合物、の誘導体、更に特別には、４”位にＳ配置が存在するアベルメクチンＢ１ａ及びＢ１ｂの誘導体の混合物を特許請求する。

【０００５】

式（Ｉ）の化合物の幾つかは、互変異性体の形態であることがある。従って、上文及び下文における式（Ｉ）の化合物についてのあらゆる言及は、適用可能な場合、たとえ全ての場合に具体的に言及されてなくても、相当する互変異性体も含むとして解されるべきである。

【０００６】

式（Ｉ）の化合物及び、適用可能であればそれらの互変異性体は、塩、例えば酸付加塩を形成し得る。これらの酸付加塩は、例えば、強力な無機酸、例えば鉱酸、例えば硫酸、リン酸又はハロゲン化水素酸、強力な有機カルボン酸、例えば非置換又は置換、例えばハロ置換、C_1－C_4アルカンカルボン酸、例えば酢酸、不飽和又は飽和ジカルボン酸、例えば衆参、マロン酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、ヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸若しくはクエン酸、又は安息香酸、あるいは有機スルホン酸、例えば、非置換又は置換、例えばハロ置換、C_1－C_4アルカン－又はアリール－スルホン酸、例えばメタン－又はｐ－トルエン－スルホン酸により形成される。少なくとも１つの酸性基を有する式（Ｉ）の化合物は、更に塩基と塩を形成することがある。塩基との適当な塩は、例えば金属塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム、カリウム又はマグネシウム塩、あるいはアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ－、ジ－又はトリ－低級アルキルアミン、例えばエチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン又はジメチルプロピルアミン、あるいはモノ－、ジ－又はトリヒドロキシ－低級アルキルアミン、例えばモノ－、ジ－又はトリ－エタノールアミンである。相当する内部塩も、適用可能な場合形成されうる。遊離型が好ましい。式（Ｉ）の化合物の塩の中でも、農芸化学的に有利な塩が好ましい。上文及び下文において、式（Ｉ）の遊離化合物又はそれらの塩についてのあらゆる言及は、適用可能な場合、式（Ｉ）の相当する塩又は遊離化合物もそれぞれ含むとして解されるべきである。式（Ｉ）の化合物の互変異性体及びそれらの塩にも同じことが言える。

【０００７】

式（Ｉ）の化合物塩の好ましい陰イオンは：鉱酸、例えば硫酸、リン酸又はハロゲン化水素酸の陰イオン；

有機カルボン酸、例えば非置換又は置換、例えばハロ置換、C_1－C_4アルカンカルボン酸、不飽和又は飽和ジカルボン酸、又はヒドロキシカルボン酸の陰イオン；

有機スルホン酸、例えば非置換又は置換、例えばハロ置換、C_1－C_4アルカン－又はアリ

ール－スルホン酸の陰イオン；あるいは
Ｃ－Ｈ－活性化合物の陰イオン。これらのＣ－Ｈ－活性化合物は、特に、強力な電子求引性置換基、例えばニトリル、カルボニル又はニトロ基を有する有機化合物を含む。特に式Y_1－CH_2－Y_2の化合物の陰イオンが優先され、ここで、Y_1及びY_2は、それぞれ電子求引性基を表す。更に特別には、マロジニトリル(malodinitrile)、シアノ酢酸、シアノ酢酸エステル、シアノ酢酸アミド、アセト酢酸、アセト酢酸エステル、アセチルアセトン、シアノアセトン及びバルビツール酸の陰イオンが好ましい：あるいは
酸フェノール、例えばピクリン酸の陰イオン、
である。

【０００８】

最も特別には、式（Ｉ）の化合物と、以下の酸：安息香酸、マレイン酸、フマル酸、２－ヒドロキシ安息香酸、サリチル酸、リンゴ酸、ベンゼンスルホン酸、バルビツール酸、２－エチル酪酸、チオリンゴ酸、３，５－ジヒドロキシ安息香酸、トリメシン酸、Ｄ－（－）－キナ酸、２－ブロモ－安息香酸、２－フェニル－安息香酸、３，３’－チオジプロピオン酸、ナフタレン－１－カルボン酸、５－スルホサリチル酸、２－メトキシ－フェニル酢酸、ベンゼン－１，２，４－トリカルボン酸、３－ヒドロキシ－安息香酸、Ｄ－グルコン酸、４，５－ジクロロ－フタル酸、ｎ－ヘキサン酸（カプロン酸）、ｎ－ヘプタン酸（エナント酸）、ｎ－オクタン酸（カプリル酸）、ステアリン酸、パルミチン酸、２，２’－ジヒドロキシ－１，１’－ジナフチルメタン－３，３’－４，４’－メチレン－ビス（３－ヒドロキシ－２－ナフトエ酸）、エンボン酸(embonic acid)、４－メトキシ－フェニル酢酸（ホモアニス酸）、２－アニス酸（２－メトキシ－安息香酸）、アダマンタン－１－カルボン酸、ピリジン－３，４－ジカルボン酸、３，４－ジヒドロキシ－安息香酸、１－ヒドロキシ－２－ナフトエ酸（１－ナフトール－２－カルボン酸）、２，２’－オキシ二酢酸（ジグリコール酸）、Ｏ－エチル－グリコール酸、（２－ナフチルチオ）－酢酸（Ｓ－（２－ナフチル）－チオグリコール酸）、２－ナフチルオキシ－酢酸、ペルフルオロ－オクタン酸、ｐ－トルエン酸、シクロヘキサンプロピオン酸、２，６－ジヒドロキシピリジン－４－カルボン酸（シトラジン酸）、３－メトキシプロピオン酸、３，４，５－トリヒドロキシ－安息香酸（没食子酸）、ピロ粘液酸（フラン－２－カルボン酸）、２－メチル－安息香酸（ｏ－トルエン酸）、３，６，９－トリオキサ－ウンデカン二酸、３－（４－メトキシフェニル）－プロピオン酸（ｐ－メトキシ－ヒドロケイ皮酸）、３－（３，４－ジヒドロキシフェニル）－プロピオン酸、Ｏ－アセチル－サリチル酸（アスピリン）、３－フルオロ－安息香酸、シクロヘキサンカルボン酸、５－クロロ－２－ヒドロキシ－安息香酸（５－クロロ－サリチル酸）、２，５－ジメチル－安息香酸（キシリル酸）、３，４，５－トリメトキシ－安息香酸（トリメチル没食子酸）、２，４，６－トリメチル－安息香酸、３－フェノキシ－安息香酸、４－フェニル酪酸、３－トリフルオロメチル－安息香酸、４－フェニル－酪酸、３－トリフルオロメチル－安息香酸、テレフタル酸モノメチルエステル、ｏ－ヒドロキシ－フェニル酢酸、イソフタル酸、２，４，６－トリヒドロキシ－安息香酸、トリフルオロメタンスルホン酸、２－メチル－プロピオン酸（イソ酪酸）、２，４－ジメトキシ－安息香酸、２－チエニル酢酸（チオフェン－２－酢酸）、３，４－ジメトキシ－安息香酸（ベラトル酸）、２，２－ビス（ヒドロキシ－メチル）－プロピオン酸、２－フルオロ－フェニル酢酸、２－メチル－酪酸、ヒドロキシ－酢酸、４－クロロ－フェニル酢酸、２－メルカプト安息香酸（チオサリチル酸）（＋／－）－２－ヒドロキシフェニル－酢酸（ＤＬ－マンデル酸）、２，４－ジヒドロキシピリミジン－６－カルボン酸、トルエン－４－スルホン酸（ｐ－トルエン－スルホン酸）、２－クロロ－フェニル酢酸、２，４－ジクロロ－安息香酸、２，６－ジクロロ－安息香酸、２－メルカプト－プロピオン酸（チオール酢酸）、２－クロロ－安息香酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸（エチル－硫酸）、４－フェノキシ－酪酸、４－ｔｅｒｔ－ブチル－安息香酸、３，４－メチレンジオキシ－安息香酸、ビス（２－カルボキシエチル）－ジスルフィド、ピバル酸（トリメチル酢酸）、ニコチン酸Ｎ－オキシド、アクリル酸、３－ベンゾイル－プロピオン酸（４－オキソ－４－フェニル－酪酸）、（１Ｒ）－（－）－ショウノウ－

１０－スルホン酸水和物、２－クロロ－４－フルオロ－安息香酸、３，５－ジメトキシ－安息香酸、２－スルホ安息香酸、スルホ酢酸、２－クロロ－６－フルオロ－安息香酸、２，４－ジヒドロキシ－安息香酸、メトキシ酢酸、２，４，６－トリメチル－ベンゼン－スルホン酸、酒石酸、キサンテン－９－カルボン酸、４－ペンテン酸（アリル酢酸）、５－スルホサリチル酸、ビニル酢酸、２－ブチン二酸（アセチレンジカルボン酸）、２－オキソ－プロピオン酸（ピルビン酸）、シクロヘキシル酢酸、２－ヒドロキシイソ酪酸、ニコチン酸、６－クロロ－ニコチン酸、イソニコチン酸、ピコリン酸、ピラジンカルボン酸、シュウ酸、プロピオン酸、ペンタフルオロプロピオン酸、酪酸、ヘプタフルオロ酪酸、吉草酸、クエン酸、グリセリン酸、酢酸、クロロ酢酸、ジクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸、フルオロ酢酸、乳酸、マロン酸、コハク酸、グルタル酸、アジピン酸、ピメリン酸、スベリン酸、アゼライン酸、セバシン酸、フタル酸、テレフタル酸、リン酸、硫酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硝酸、過塩素酸、アセト酢酸、シアノ酢酸、テトラヒドロフラン－２－カルボン酸、プロピオル酸、メタクリル酸、クロトン酸及びピクリン酸との１：１の塩が好ましい。

【０００９】

特に断らない限り、上文及び下文において使用される一般的な用語は、以下に示す意味を有する。

【００１０】

特に断らない限り、炭素を含む基及び化合物はそれぞれ、１～６、好ましくは１～４、特に１又は２の炭素原子を含む。

【００１１】

ハロゲンは、基自体として、且つ他の基及び化合物、例えばハロアルキル、ハロアルコキシ及びハロアルキルチオの構造要素として、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素、更に特別にはフッ素又は塩素である。

【００１２】

アルキルは、基自体として、そして他の基及び化合物、例えばハロアルキル、アルコキシ及びアルキルチオの構造要素として、それぞれの場合において、問題の基又は化合物に含まれる炭素原子の数を考慮すると、直鎖状、すなわちメチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチル、あるいは分枝状、例えばイソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル又はイソヘキシルである。

【００１３】

シクロアルキルは、基自体として、そして他の基及び化合物、例えばハロシクロアルキル、シクロアルコキシ及びシクロアルキルチオの構造要素として、それぞれの場合において、問題の基又は化合物に含まれる炭素原子の数を十分に考慮すると、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルである。

【００１４】

アルケニルは、基自体として、そして他の基及び化合物の構造要素として、問題の基又は化合物に含まれる炭素原子及び共役型又は孤立型の二重結合の数を十分に考慮すると、直鎖状、例えばビニル、アリル、２－ブテニル、３－ペンテニル、１－ヘキセニル、１－ヘプテニル、１，３－ヘキサジエニル又は１，３－オクタジエニル、あるいは分枝状、例えばイソプロペニル、イソブテニル、イソプレニル、tert-ペンテニル、イソヘキセニル、イソヘプテニル又はイソオクテニルである。３～１２、特に３～６、更に特別には３又は４個の炭素原子を有するアルケニル基が好ましい。

【００１５】

アルキニルは、基自体として、そして他の基及び化合物の構造要素として、それぞれの場合において、問題の基又は化合物に含まれる炭素原子及び共役型又は孤立型の二重結合の数を十分に考慮すると、直鎖状、例えばエチニル、プロパルギル、２－ブチニル、３－ペンチニル、１－ヘキシニル、１－ヘプチニル、３－ヘキセン－１－イニル又は１，５－

ヘプタジエン－３－イニル、あるいは分枝状、例えば３－メチルブタ－１－イニル、４－エチルペンタ－１－イニル、４－メチルヘキサ－２－イニル又は２－メチルヘプタ－３－イニルである。３～１２、特に３～６、更に特別には３又は４個の炭素原子を有するアルキニル基が好ましい。

【００１６】

アルキレン及びアルケニレンは、直鎖状又は分枝状の架橋のメンバーであり、特に－$CH_2CH_2CH_2$－、－$CH_2CH_2CH_2CH_2$－、－$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$－、－CH_2（CH_3）CH_2CH_2－、－CH_2C（CH_3）$_2CH_2$－、－CH_2CH＝CH－、－CH_2CH＝$CHCH_2$又は－CH_2CH＝$CHCH_2CH_2$－である。

【００１７】

ハロ置換炭素を含有している基及び化合物、例えばハロゲンで置換されているアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ又はアルキルチオは、部分的にハロゲン化又はペルハロゲン化されていることがあり、ハロゲン置換基についてのポリハロゲン化の場合、同じ又は異なる可能性がある。ハロアルキルの例は、基自体として、そして他の基及び化合物、例えばハロアルコキシ及びハロアルキルチオの構造要素として、フッ素、塩素及び／又は臭素で１～３回置換されているメチル、例えばCHF_2又はCF_3；フッ素、塩素及び／又は臭素で１～５回置換されているエチル、例えばCH_2CF_3、CF_2CF_3、CF_2CCl_3、CF_2CHCl_2、CF_2CHF_2、CF_2CFCl_2、CF_2CHBr_2、CF_2CHClF、CF_2CHBrF又はCClFCHClF；フッ素、塩素及び／又は臭素で１～７回置換されているプロピル又はイソプロピル、例えば$CH_2CHBrCH_2Br$、CF_2CHFCF_3、$CH_2CF_2CF_3$又はCH（CF_3）$_2$；フッ素、塩素及び／又は臭素で１～９回置換されているブチル又はその異性体、例えばCF（CF_3）（CHF_2）CF_3又はCH_2（CF_2）$_2CF_3$；フッ素、塩素及び／又は臭素で１～１１回置換されているペンチル又はその異性体、例えばCF（CF_3）（CHF）$_2CF_3$又はCH_2（CF_2）$_3CF_3$；並びにフッ素、塩素及び／又は臭素で１～１３回置換されているヘキシル又はその異性体、例えば（CH_2）$_4CHBrCH_2Br$、CF_2（CHF）$_4CF_3$、CH_2（CF_2）$_4CF_3$又はC（CF_3）$_2$（CHF）$_2CF_3$である。

【００１８】

アリールは、特にフェニル、ナフチル、アントラセニル又はペリレニル、好ましくはフェニルである。

【００１９】

ヘテロシクリルは、特にピリジル、ピリミジル、ｓ－トリアジニル、１，２，４－トリアジニル、チエニル、フリル、テトラヒドロフラニル、ピラニル、テトラヒドロピラニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、キノキサリニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾピロリル、ベンゾチアゾリル、インドリル、クマリニル又はインダゾリルであり、これらは好ましくは炭素原子を介して結合しており；好ましいのはチエニル、チアゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、フリル、テトラヒドロピラニル及びインドリル；特にピリジル又はチアゾリルである。

【００２０】

本発明の範囲内で、

（２）式（Ｉ）のグループ（１）に従う化合物であって、R_1がイソプロピル又はsec-ブチルであり、好ましくはイソプロピル又はsec-ブチル誘導体の混合物が存在するもの；

（３）式（Ｉ）のグループ（１）又は（２）に従う化合物であって、R_2がＨであるもの；

（４）式（Ｉ）のグループ（１）又は（２）に従う化合物であって、R_2が置換されていないか、又は置換されているもの、特に非置換C_1－C_8アルキル、最も特別にはメチルであるもの、

（５）式（Ｉ）のグループ（１）又は（２）に従う化合物であって、R_2がエチルであるもの；

（６）式（Ｉ）のグループ（１）又は（２）に従う化合物であって、R_2がｎ－プロピルであるもの；
（７）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3が置換されていないか、又は置換されているもの、特に非置換C_1－C_{12}アルキルであるもの；
（８）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3が水素であるもの；
（９）式（Ｉ）のグループ（１）～（７）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がメチルであるもの；
（１０）式（Ｉ）のグループ（１）～（７）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がエチルであるもの；
（１１）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がｎ－プロピルであるもの；
（１２）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がイソプロピルであるもの；
（１３）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がｎ－ブチル、ｓｅｃ－ブチル、イソブチル又はｔｅｒｔ－ブチルであるもの；
（１４）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）、（４）及び（７）～（１３）のいずれか１つに従う化合物であって、R_2が置換C_1－C_4アルキルであり、且つ当該置換基が、ＯＨ、ハロゲン、C_3－C_8シクロアルキル；置換されていないか、又は１～３個のメチル基で置換されているC_3－C_8シクロアルケニル；C_1－C_{12}アルコキシ、C_2－C_8アルケニル、C_2－C_8アルキニル、－Ｃ（＝Ｏ）R_5、－ＮＨＣ（＝Ｏ）R_6、－Ｐ（＝Ｏ）（ＯC_1－C_6アルキル）$_2$；並びにフェニル、ナフチル、アントラセニル、フェナントレニル、フルオレニル、ペリレニル及びヘテロシクリルであって、置換されていないか、又は当該環での置換の可能性に依存して、一～五置換されているもの、であり；
特に、R_2の置換基が、ハロゲン、C_3－C_8シクロアルキル、C_2－C_8アルキニル、－Ｃ（＝Ｏ）R_5、－ＮＨＣ（＝Ｏ）R_6、－Ｐ（＝Ｏ）（ＯC_1－C_6アルキル）$_2$；並びにフェニル、ナフチル、アントラセニル、ピリジル、チアゾリル、イミダゾリル、フリル、キノリニル及びピラゾリルであって、置換されていないか、又は当該環での置換の可能性に依存して、一～三置換されているものから成る群から選択されるもの；
（１５）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（７）～（１４）のいずれか１つに従う化合物であって、R_2が置換されていないか、又は置換されているもの、特に非置換C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキルであるもの；
（１６）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）、（１４）及び（１５）のいずれか１つに従う化合物であって、R_3がＯＨ、ハロゲン、ＣＮ、NO_2、C_1－C_2アルキル、ジメチルアミノC_1－C_4アルコキシ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_2ハロアルキル、C_1－C_2アルコキシ、C_1－C_2ハロアルコキシ、フェノキシ、フェニルC_1－C_6アルキル、フェニルC_1－C_4アルケニル；置換されていないか、又は塩素若しくはメトキシで置換されているフェノキシ；置換されていないか、又は塩素、メトキシ若しくはトリフルオロメチルで置換されているベンジルオキシ；メチレンジオキシ、－Ｃ（＝Ｏ）R_5、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）R_6及びＮＨＣ（＝Ｏ）R_6から成る群から選択される１～３個の置換基を芳香族部分上に有するベンジルであり；
R_5が、Ｈ、ＯＨ、NH_2、ＮＨ（C_1－C_2アルキル）、Ｎ（C_1－C_2アルキル）$_2$、－Ｏ－C_1－C_2アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_7、ＮＨC_1－C_2アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_7、C_1－C_6アルキル、C_1－C_2アルコキシ、C_1－C_2アルコキシ－C_1－C_2アルコキシ、C_2－C_4アルケニルオキシ、C_2－C_4アルキニルオキシ；フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ＮＨ－フェニル、ＮＨ－C_1－C_6アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_7；又はハロゲン、ニトロ、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで置換されているフェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ又はＮＨ－フェニルであり；
R_6が、Ｈ、C_1－C_3アルキル、フェニル又はベンジルであり；そして

R_7が、H、OH、NH_2、NH（C_1－C_{12}アルキル）、N（C_1－C_{12}アルキル）$_2$、C_1－C_{12}アルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルコキシ、C_2－C_8アルケニルオキシ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ又はNH－フェニルであるもの；

（１７）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（７）～（１３）のいずれかに従う化合物であって、R_2がC_1－C_4アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－R_5、特にCH_2－Ｃ（＝Ｏ）－R_5であり；且つ

R_5が、H、OH、NH_2、NH（C_1－C_2アルキル）、N（C_1－C_2アルキル）$_2$、C_1－C_4アルキル、C_1－C_{12}アルコキシ、C_2－C_4アルケニルオキシ、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、NH－フェニル、NH－C_1－C_2アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－C_1－C_2アルキル－フェニル、－Ｐ（＝Ｏ）（ＯC_1－C_6アルキル）$_2$；あるいは塩素、フッ素、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで置換されているフェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ又はNH－フェニルであり；

最も特別には、R_5がC_1－C_{12}アルコキシであるもの；

（１８）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（７）～（１３）のいずれかに従う化合物であって、R_2が－CH_2－ヘテロシクリルであり、且つヘテロシクリルがピリジル、フリル、テトラヒドロフラニル、ピラニル、テトラヒドロピラニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、キノキサリニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾピロリル、ベンゾチアゾリル、インドリル、クマリニル又はインダゾリル（上述の遊離基は非置換であるか、あるいはハロゲン、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びニトロから互いに独立して選択される置換基で一又は二置換される）；特に好ましくは、それぞれ置換されていないか、あるいはハロゲン、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びニトロから互いに独立して選択される置換基によって一又は二置換されているピリジル、フリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾピロリル、ベンゾチアゾリル又はインドリル；特に、それぞれ置換されていないか、あるいはハロゲン、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びニトロから互いに独立して選択される置換基によって一又は二置換されている、特に塩素で一置換されているピリジル又はチアゾリル、であるもの；

（１９）式（Ｉ）のグループ（１）～（６）のいずれかに従う化合物であって、R_3が、置換されていないか、あるいはC_2－C_4アルキニル、－Ｃ（＝Ｏ）－C_1－C_4アルコキシ、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－ベンジル、フェニル又はハロゲンによって一又は二置換、特に一置換されているC_2－C_{10}アルケニル、特にC_2－C_4アルケニルであるもの；特にR_3が－CH_2－ＣＨ＝CH_2であるもの；

（２０）式（Ｉ）のグループ（１）～（１９）のいずれかに従う化合物であって、Ｚが－Ｃ（＝Ｏ）であるもの；

（２１）式（Ｉ）のグループ（１）～（１９）のいずれかに従う化合物であって、Ｚが－Ｃ（＝Ｓ）であるもの；

（２２）式（Ｉ）のグループ（１）～（２１）のいずれかに従う化合物であって、Ｘが結合であるもの；

（２３）式（Ｉ）のグループ（１）～（２１）のいずれかに従う化合物であって、ＸがＯであるもの；

（２４）式（Ｉ）のグループ（１）～（２１）のいずれかに従う化合物であって、ＸがNR_4、特にＮＨであるもの；

（２５）式（Ｉ）のグループ（１）～（２１）のいずれかに従う化合物であって、ＸがＳであるもの；

（２６）式（Ｉ）のグループ（１）～（２５）のいずれかに従う化合物であって、炭素原子２２位と２３位の間の結合が単結合であるもの；

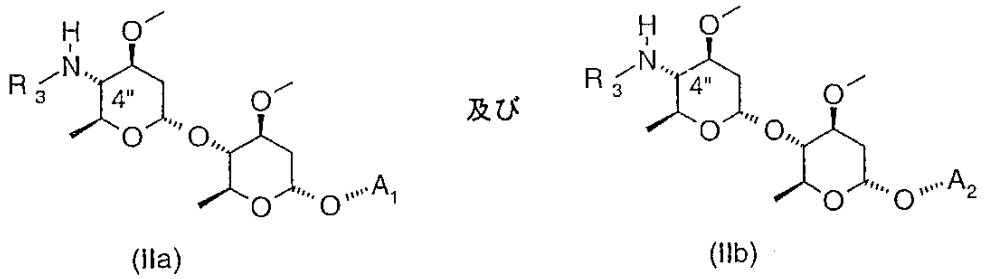
（２７）式（Ｉ）のグループ（１）～（２５）のいずれかに従う化合物であって、炭素原子２２位と２３位の間の結合が二重結合であるもの；

（２８）式（Ｉ）のグループ（１）又は（３）～（２７）のいずれかに従う化合物であっ

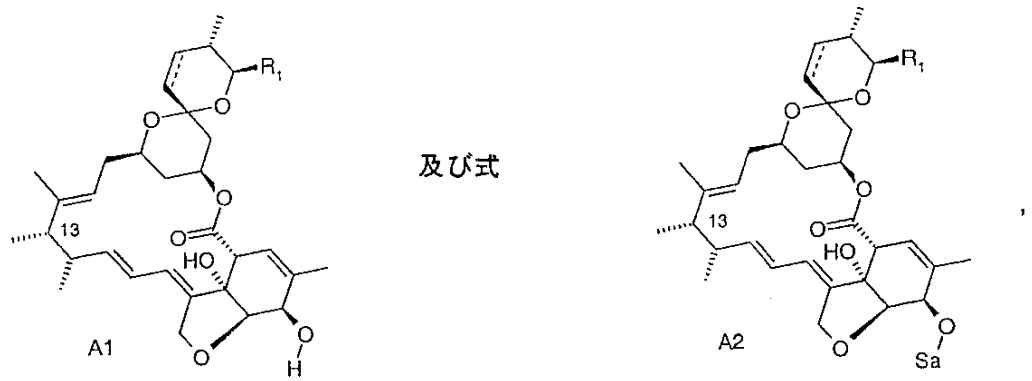
て、R_1がシクロヘキシルであるもの；
（２９）式（Ｉ）のグループ（１）又は（３）～（２７）のいずれかに従う化合物であって、R_1が１－メチル－ブチルであるもの；
（３０）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（２６）～（２９）のいずれかに従う化合物であって、R_2がC_1－C_6アルコキシ－C_1－C_6アルキルであるもの；
（３１）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（２６）～（２９）のいずれかに従う化合物であって、基R_2－Ｘ－Ｚが－Ｃ（＝Ｏ）Ｈであるもの；
（３２）式（Ｉ）のグループ（１）、（２）及び（２６）～（２９）のいずれかに従う化合物であって、基－NR_3－Ｚ－Ｘ－R_2が－Ｎ（CH_3）Ｃ（＝Ｏ）CH_3であるもの；
が好ましい。

【００２１】
（３３）本発明の範囲内で、表に列記した式（Ｉ）の化合物、適用可能であれば、それらのＥ／Ｚ異性体及びＥ／Ｚ異性体の混合物が特に好ましい。

【００２２】
式（Ｉ）の化合物の調製に使用される以下の式
【化２】

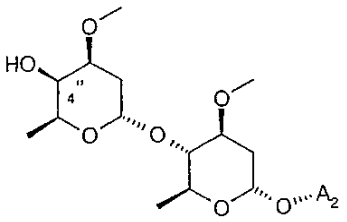


{ここで、R_3は、式（Ｉ）について上文で定義した通りであり、且つA_1及びA_2は式
【化３】



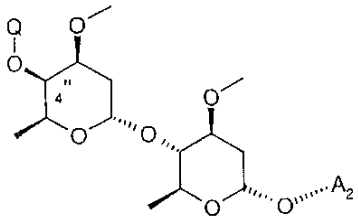
（それぞれ、式中のＳａは保護基であり、そしてR_1は式（Ｉ）について上文で定義した通りであり、且つ炭素原子２２位と２３位の間の結合が単結合又は二重結合である）の基であり、且つ前記因子Ａ１及びＡ２は、炭素原子１３位を介して当該構造の残りと結合す

る｝の中間体は、例えば、
（Ａ）式
【化４】



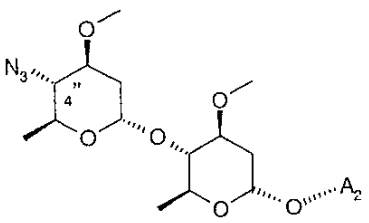
(IIIb),

（ここで、A_2は式（ＩＩ）について上文で定義した通りである）の化合物（これは公知のものであるか、又は本質的に知られている方法によって調製されうるものである）と、スルホン酸誘導体とを反応させて、式
【化５】



(III)

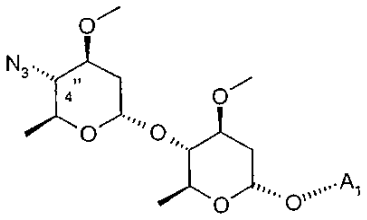
（ここで、Ｑはスルホン酸遊離基であり、そしてA_2は式（ＩＩｂ）について上文で定義した通りである）の化合物を形成させ；
（Ｂ）生じた式（ＩＩＩ）の化合物とアジド塩とを反応させて、４”位を反転させて、式
【化６】



(IVb),

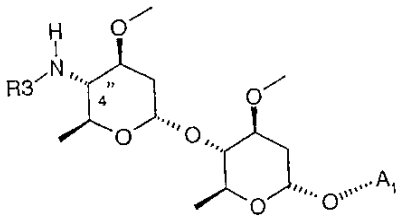
（ここで、遊離基A_2は上文で定義した通りである）の化合物を形成させ；あるいは、適用可能であれば、
（Ｃ）式（ＩＶｂ）の化合物の調製のために、式（ＩＩＩｂ）の化合物とアジドを、トリフェニルホスフィン又はトリアルキルホスフィン及びアゾジカルボン酸誘導体の存在下で反応させ；
（Ｄ）式（ＩＶｂ）の化合物の保護基Ｓａを、酸との反応によって除去して、式

【化７】



(IVa)

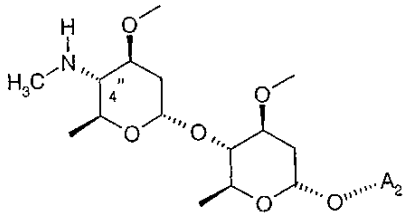
（ここで、A_1は上文で定義した通りである）の化合物を形成させ；
（Ｅ）式
【化８】



(IIa),

（ここで、R_3は－CH_2－R_{33}であり、R_{33}は非置換又は一～五置換C_1－C_{11}アルキル、非置換又は一～五置換C_2－C_{11}アルケニル、あるいは非置換又は一～五置換C_2－C_{11}アルキニルであり、そしてA_2は式（ＩＩ）について定義した大環状構造に相当する）の化合物の調製のために、式（ＩＶｂ）の化合物を、最初に
（Ｅ１）ホスフィン又は亜リン酸エステルと；次に
（Ｅ２）式R_{33}－ＣＨＯのアルデヒドと；そして次に
（Ｅ３）水素化物と、適用可能ならば、触媒量の酸の存在下で反応させ；
（Ｆ）工程段階（Ｄ）と同様に、生じた式（ＩＩｂ）の化合物から保護基を除去し；あるいは
（Ｇ）式（ＩＩａ）（ここで、R_3は工程段階（Ｅ）で定義した通りである）の化合物の調製のために、工程段階（Ｅ１）～（Ｅ３）と同様に、式（ＩＶａ）の化合物を、
（Ｈ１）ホスフィンと；次に
（Ｈ２）ホルムアルデヒドと、好ましくはモレキュラーシーブの存在下で；そして次に（
（Ｈ３）水素化物と、触媒量の酸の存在下で反応させ；そして生じた式

【化９】



(V),

（ここで、A_2は式（ＩＩ）について定義した大環状構造に相当する）の化合物を更に工程段階（Ｄ）と同様に反応させ；あるいは
（Ｉ）式（ＩＩａ）（ここで、R_3は－CH_3である）の化合物の調製のために、式（ＩＶａ）の化合物を工程段階（Ｈ１）～（Ｈ３）と同様に反応させ；あるいは
（Ｋ）式（ＩＩａ）又は（ＩＩｂ）（ここで、R_3は式（Ｉ）について上文で定義した通りである）の化合物の調製のために、式（ＩＩａ）又は（ＩＩｂ）（ここで、R_3はＨである）の化合物を式Ｈａｌ－R_{33}（ここで、R_{33}は非置換又は一～五置換C_2－C_{12}アルキルあるいは非置換又は一～五置換C_2－C_{12}アルケニルであり、且つＨａｌはハロゲン、好ましくはヨウ素又は臭素である）の化合物と反応させることによって、得ることができる。

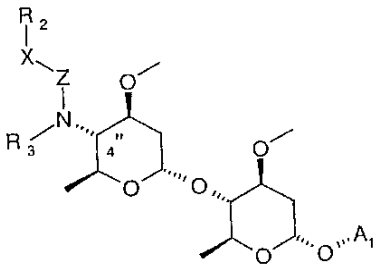
【００２３】

式（ＩＩａ）及び（ＩＩｂ）（ここで、R_3はＨである）の上文の定義に従う化合物であって、本発明に従う式（Ｉ）の化合物の調製のために中間体として使用される化合物は、
（Ｌ）式（ＩＶｂ）の化合物を、工程段階（Ｈ１）と同様にホスフィンと、そして次に塩基と反応させ；そして更に生じた式（ＩＩａ）の化合物を、工程段階（Ｄ）と同様に反応させることによって；あるいは式（ＩＩａ）の化合物を工程段階（Ｈ１）と同様にホスフィンと、続いて塩基と反応させることによって、そのいずれかで調製されうる。

【００２４】

本発明は更に、上文で定義した式（Ｉ）の化合物の調製のための方法に関し、ここで、（Ｍ）上文で定義したような式（ＩＩａ）又は（ＩＩｂ）の化合物は、式R_2－Ｘ－Ｚ－Ｔ（ここで、R_2、Ｘ及びＺは式（Ｉ）について上文で定義した通りであり、且つＴは脱離基である）の化合物と反応し、そして適用可能な場合には、生じた式

【化１０】



(Ia)

（ここで、A_1、R_2及びR_3は上文で定義した通りである）の化合物は、更に変法（Ｄ）

に従い、更に反応し；あるいは
（Ｎ）式（Ｉ）（ここで、基R_2－Ｚ－Ｘ－は、R_2－ＮＨＣ（＝Ｏ）－又はR_2－ＮＨＣ（＝Ｓ）－であり、且つR_2は式（Ｉ）について定義した通りである）の化合物の調製のために、上文で定義する式（ＩＩａ）又は（ＩＩｂ）の化合物は、式R_2－Ｎ＝Ｃ＝Ｏ又はR_2－Ｎ＝Ｃ＝Ｓ（ここで、R_2は式（Ｉ）について定義した通りである）の化合物、及び、適用可能な場合には、生じた式（Ｉａ）（ここで、基R_2－Ｚ－Ｘ－はR_2－ＮＨＣ（＝Ｏ）－又はR_2－ＮＨＣ（＝Ｓ）－である）の化合物は、変法（Ｄ）に従い更に反応する。

【００２５】

式（Ｉ）の化合物の互変異性体に関して上文でなされた言及は、上文及び下文において言及する出発材料に対して、それらの互変異性体に関して同様に適用される。

【００２６】

上文及び下文において記載する反応は、それ自体知られている方法で、例えば適当な溶媒又は希釈剤あるいはそれらの混合物の不在下で、あるいは習慣的にそれらの存在下で実施され、当該反応は、必要に応じて、室温に冷却して、又は例えば約－８０℃～反応媒体の沸点、好ましくは約０℃～約＋１５０℃の温度範囲で、そして必要により、密閉容器内で、加圧下で、不活性ガス雰囲気のもと、そして／あるいは無水条件下で加熱して実施される。特に有利な反応条件は、本実施例において見られる。

【００２７】

反応時間は重要ではなく、約０．１～約７２時間、特に約０．５～約２４時間の反応時間が好ましい。

【００２８】

生成物は、慣習的な方法によって、例えばろ過、結晶化、蒸留又はクロマトグラフィー、あるいはそのような方法の任意の適当な組み合わせによって単離される。

【００２９】

式（Ｉ）の化合物及び、適用可能な場合それらの互変異性体、の調製に使用される上文及び下文で言及した出発材料は知られており、あるいはそれ自体が知られている、例えば下文に示すような方法によって調製されうる。

【００３０】

変法（Ａ）：

溶媒及び希釈剤の例には、芳香族、脂肪族及び脂環式の炭化水素及びハロゲン化炭化水素、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、テトラリン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ブロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン又はテトラクロロエテン；エーテル、例えばジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメトキシジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン；あるいは言及した溶媒の混合物が含まれる。ジクロロメタンが好ましい。

【００３１】

式（ＩＩＩ）の化合物中の保護基Ｑは、特にスルホン酸遊離基であり；例えば、トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ペンタフルオロエタンスルホン酸及びノナフルオロブタンスルホン酸の陰イオンが好ましい。

【００３２】

式（ＩＩ），（ＩＩＩ）、（ＩＶ）及び（Ｖ）中の適当な保護基Ｓａは、特にトリアルキルシリル基であり；例えば、トリメチルシリル、トリエチルシリル、ジメチル－ｔｅｒｔ－ブチルシリル、ジメチル－イソプロピルシリル、ジメチル－１，１，２－トリメチルプロピルシリル、ジエチル－イソプロピルシリル、ジメチル－ｔｅｒｔ－ヘキシルシリル、更にはフェニル－ｔｅｒｔ－アルキルシリル基、例えばジフェニル－ｔｅｒｔ－ブチルシリル；又はアリルオキシカルボニル、が好ましい。

【００３３】
前記反応は、有利には約－７０℃～＋１０℃、好ましくは－３５℃～０℃の温度範囲で実施される。
【００３４】
前記反応にとって特に好ましい条件を実施例Ｐ．１に記す。
【００３５】
変法（Ｂ）：
溶媒及び希釈剤の例には、ニトリル、例えばアセトニトリル；ジメチルスルホキシド；及びアルコール、例えばエタノール又はメタノール；アミド、例えばジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミドが含まれ、それらが特に適している。
【００３６】
適当なアジド塩は、特にNaN_3及び$Zn(N_3)_2$であり；特にNaN_3である。
【００３７】
前記反応は、有利には約－１０℃～＋１０℃の温度範囲で実施される。
【００３８】
前記反応にとって特に好ましい条件は、例えば実施例Ｐ．１中に見出すことができる。
【００３９】
変法（Ｃ）：
溶媒及び希釈剤の例は、変法（Ａ）で言及したものと同一である。尚、例えばジメチルホルムアミド又はヘキサメチル亜リン酸トリアミドも適している。
【００４０】
適当なアゾジカルボン酸誘導体は、特にアゾジカルボン酸エステル、例えばジベンジル、ジエチル、ジブチル、ジイソプロピル又はジ－ｔｅｒｔ－エステル又はジ－（２，２，２－トリクロロエチル）エステル；又はアゾジカルボン酸アミド、例えば、Ｎ，Ｎ，Ｎ，Ｎ－アゾジカルボン酸テトラメチルアミド又はアゾジカルボン酸ジモルホリド(dimorpholide)である。
【００４１】
適当なアジドドナーは、特に$(PhO)_2PN_3$、$Zn(N_3)_2$・ピリジン又はHN_3である。
【００４２】
適当なホスフィンは、特にトリアルキル－及びトリアリール－ホスフィン、例えばトリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン及びトリ－ｎ－ブチルホスフィン、及びトリフェニルホスフィンである。
【００４３】
前記反応は、有利には－２０℃～１５０℃の温度範囲で実施される。
【００４４】
変法（Ｄ）
溶媒及び希釈剤の例は、変法（Ａ）で言及したものと同一である。尚、ニトリル、例えばアセトニトリル；ジメチルスルホキシド；及びアルコール、例えばエタノール又はメタノール；及び水が適している。
【００４５】
前記反応は、有利には、－１０℃～＋２５℃の温度範囲内で実施される。
【００４６】
前記保護基の除去に適した酸は、例えばＨＦ／ピリジン、$Zn(BF_4)_2$・H_2O又はメタンスルホン酸である。
【００４７】
変法（Ｅ，Ｌ）：
溶媒及び希釈剤の例は、変法（Ａ）で言及したものと同一である。更に、ニトリル、例えばアセトニトリル；及びカルボン酸エステル、例えば酢酸エチルが適している。
【００４８】

当該反応は、有利には０℃～＋１００℃の温度範囲で実施される。

【００４９】

適当なホスフィンは、とりわけ変法（Ｃ）で言及したものと同一である。適当な亜リン酸塩は、例えば亜リン酸トリメチル、亜リン酸トリエチル、亜リン酸トリ－ｎ－ブチル、及び亜リン酸トリ－ｎ－ブチルである。

【００５０】

適当な水素化物は、特に複合水素化物、特にホウ水素化ナトリウム及びシアノホウ水素化ナトリウムである。

【００５１】

適当な酸は、特に弱いカルボン酸、例えば酢酸、プロピオン酸又はピバル酸；特にピバル酸である。当該酸は、特に触媒量で；特に１０モル％未満、更に特別には５モル％、最も特別には２モル％未満の量で使用される。

【００５２】

この変法にとって特に好ましい条件を、例えば実施例Ｐ．３に記載する。

【００５３】

変法（Ｆ）：

変法（Ｄ）に記載のものと同一の方法を適用する。反応は、好ましくはメタンスルホン酸の存在下で、メタノール中０℃で実施される。

【００５４】

変法（Ｇ）：

変法（Ｅ）に記載のものと同一の方法を適用する。

【００５５】

変法（Ｈ）

変法（Ｅ）に記載のものと同一の方法を適用する。使用するホスフィンは、例えばトリメチルホスフィン又はトリブチルホスフィン、好ましくはトリメチルホスフィンである。

【００５６】

変法（Ｉ）：

変法（Ｈ）に記載のものと同一の方法を適用する。

【００５７】

変法（Ｋ）：

変法（Ａ）で示したものと同一の溶媒が使用される。尚、アミド、例えばジメチルホルムアミド及びジメチルアセトアミド；ニトリル、例えばアセトニトリル；及びエステル、例えば酢酸エチルも適している。

【００５８】

適当な塩基は、特に炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、トリアルキルアミン、例えばトリエチルアミン、及び複素環塩基、例えばピリジンである。

【００５９】

変法（Ｌ）：

適当な溶媒及び希釈剤は、変法（Ａ）で言及したものと同一である。尚、ニトリル、例えばアセトニトリル；及びカルボン酸エステル、例えば酢酸エチルが適している。

【００６０】

適当なホスフィンは、特にトリアルキル－及びトリアリール－ホスフィン、例えばトリメチルホスフィン及びトリ－ｎ－ブチルホスフィン、及びトリフェニルホスフィンである。

【００６１】

塩基として、特に水酸化ナトリウム溶液又はアンモニアが、特に高度に希釈された形態、例えば０．０１Ｎの濃度で使用される。

【００６２】

変法（Ｍ）：

適当な脱離基は、特にハロゲン、特に臭素又は塩素である。

【００６３】

適当な溶媒は反応条件下で不活性なものであり；これらには特に変法（Ａ）のもとで言及したものが含まれる。

【００６４】

手順は、０℃から各溶媒の沸点までの温度で実施される。

【００６５】

適当な塩基は、特に炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、トリアルキルアミン、例えばトリエチルアミン、及び複素環塩基、例えばピリジンである。

【００６６】

変法（Ｎ）：

適当な溶媒は反応条件下で不活性なものであり；これらには特に変法（Ａ）のもとで言及したものが含まれる。

【００６７】

手順は、０℃から各溶媒の沸点までの温度、特に２０～４０℃で実施される。

【００６８】

式（Ｉ）の化合物は、可能性のある異性体のうちの１つの形態又はそれらの混合物の形態、純粋な異性体の形態又は異性体混合物の形態、すなわち、ジアステレオマー混合物の形態、であってもよく；本発明は、純粋な異性体及びジアステレオマー混合物の両方に関連し、そして、立体化学の詳細が個々の事案において具体的に言及されていなくても、上文及び下文からそれ相応に解釈されるべきである。

【００６９】

ジアステレオマー混合物は、既知の方法によって、例えば光学活性溶媒からの再結晶によって、アセチルセルロース上での高圧液体クロマトグラフィー（ＨＰＬＣ）によって、適当な微生物の助けを借りて、特異的な固定化酵素によって、又は包接化合物の形成を介して、例えば１つの異性体のみが錯化されているキラルなクラウンエーテルを用いて、純粋な異性体に分割されうる。

【００７０】

異性体の相当する混合物の分離によるものは別として、純粋なジアステレオマーは、本発明に従い、更には立体選択的合成の一般的に知られている方法によって、例えばそれ相応に適当な立体化学を有する出発材料を用いて、本発明に従う方法を実施することによって得ることができる。

【００７１】

いずれの場合においても、個々の構成成分が異なる生物活性を有する場合、生物学的により活性な異性体を単離し、又は合成することは有益である。

【００７２】

式（Ｉ）の化合物はまた、それらの水和物の形態でも得られることがあり、そして／あるいは他の溶媒、例えば固体の化合物の結晶化に使用されてもよい溶媒を含むことがある。

【００７３】

本発明は、前記方法のあらゆる段階における出発材料又は中間体として得ることができる化合物が出発材料として使用され、そして残りの段階の全て又は幾つかが実施され、あるいは出発材料が誘導体及び／又は塩及び／又はそのジアステレオマーの形態で使用され、特にそれらが前記反応条件下で形成されることによる、前記方法の全てのそれらの態様に関する。例えば、遊離形態又は保護形態の、官能基を有する式（Ｉ）の化合物は、式（Ｉ）の追加の化合物の調製のための出発材料として使用されうる。そのような操作については、当業者に知られている方法が適用されうる。

【００７４】

本発明の方法において、特に好ましい式（Ｉ）の化合物をもたらすそれらの出発材料及

び中間体を使用することが好ましい。

【００７５】

本発明は、特に本実施例に記載の調製方法に関する。

【００７６】

防除の分野において、本発明に従う式（Ｉ）の化合物は、低濃縮率であっても、非常に有利な殺虫領域及び非常に広範囲な領域を有する、価値のある予防及び／又は治療活性を示す活性成分であって、同時に温血動物、魚及び植物が十分耐えられるものである。それらは、驚いたことに、ヒト及び更に特別には家畜(productive livestock)、家畜(domestic animal)及びペットにおける植物害虫並びに外部寄生虫及び内部寄生虫の全てを防除するのに特に適している。それらは通常感受性のある動物害虫だけでなく耐性のある動物害虫、例えば昆虫及びダニ目の代表的なもの、線虫、条虫及び吸虫、の全ての又は個々の発生段階に対して、同時に有用な生物の保護に有効である。本発明に従う活性成分の殺虫又は殺ダニ活性も、それ自体を直接的に、すなわち、ある時期、例えば抜け替わりの時期の直後に又はその後に限り発生する害虫の死亡において、又は間接的に、産卵及び／又は孵化率の低下において、それ自体現れることがあり、良好な活性は少なくとも５０～６０％の死亡率に相当する。

【００７７】

本発明に従う化合物及びそれらを含んで成る組成物の動物害虫に対する作用は、他の殺虫剤、殺ダニ剤又は殺線虫剤の作用によって所定の環境に対し、有意に広げられることがあり、そして応用されることがある。適当な添加物には、例えば以下の活性成分のクラス：有機リン化合物、ニトロフェノール及び誘導体、ホルムアミジン、ウレア、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、ネオニコチノイド及びバチルス・チューリンジェンシス(Bacillus thuringiensis)製剤、のうちの代表的なものが含まれる。

【００７８】

特に適した混合パートナーの例には、アザメチホス；クロルフェンビンホス；シペルメトリン・ハイ－シス(high-cis)；シロマジン；ジアフェンチウロン；ダイアジノン；ジクロルボス；ジクロトホス；ジシクラニル(dicyclanil)；フェノキシカルブ；フルアツロン(fluazuron)；フラチオカルブ；イサゾフォス(isazofos)；ヨードフェンフォス(iodfenphos)；キノプレン；ルフェヌロン；メタクリフォス；メチダチオン；モノクロトフォス；フォスファミドン；プロフェノフォス；ジオフェノラン；バチルス・チューリンジェンシス(Bacillus thuringiensis)種ＧＣ９１又は種ＮＣＴＣ１１８２１から得ることのできる化合物；ピメトロジン；プロモプロピレート；メトプレン；ジスルホトン；キナルフォス(quinalphos)；タウフルバリネート(taufluvalinate)；チオシクラム；チオメトン；アルジカルブ；アジンホス－メチル；ベンフラカルブ；ビフェントリン；ブプロフェジン；カルボフラン；ジブチルアミノチオ；カルタプ；クロルフラズロン；クロルピリフォス；シフルトリン；ラムダ－シハロトリン；アルファ－シペルメトリン；ゼータ－シペルメトリン；デルタメトリン；ジフルベンズロン；エンドスルファン；エチオフェンカルブ；フェニトロチオン；フェノブカルブ；フェナバレレート；フォルモチオン；メチオカルブ；ヘプテノフォス；イミダクロプリド；イソプロカルブ；メタミドフォス；メトミル；メビンフォス；パラチオン；パラチオン－メチル；フォサロン；ピリミカルブ；プロポクスール；テフルベンズロン；テルブフォス；トリアザメート；フェノブカルブ；テブフェノジド；フィプロニル；ベーター シフルトリン；シラフルオフェン；フェンピロキシメート；ピリダベン；フェナザキン；ピリプロキシフェン；ピリミジフェン；ニテンピラム；アセトアミピリド；アベルメクチンＢ１（アバメクチン）；エマメクチン；エマメクチン－ベンゾエート；スピノサド；昆虫に対して活性な植物抽出物；線虫を含んで成り、且つ昆虫に対して活性な製剤；バチルス・サブチリス(Bacillus subtillis)から得ることのできる製剤；真菌を含んで成り、且つ昆虫に対して活性な製剤；ウイルスを含んで成り、且つ昆虫に対して活性な製剤；クロルフェナピル；アセフェート；アクリナトリン；アラニルカルブ；アルファメトリン；アミトラズ；ＡＺ６０５４１；アジンフォスＡ；アジンフォスＭ；アザシクロチン；ベンジオカルブ；ベンスルタップ；ベーター シフルトリン；ＢＰＭＣ

；ブロフェンプロクス；ブロモフォスＡ；ブフェンカルブ；ブトカルボキシン；ブチルピリダベン；カズサフォス；カルバリル；カルボフェノチオン；クロエトカルブ；クロレトキシフォス；クロルメフォス；シス－レスメトリン；クロシトリン；クロフェンテジン；シアノフォス；シクロプロトリン；シヘキサチン；デメトンＭ；デメトンＳ；デメトン－Ｓ－メチル；ジクロフェンチオン；ジクリフォス；ジエチオン；ジメトエート；ジメチルビンフォス；ジオキサチオン；エジフェンフォス；エスフェンバレレート；エチオン；エトフェンプロクス；エトプロフォス；エトリムフォス；フェナミフォス；フェンブタチンオキシド；フェノチオカルブ；フェンプロパトリン；フェンピラド；フェンチオン；フルアジアナム；フルシクロクススロン；フルシトリネート；フルフェノクススロン；フルフェノプロクス；フォノフォス；フォスチアゼート；フブフェノプロクス；ＨＣＨ；ヘキサフルムロン；ヘキシチアゾクス；ＩＫＩ－２２０；イプロベンフォス；イソフェンフォス；イソキサチオン；イベルメクチン；マラチオン；メカルバム；メスルフェンフォス；メタアルデヒド；メトルカルブ；ミルベムクチン；モキシデクチン；ナレッド；ＮＣ１８４；オメトエート；オキサミル；オキシデメトンＭ；オキシデプロフォス；ペルメトリン；フェントエート；フォレート；フォスメット；フォキシム；ピリミフォスＭ；ピリミフォスＥ；プロメカルブ；プロパフォス；プロチオフォス；プロトエート；ピラクロフォス；ピラダフェンチオン；ピレスメトリン；ピレトラム；テブフェノジド；サリチオン；セブフォス；サルフォテプ；サルプロフォス；テブフェンピラド；テブピリミフォス；テフルトリン；テメフォス；テルバム；テトラクロルビンフォス；チアクロプリド；チアフェノクス；チオジカルブ；チオファノクス；チオナジン；チューリンジェンシン；トラロメトリン；トリアルテン；トリアゾフォス；トリアズロン；トリクロルフォン；トリフルムロン；トリメタカルブ；バミドチオン；キシリカルブ；ＹＩ５３０１／５３０２；ゼータメトリン；ＤＰＸ－ＭＰ０６２－インドキサカルブ；メトキシフェノジド；ビフェナゼート；ＸＭＣ（３，５－キシリルメチルカルバメート）；又は病原糸状菌メタリジウム・アニソプリアエ(Metarhizium anisopliae)；最も特別にはフィプロニル、チアメトキサム、又はラムダシハロトリン、が含まれる。

【００７９】

前記動物害虫には、例えば欧州特許出願ＥＰ－Ａ－７３６２５２、第５頁、第５５行目～第６頁、第５行目において言及されているものが含まれる。従って、その中で言及されている害虫には、引用によって本発明の対象に含まれる。

【００８０】

また、本発明に従う化合物を用いて、線虫綱の害虫を防除することが可能である。そのような害虫には、例えば根瘤線虫、シスト形成線虫及び更には茎(stem)線虫及び葉線虫；特にヘテロデラ(Heterodera)種のもの、例えばヘテロデラ・シャクチイ(Heterodera Schachtii)、ヘテロドラ・アベナエ(Heterodora avenae)及びヘテロドラ・トリフォリイ(Heterodora trifolii)；グロボデラ(Globodera)種のもの、例えばグロボデラ・ロストチエンシス(Globodera rostochiensis)；メロイドジャイネ(Meloidogyne)種のもの、例えばメロイドジャイネ・インコグニータ(Meloidogyne incognita)及びメロイドジャイネ・ジャバニカ(Meloidogyne javaica)；ラドフォラス(Radopholus)種のもの、例えばラドフォラス・シミリス(Radopholus similis)；プラチレンカス(Pratylenchus)種のもの、例えばプラチレンカス・ネグレクタンス(Pratylenchus neglectans)及びプラチレンカス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)；タイレンチュラス(Tylenchulus)種のもの、例えばタイレンチュラス・セミペネトランス(Tylenchulus semipenetrans)；ロンギドラス(Longidorus)、トリコドラス(Trichodorus)、キシフィネマ(Xiphinema)、ジチレンカス(Ditylenchus)、アフィーンコイデス(Apheenchoide)及びアンギナ(Anguina)種のもの、特にメロイドジャイネ(Meloidogyne)種のもの、例えばメロイドジャイネ・インコグニータ(Meloidogyne incognita)、並びにヘテロデラ(Heterodera)種のもの、例えばヘテロデラ・グリシンス(Heterodera glycines)が含まれる。

【００８１】

本発明の特に重要な側面は、寄生性摂食害虫(parasitic feeding pest)に対する植物の

保護における、本発明に従う式（Ｉ）の化合物の使用にある。

【００８２】

本発明に従う化合物は、植物、特に農業、園芸、及び林業において有用な植物及び装飾植物、そのような植物の一部、例えば果実、花、葉、茎、塊茎又は根の上で発生する上文で言及した型の害虫を防除、すなわち阻害又は破壊するために使用されることがあり、一方で、場合によっては、その後生育する植物の一部もそれらの害虫から保護される。

【００８３】

標的作物には、特に穀類、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、オーツムギ、コメ、トウモロコシ及びモロコシ；ビート、例えばテンサイ及び飼料用ビート；果物、例えばナシ状果、石果及び柔らかい果物、例えばリンゴ、ナシ、プラム、モモ、アーモンド、チェリー及びベリー、例えばストロベリー、ラズベリー及びブラックベリー；マメ科植物、例えばマメ、レンズマメ、エンドウマメ、ダイズ；油脂植物、例えばナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、ヒマシ油、ココア及びラッカセイ；ウリ科植物、例えばマロー、キュウリ及びメロン；繊維植物、コットン、フラックス、ヘンプ及びジュート；柑橘植物、例えばオレンジ、レモン、グレープフルーツ及びマンダリン；野菜、例えばホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ及びパプリカ；クスノキ科、例えばアボカド、シナモン及びショウノウ；及びタバコ、ナッツ、コーヒー、ナス、サトウキビ、チャ、ペッパー、ブドウの木、ホップ、バナナ、天然ゴム植物及び装飾植物が含まれる。

【００８４】

本発明に従う化合物の使用の更なる分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料の保護であり、そして更には衛生領域における、特に上文で言及した型の害虫からの家畜(domestic animal)及び家畜(productive livestock)の保護、更に特別には、家畜(domestic animal)、特にネコ及びイヌのノミ、ダニ及び線虫からの保護である。

【００８５】

従って、本発明はまた、殺虫性の組成物、乳剤、懸濁液、直接噴霧可能な又は希釈可能な溶液、塗布可能なペースト、希釈した乳濁液、水和剤、粉剤、粒剤及びポリマー物質のカプセル充填物に関するものであり、これらは本発明に従う化合物のうち少なくとも１つを含んで成り、製剤の選択は、意図する目的及び現況に従い行われる。

【００８６】

活性成分は、純粋な形態、固体の活性成分、例えば特定の粒径で、あるいは、好ましくは製剤技術において一般的な補助剤、例えば増量剤、例えば溶媒若しくは固形のキャリヤー、又は表面活性化合物（界面活性剤）と一緒に、それらの組成物中で使用される。ヒト、家畜(productive livestock)、家畜(domestic animal)及びペットにおける寄生虫対策の分野において、生理学的に許容される添加物が使用されることは自明であろう。

【００８７】

製剤の補助剤として、例えば固形のキャリヤー、溶媒、安定化剤、「徐放性」補助剤、着色物質及び任意の表面活性物質（界面活性剤）が使用される。適当な担体及び補助剤には、一般的に使用される全ての物質が含まれる。本発明に従い使用される組成物中の補助剤、例えば溶媒、固形のキャリヤー、界面活性化合物、非イオン性界面活性剤、陽イオン性界面活性剤、陰イオン性界面活性剤及び追加の補助剤として、例えば欧州特許出願ＥＰ－Ａ－７３６２５２、第７頁、第５１行目～第８頁、第３９行目において記載されているものが考慮される。

【００８８】

作物の保護及びヒト、家畜(domestic animal)及び家畜(productive livestock)における使用のための組成物は、通常０．１～９９％、特に０．１～９５％、の活性成分、及び１～９９．９％、特に５～９９．９％の少なくとも１つの固形又は液体の補助剤を含んで成り、当該組成物は通常、０～２５％、特に０．１～２０％の界面活性剤（％＝いずれも重量％）を含む。市販の製品は好ましくは濃縮物として調製されるが、最終消費者は、かなり低い濃度の活性成分を含む希釈製剤を通常使用する。

【００８９】
好ましい作物保護製品は、特に以下の組成物（％＝重量パーセント）を含む：
乳剤：
活性成分：　１～９０％、好ましくは５～２０％
界面活性剤：　１～３０％、好ましくは１０～２０％
溶媒：　５～９８％、好ましくは７０～８５％
【００９０】
粉剤：
活性成分：　０．１～１０％、好ましくは０．１～１％
固形キャリヤー：　９９．９～９０％、好ましくは９９．９～９９％
【００９１】
懸濁濃縮液：
活性成分：　５～７５％、好ましくは１０～５０％
水：　９４～２４％、好ましくは８８～３０％
界面活性剤：　１～４０％、好ましくは２～３０％
【００９２】
水和剤：
活性成分：　０．５～９０％、好ましくは１～８０％
界面活性剤：　０．５～２０％、好ましくは１～１５％
固形キャリヤー：　５～９９％、好ましく１５～９８％
【００９３】
粒剤：
活性成分：　０．５～３０％、好ましくは３～１５％
固形キャリヤー：　９９．５～７０％、好ましくは９７～８５％
【００９４】
本発明に従う組成物はまた、追加の固形又は液体の補助剤、例えば安定化剤、例えば植物油又はエポキシ化植物油（例えば、エポキシ化ココナッツ油、ナタネ油又はダイズ油）、消泡剤、例えばシリコン油、保存剤、粘性調節剤、結合剤及び／又は粘着付与剤並びに肥料又は特別な効果を得るためのほかの活性成分、例えば殺ダニ剤、殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺貝又は選択的除草剤を含んで成ることがある。
【００９５】
本発明に従う作物保護製品は、既知の方法で、補助剤無しで、例えば固形の活性成分又は活性成分混合物を粉砕し、ふるいにかけ、そして／あるいは、例えばある粒径に圧縮することによって、そして少なくとも１つの補助剤の存在下で、例えば活性成分又は活性成分混合物と補助剤とをよく混合し、そして／あるいはすりつぶすことによって調製される。本発明はまた、本発明に従う組成物の調製法及び、式（Ｉ）の化合物の、それらの組成物中での使用、に関する。
【００９６】
本発明はまた、作物保護製品の散布法、すなわち、上文で言及した型の害虫を防除する、例えばスプレー、噴霧、散布、コーティング、ドレッシング、散乱又は注入する方法であって、意図する目的及び現況に従い選択される方法、及び上文で言及した型の害虫を防除するための組成物の使用に関する。典型的な濃縮率は、０．１～１０００ｐｐｍ、好ましくは０．１～５００ｐｐｍの活性成分である。１ヘクタール当たりの散布率は、通常１ヘクタール当たり１～２０００ｇ、特に１０～１０００ｇ、好ましくは２０～６００ｇの活性成分である。
【００９７】
作物保護の分野における好ましい散布方法は、植物の茎葉に対する散布（茎葉散布）であり、その散布頻度及び散布率は問題の害虫による繁殖の危険性に依存する。しかしながら、活性成分はまた、植物の根が液体製剤に含浸された場合に、あるいは活性成分が植物

の当該部位内に固形の形態で、例えば土壌内に粒剤の形態（土壌散布）で組み込まれた場合、当該部位を経て植物に浸透する（全体作用）。水稲作物の場合、そのような粒剤が、水田に対して計量した量で散布され得る。

【００９８】

本発明に従う作物保護製品はまた、植物繁殖材料、例えば種、例えば果実、塊茎又は種子、あるいは植物の挿し木を動物害虫から保護するのに適している。前記繁殖材料は、植付けの前に前記組成物で処理されることがあり、例えば種が蒔かれる前にドレッシングされうる。本発明に従う活性成分はまた、液体製剤中に含浸することによって、又はそれらを固形製剤でコーティングすることによって、種子に散布され得る（コーティング）。前記組成物はまた、繁殖材料が種まきされる場合に植付け部位に、例えば種まきの間に種の皺に散布され得る。本発明はまた、植物繁殖材料のそのような処理方法及びそのように処理された植物繁殖材料に関する。

【００９９】

調製例

以下の実施例において、アベルメクチンＢ１誘導体（アベルメクチンＢ１ａ及びＢ１ｂ誘導体混合物）の調製を記す。Ｂ１ｂ誘導体は、通常前記混合物の重量当たりおよそわずかに５～１０％に相当し、そしてその理由により、通常Ｂ１ａのバンドのみがＮＭＲスペクトルにおいて検出されうる。

【０１００】

ＮＭＲデータ情報において使用される略語は、以下の意味を有する：

【０１０１】

ｓ：シングレット、ＭＨｚ：メガヘルツ、ｂｒｓ：ブロードシングレット；ｔ：トリプレット；ｍ：マルチプレット；ｄ：ダブレット；Ｊ：カップリング定数。

【０１０２】

実施例中のＴＢＤＭＳは、遊離基－Ｓｉ（CH_3）$_2$（ｔｅｒｔ－ブチル）を表し、R_1はイソプロピルとｓｅｃ－ブチルの混合物を表す。

【０１０３】

前記化合物は多くの場合アベルメクチンＢ１ａ及びＢ１ｂ誘導体の混合物の形態にあるので、通常の物理的データ、例えば融点又は屈折指数による特徴づけはほとんど役に立たない。その理由により、前記化合物は、ＮＭＲ分光法、続くクロマトグラフィーによる精製によって、又はＨＰＬＣ（高分解能液体クロマトグラフィー）による解析において決定された保持時間を参照して特徴付けられる。本調製例上での物理的データにおける用語「Ｂ１ａ」は、主成分（ここで、R_1はsec-ブチルである）を意味しており、通常８０％超の含量を有する。「Ｂ１ｂ」は二次成分（ここで、R_1はイソプロピルである）を表している。保持時間がＢ１ａの例においてのみ示されている化合物の場合、Ｂ１ｂ誘導体が少ない割合のため、Ｂ１ｂ成分の保持時間を決定することはできない。Ｂ１ａ及びＢ１ｂ成分の正確な構造の配分は、質量分析によって決定される。

【０１０４】

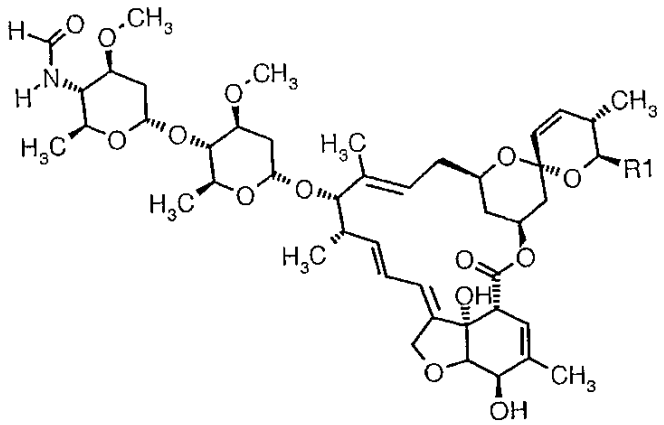
特に断らない限り以下の方法をＨＰＬＣ解析に使用する。

【０１０５】

【表１】

HPLC 勾配条件			
溶媒 A:	0.01% トリフルオロ酢酸／水		
溶媒 B:	0.01% トリフルオロ酢酸／CH_3CN		
時間［分］	A [%]	B [%]	流速［μl／分］
0	80	20	500
0.1	50	50	500
10	5	95	500
15	0	100	500
17	0	100	500
17.1	80	20	500
22	80	20	500
カラム：	YMC-Pack ODS-AQ		
カラム長：	125 mm		
カラム内径：	2 mm		
温度：	40 °C		

【０１０６】
化合物のクロマトグラフィーに使用するYMC-Pack ODS-AQカラムは、YMC (Alte Raesfelderstrasse 6,46514 Schermbeck, Germany)によって製造される。
【０１０７】
実施例Ｐ．１）：式
【化１１】



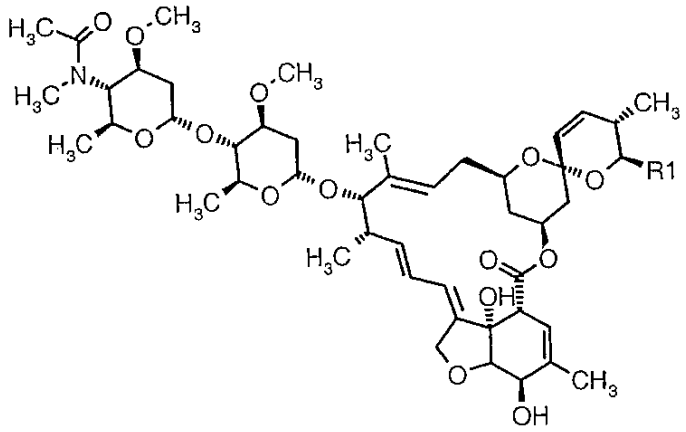
の４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－ホルミルアミノ－アベルメクチンB_1の調製
０．０５ｍｌのギ酸－酢酸無水物を１００ｍｇ（０．１１５ミリモル）の４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－アミノ－アベルメクチンB_1の、４ｍｌのＴＨＦの溶液に対し室温で添加し、そして混合物を１５時間放置する。ワークアップのために、当該混合物を水の上

に注ぎ、そして３回酢酸エチルで抽出する。一緒にした有機相を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、そして硫酸ナトリウム上で脱水する。粗製産物をジクロロメタン／メタノール（９：１）中のシリカゲル上で生成する。高真空下での乾燥の後、４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－ホルミルアミノ－アベルメクチンB_1がＬＣ－ＭＳ解析において以下のシグナルを示す回転異性体の混合物として得られる：t_{RT}，B_{1a}：7.80 min (88.3%)，900.5 (M+H)，B_{1b}:7.00 min (11.7%)，908.4 (M+Na)（化合物１．００１）。

【０１０８】

実施例Ｐ．２）：式

【化１２】



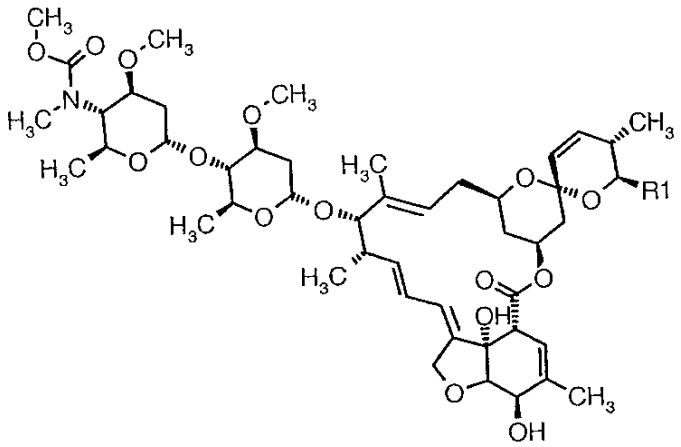
の４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－アセチルアミノ－アベルメクチンB_1の調製

１００ｍｇの４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチルアミノ－アベルメクチンB_1／５ｍｌの酢酸エチル及び１１．３ｍｌの飽和炭酸水素ナトリウムの溶液から成る激しく撹拌した二相の溶液を、１１５ｍｇの無水酢酸で６０時間、７０℃でアルゴン雰囲気のもと処理する。酢酸エチルによる水性ワークアップ及び酢酸エチル／ヘキサン（５：１）中のシリカゲル上での生成により、ＬＣ－ＭＳ解析において以下のシグナルを示す回転異性体混合物として、４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－アセチルアミノ－アベルメクチンB_1が生成する：t_{RT}，B_{1a}：8.80 min (broad, 100%)，928.7 (M+H)，B_{1b}：8.16 min（化合物１．００２）。

【０１０９】

実施例Ｐ．３）：式

【化１３】



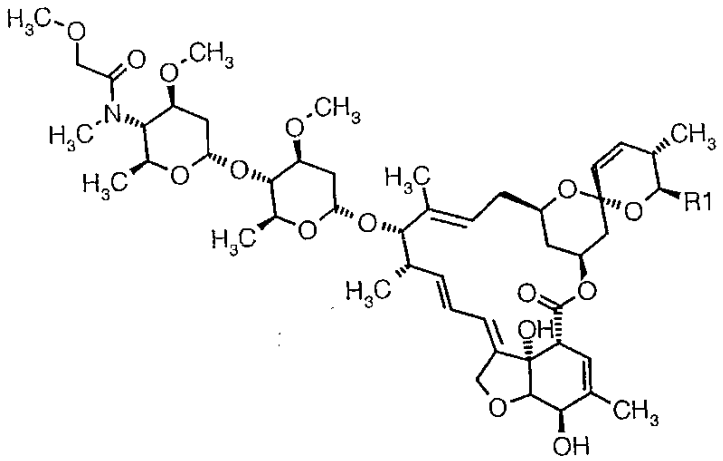
の４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－メトキシカルボニルアミノ－アベルメクチン$Ｂ_1$の調製

１００ｍｇの４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチルアミノ－アベルメクチン$Ｂ_1$／５ｍｌの酢酸エチル及び１１．３ｍｌの飽和炭酸水素ナトリウムの溶液から成る激しく撹拌した二相の溶液を、０．０８７ｍｌのクロロギ酸メチルエステルで３時間、６５℃でアルゴン雰囲気のもと処理する。酢酸エチルによる水性ワークアップ、続く酢酸エチル／ヘキサン（１：１）中のシリカゲル上での生成により、ＬＣ－ＭＳ解析において以下のシグナルを示す回転異性体混合物として、４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－メトキシカルボニルアミノ－アベルメクチン$Ｂ_1$が生成する：t_{RT}, B_{1a} : 10.09 min (86.7%), 966.5 (M+Na), B_{1b} : 8.97 min (8.5%): 952.4 (M+Na)（化合物１．００３）。

【０１１０】

実施例Ｐ．４）：式

【化１４】

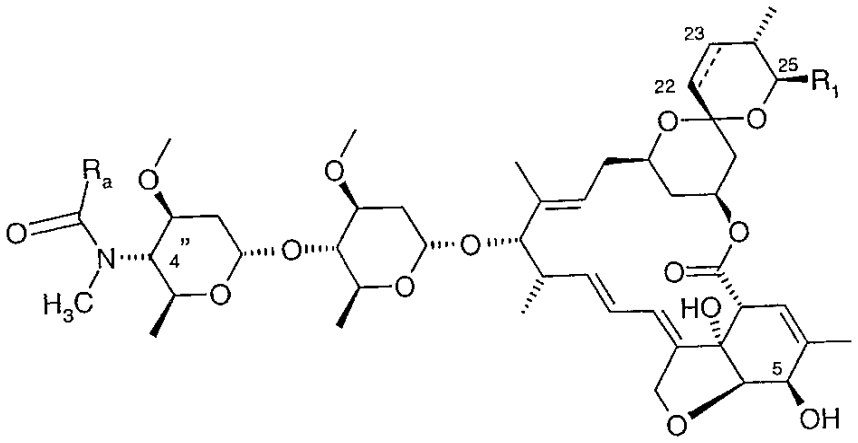


の４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－メトキシアセチルアミノ－アベルメクチ

ンB$_1$の調製
１００ｍｇの４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－アミノ－アベルメクチンB$_1$／５ｍｌの酢酸エチル及び１１．３ｍｌの飽和炭酸水素ナトリウムの溶液から成る激しく攪拌した二相の溶液を、０．１０３ｍｌのメトキシアセチルクロリドで１２時間、７０℃でアルゴン雰囲気のもと処理する。酢酸エチルによる水性ワークアップ、続くジクロロメタン／メタノール（９５：５）中のシリカゲル上での生成により、ＬＣ－ＭＳ解析において以下のシグナルを示す回転異性体混合物として、４”－デオキシ－４”－（Ｓ）－Ｎ－メチル－メトキシアセチルアミノ－アベルメクチンB$_1$が生成する：t_{RT}, B_{1a} : 8.58-8.70 min (92.7%), 980 (M+Na), B_{1b} : 8.22 min (7.3%), 966.5 (M+Na)（化合物１．００４）。

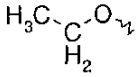
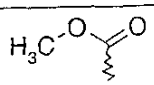
【０１１１】
実施例Ｐ．５）：
同様に、以下の表１Ａ～１Ｆの化合物を調製する。当該表において、記号
【化１５】

は、問題の遊離基が分子の残りに結合する結合を示す。
【０１１２】
表１Ａ：式
【化１６】

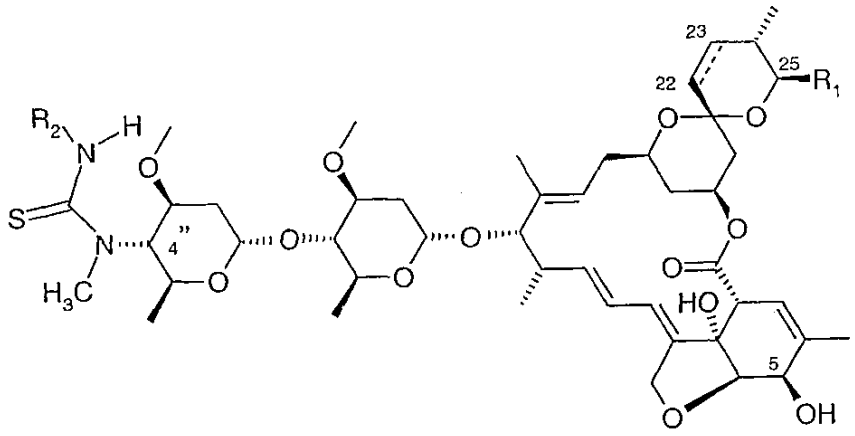


（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR$_1$はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルである）の化合物

【表２】

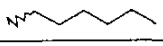
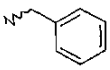
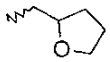
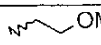
番号	R_a	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1A.005	H	8.58	8.30
1A.006	フェニル	10.62	9.56
1A.007		10.73	9.66
1A.008		9.44	8.69

【０１１３】
表１Ｂ：式
【化１７】

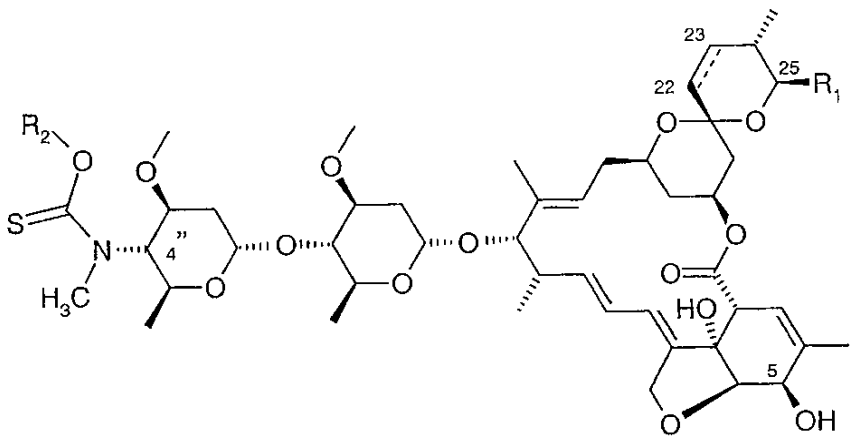


（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR_1はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルである）の化合物

【表３】

番号	R_2	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1B.1		10.2	
1B.2		9.8	9.2
1B.3		10.2	
1B.4		9.4	8.8
1B.5		10.8	10.1
1B.6		11.7	
1B.7		11.3	10.6
1B.8		10.6	9.9
1B.9		9.9	9.1
1B.10		9.5	8.7

【０１１４】
表１Ｃ：式
【化１８】

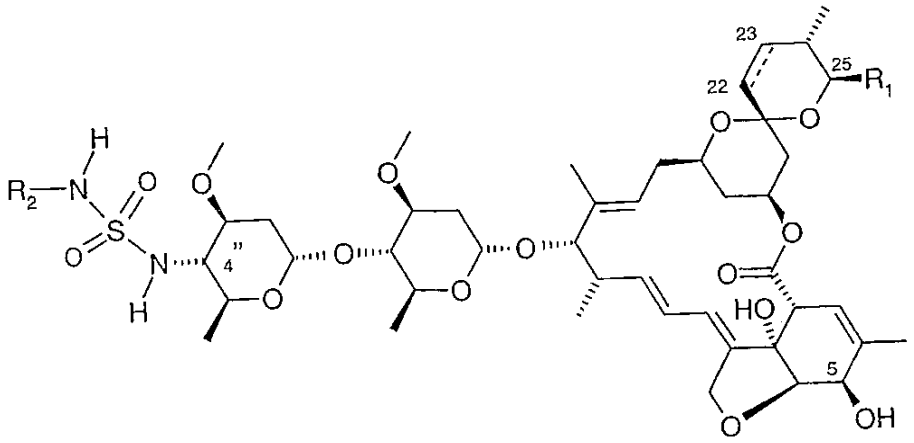


（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR_1はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルである）の化合物

【表４】

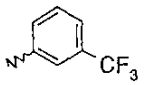
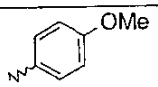
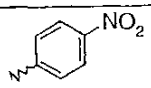
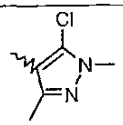
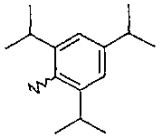
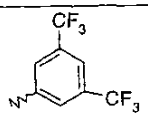
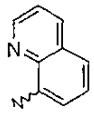
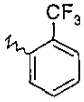
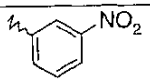
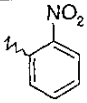
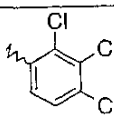
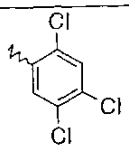
番号	R_2	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1C.1	エチル	11.2	10.5

【０１１５】
表１Ｄ：式
【化１９】



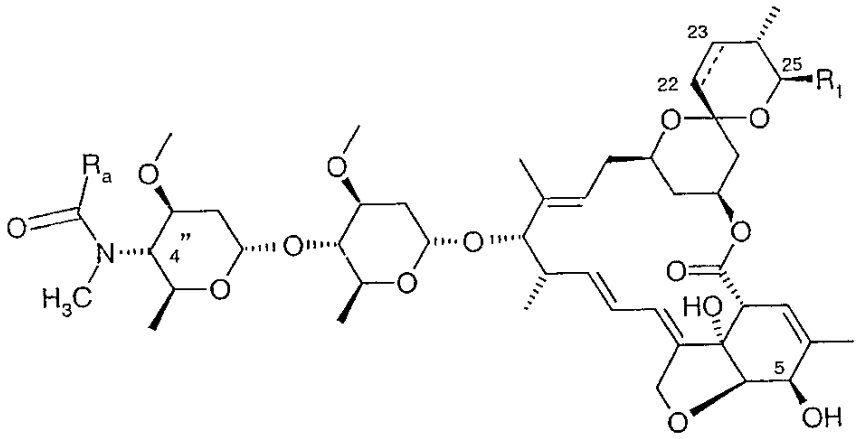
（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR_1はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルである）の化合物

【表５】

番号	R_2	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1D.1		11.6	11.0
1D.2		10.7	-
1D.3		11.0	
1D.4		-	-
1D.5		-	-
1D.6		12.5	12.0
1D.7		11.9	11.2
1D.8		-	-
1D.9		11.0	10.4
1D.10		-	-
1D.11		-	-
1D.12		-	-

【０１１６】
表１Ｅ：式

【化２０】

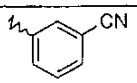
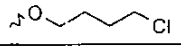
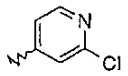
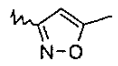
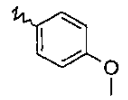
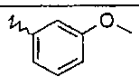
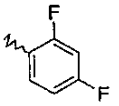
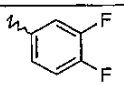
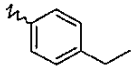
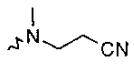
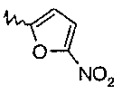
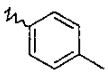
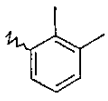
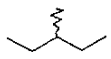


（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR_1はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルであり；且つ以下の方法がＨＰＬＣ解析に使用される）の化合物

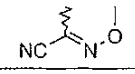
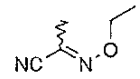
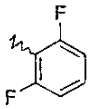
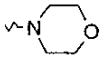
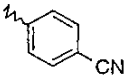
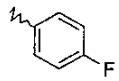
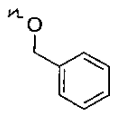
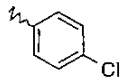
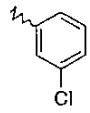
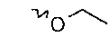
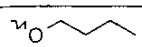
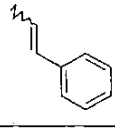
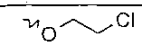
【表６】

HPLC 勾配条件				
溶媒　A (%):	45.0 H_2O（0.1%トリフルオロ酢酸及び10% CH_3CNを含有）			
溶媒　B (%):	55.0 CH_3CN（0.1%トリフルオロ酢酸を含有）			
溶媒　C (%):	CH_3OH			
時間［分］	A [%]	B [%]	C [%]	流速［ml／分］
0.00	45	55	0	3.50
3.50	0	90	10	3.50
3.80	0	90	10	3.50
4.00	45	55	10	3.50
カラム：	YMC CombiScreen ODS-AQ			
カラム長：	30 mm			
カラム内径：	4.6 mm			
温度：	40 °C			

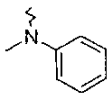
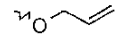
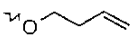
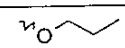
【表７】

番号	R_a	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1E.1		2.20	2.00
1E.2		2.70	2.32
1E.3		2.20	2.07
1E.4		2.20	1.98
1E.5		2.30	1.98
1E.6		2.40	2.03
1E.7		2.50	2.11
1E.8		2.60	2.23
1E.9		2.80	2.40
1E.10		1.70	1.30
1E.11		2.10	2.04
1E.12		2.20	2.03
1E.13		2.30	2.03
1E.14		2.70	2.20
1E.15		2.60	2.20
1E.16		2.50	2.00

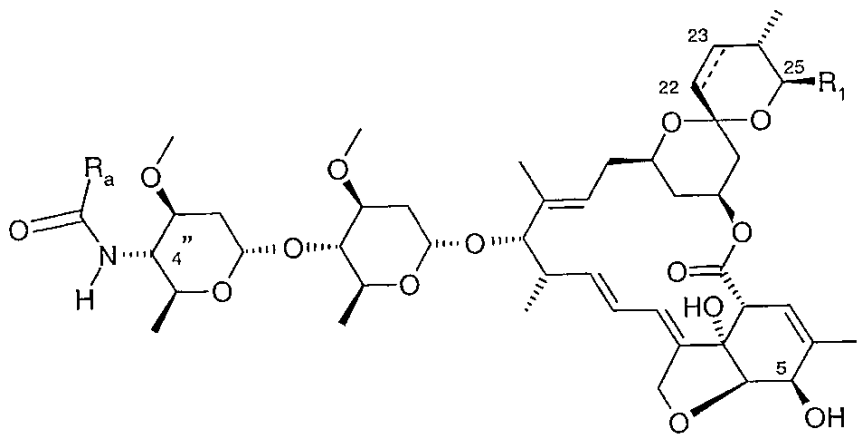
【表８】

番号	R_a	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1E.17		1.70	1.70
1E.18		2.60	2.20
1E.19		2.40	2.19
1E.20		2.10	1.69
1E.21		2.40	1.94
1E.22		1.80	1.30
1E.23		1.60	1.40
1E.24		2.20	1.94
1E.25		2.40	2.07
1E.26		2.70	2.40
1E.27		1.60	1.60
1E.28		2.70	2.57
1E.29		2.40	1.94
1E.30		2.70	2.44
1E.31		2.70	2.19
1E.32		2.70	2.07
1E.33		2.40	2.03

【表９】

番号	R_a	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1E.34		2.70	1.90
1E.35		1.4	1.4
1E.36		2.40	1.90
1E.37		2.50	2.03
1E.38		1.80	1.80
1E.39		2.70	2.19
1E.40		2.20	1.90

【０１１７】
表１Ｆ：式
【化２１】

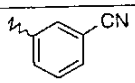
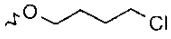
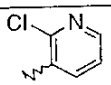
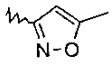
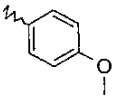
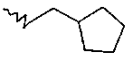
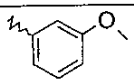
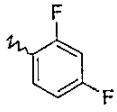


（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合であり、且つR_1はイソプロピル又はｓｅｃ－ブチルであり；且つ以下の方法がＨＰＬＣ解析に使用される）の化合物

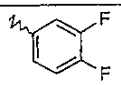
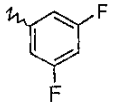
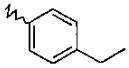
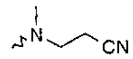
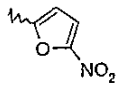
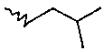
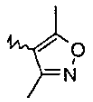
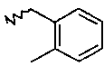
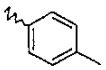
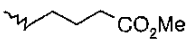
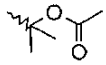
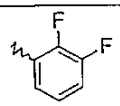
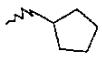
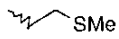
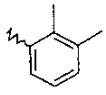
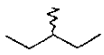
【表１０】

HPLC 勾配条件			
溶媒　A (%):	40.0 H_2O （0.1% HCO_2Hを含有）		
溶媒　B (%):	60.0 CH_3CN （0.1% HCO_2Hを含有）		
時間［分］	A [%]	B [%]	流速［ml／分］
0.00	40	60	3.50
3.50	0	100	3.50
3.80	0	100	3.50
4.00	40	60	3.50
カラム：	YMC CombiScreen ODS-AQ		
カラム長：	30 mm		
カラム内径：	4.6 mm		
温度：	40 °C		

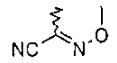
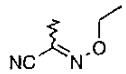
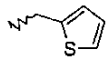
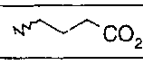
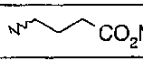
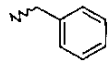
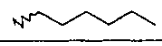
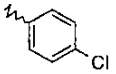
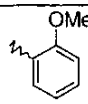
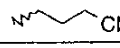
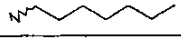
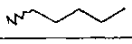
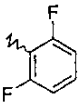
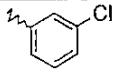
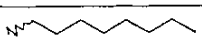
【表１１】

番号	R_a	LC-MS: t_{RT}	
		B_{1a}（分）	B_{1b}（分）
1F.1		1.9	1.6
1F.2		2.1	1.9
1F.3		1.5	1.3
1F.4		1.8	1.5
1F.5		1.8	1.5
1F.6	 *syn*	1.4	1.2
1F.7		2.2	1.9
1F.8		1.9	1.7
1F.9		1.9	1.6
1F.10		1.6	1.4
1F.11		1.9	1.7

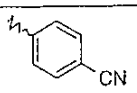
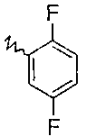
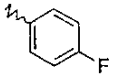
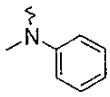
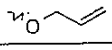
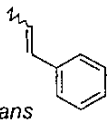
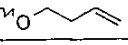
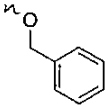
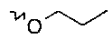
【表１２】

1F.12		2.0	1.8
1F.13		2.1	1.9
1F.14		2.2	1.9
1F.15		1.7	1.5
1F.16		1.2	1.0
1F.17		1.8	1.5
1F.18		1.9	1.6
1F.19		1.9	1.7
1F.20		1.6	1.4
1F.21		1.9	1.7
1F.22		1.9	1.7
1F.23		1.5	1.2
1F.24		1.4	1.2
1F.25		1.5	1.3
1F.26		2.0	1.7
1F.27		1.9	1.7
1F.28		1.5	1.2
1F.29		2	1.7
1F.30		1.8	1.6

【表１３】

1F.31		1.9	1.7
1F.32		2.0	1.8
1F.33		2.0	1.7
1F.34		1.7	
1F.35		1.5	1.3
1F.36		1.3	
1F.37		1.9	1.6
1F.38		1.7	1.5
1F.39		2.2	1.9
1F.40		1.5	1.3
1F.41		1.7	1.4
1F.42		2.1	1.8
1F.43		1.5	1.3
1F.44		1.9	1.7
1F.45		1.6	1.4
1F.46		2.4	2.1
1F.47		1.5	1.3
1F.48		1.9	1.7
1F.49		1.8	1.5
1F.50		1.3	1.1
1F.51		2.2	1.9
1F.52		2.7	2.4

【表１４】

1F.53		1.8	1.5
1F.54		2.0	1.7
1F.55		1.9	1.6
1F.56		2.1	1.8
1F.57		1.7	1.5
1F.58		1.7	1.5
1F.59		1.9	1.6
1F.60		1.7	1.5
1F.61	 trans	1.9	1.7
1F.62		2.0	1.8
1F.63		2.2	1.9
.1F.64		2.0	1.7

【０１１８】

上記調製例と同様に、表２～７１に列記する化合物も調製されうる。表Ａにおいて、記号

【化２２】

は、問題の遊離基がＺに結合する結合を示す。

【０１１９】

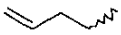
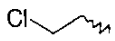
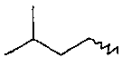
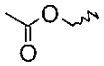
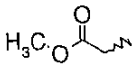
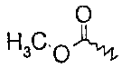
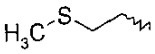
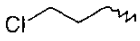
表Ａ：式（Ｉ）（ここで、R_1，R_3，Ｘ及びＺは式（Ｉ）で定義した通りであり；且つ炭素原子２２位と２３位の間の結合は二重結合である）の化合物

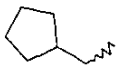
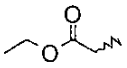
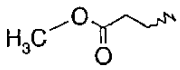
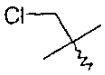
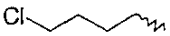
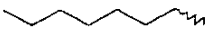
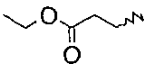
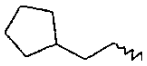
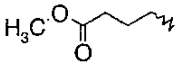
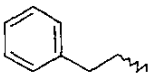
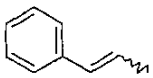
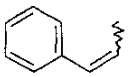
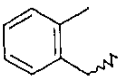
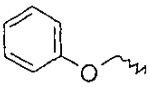
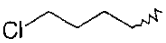
【表１５】

番号	R_2
A.1	H
A.2	フェニル
A.3	CH_3-O-CH_2-
A.4	メチル
A.5	

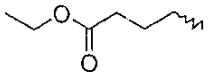
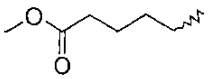
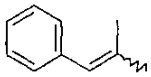
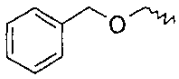
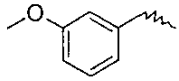
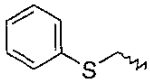
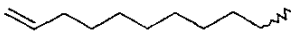
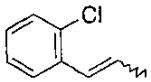
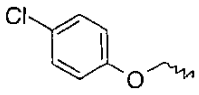
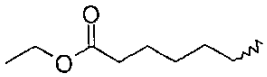
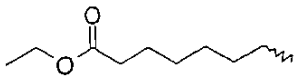
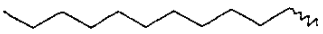
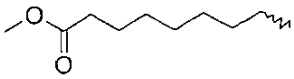
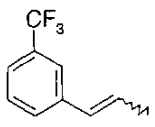
番号	R_2
A.6	エチル
A.7	
A.8	

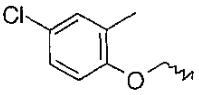
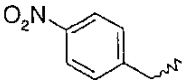
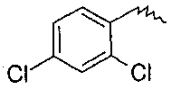
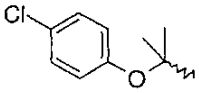
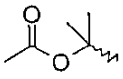
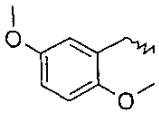
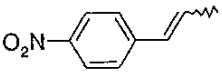
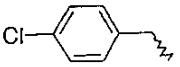
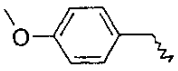
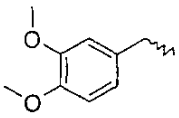
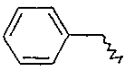
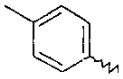
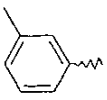
【表１６】

番号	R_2
A.9	シクロプロピル
A.10	イソプロピル
A.11	n-プロピル
A.12	n-ブチル
A.13	
A.14	シクロブチル
A.15	
A.16	イソプロピル
A.17	
A.18	
A.19	
A.20	シクロペンチル
A.21	
A.22	
A.23	
A.24	n-ヘキシル
A.25	t-ブチル
A.26	
A.27	
A.28	
A.29	
A.30	
A.31	2-Cl-エチル
A.32	シクロヘキシル

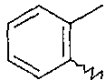
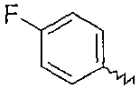
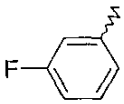
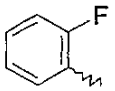
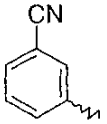
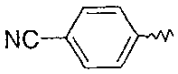
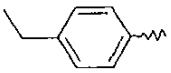
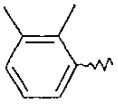
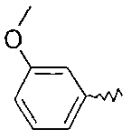
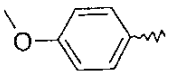
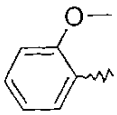
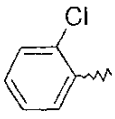
番号	R_2
A.33	
A.34	n-ヘプチル
A.35	
A.36	
A.37	
A.38	
A.39	
A.40	
A.41	
A.42	
A.43	
A.44	
A.45	
A.46	
A.47	
A.48	
A.49	
A.50	

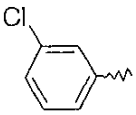
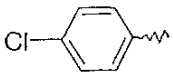
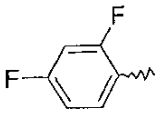
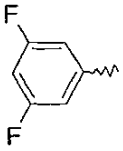
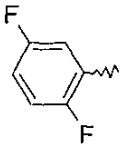
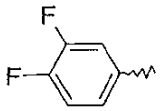
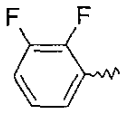
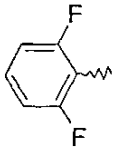
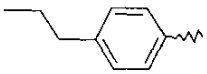
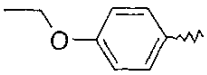
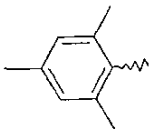
【表１７】

番号	R_2
A.51	
A.52	
A.53	
A.54	
A.55	
A.56	
A.57	
A.58	n-オクチル
A.59	
A.60	
A.61	
A.62	
A.63	
A.64	
A.65	
A.66	
A.67	

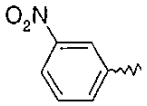
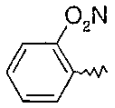
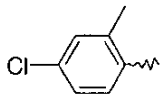
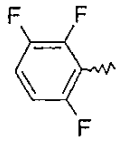
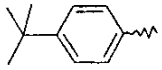
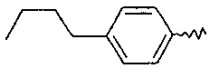
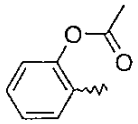
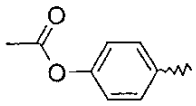
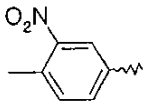
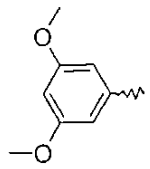
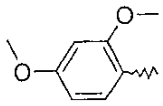
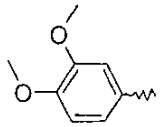
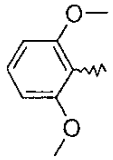
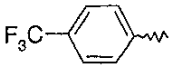
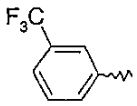
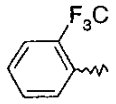
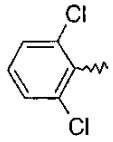
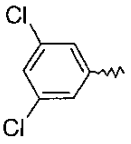
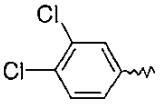
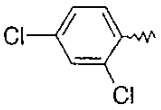
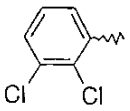
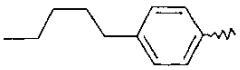
番号	R_2
A.68	
A.69	
A.70	
A.71	
A.72	
A.73	
A.74	
A.75	
A.76	
A.77	
A.78	
A.79	
A.80	
A.81	

【表１８】

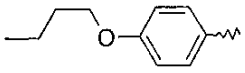
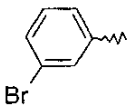
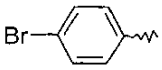
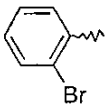
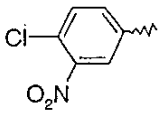
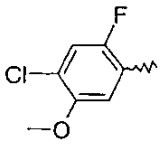
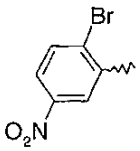
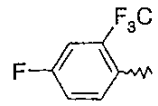
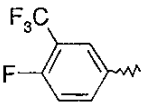
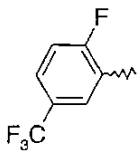
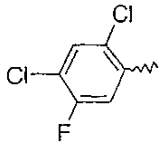
番号	R_2
A.82	
A.83	
A.84	
A.85	
A.86	
A.87	
A.88	
A.89	
A.90	
A.91	
A.92	
A.93	

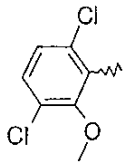
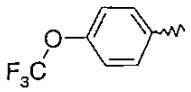
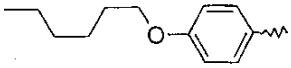
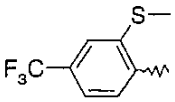
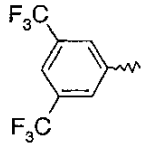
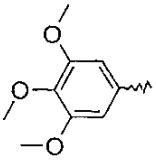
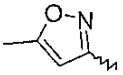
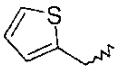
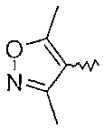
番号	R_2
A.94	
A.95	
A.96	
A.97	
A.98	
A.99	
A.100	
A.101	
A.102	
A.103	
A.104	

【表１９】

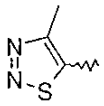
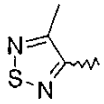
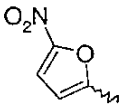
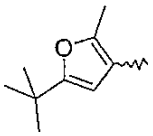
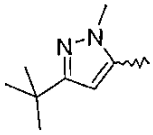
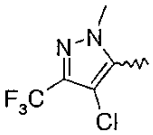
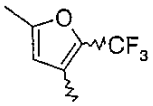
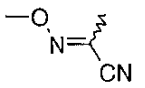
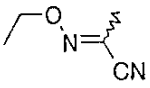
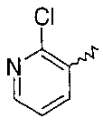
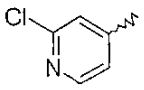
番号	R_2
A.105	
A.106	
A.107	
A.108	
A.109	
A.110	
A.111	
A.112	
A.113	
A.114	
A.115	
A.116	
A.117	
A.118	
A.119	
A.120	
A.121	
A.122	
A.123	
A.124	
A.125	
A.126	

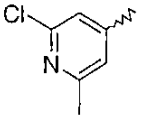
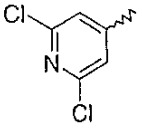
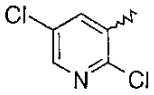
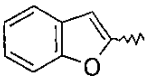
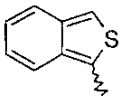
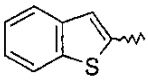
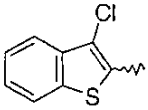
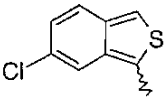
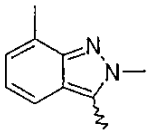
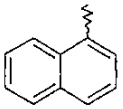
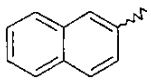
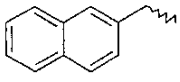
【表２０】

番号	R_2
A.127	
A.128	
A.129	
A.130	
A.131	
A.132	
A.133	
A.134	
A.135	
A.136	
A.137	

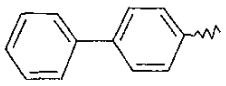
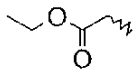
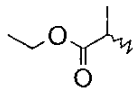
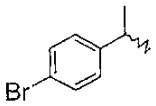
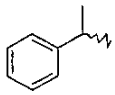
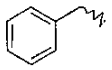
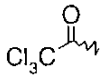
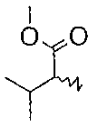
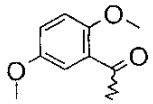
番号	R_2
A.138	
A.139	
A.140	
A.141	
A.142	
A.143	
A.144	
A.145	
A.146	
A.147	
A.148	

【表２１】

番号	R_2
A.149	
A.150	
A.151	
A.152	
A.153	
A.154	
A.155	
A.156	
A.157	
A.158	
A.159	

番号	R_2
A.160	
A.161	
A.162	
A.163	
A.164	
A.165	
A.166	
A.167	
A.168	
A.169	
A.170	
A.171	

【表２２】

番号	R_2
A.172	
A.173	
A.174	
A.175	
A.176	
A.177	
A.178	
A.179	$(C_2H_5O)_3Si\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}CH_2\text{-}$
A.180	$CCl_3\text{-}$
A.181	
A.182	
A.183	

【０１２０】
表２：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２１】
表３：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２２】
表４：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はエチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２３】
表５：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はｎ－プロピルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２４】
表６：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２５】
表７：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１２６】
表８：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）

であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＨであり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１２７】

表９：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＨであり、且つ$Ｒ_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１２８】

表１０：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＯであり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１２９】

表１１：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＯであり、且つ$Ｒ_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３０】

表１２：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３１】

表１３：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つ$Ｒ_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３２】

表１４：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３３】

表１５：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つ$Ｒ_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３４】

表１６：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３５】

表１７：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つ$Ｒ_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３６】

表１８：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つ$Ｒ_3$はエチルであり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３７】

表１９：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つ$Ｒ_3$は水素であり、且つ化合物の置換基$Ｒ_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３８】

表２０：式（Ｉ）（ここで、$Ｒ_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ

）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＣＨ$_3$であり、且つＲ$_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１３９】

表２１：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＳであり、且つＲ$_3$はＨであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４０】

表２２：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＳであり、且つＲ$_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４１】

表２３：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＣＨ$_3$であり、且つＲ$_3$はＨであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４２】

表２４：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＣＨ$_3$であり、且つＲ$_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４３】

表２５：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$は水素であり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４４】

表２６：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４５】

表２７：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$はエチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４６】

表２８：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$はｎ－プロピルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４７】

表２９：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$は水素であり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４８】

表３０：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つＲ$_3$はメチルであり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１４９】

表３１：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＨであり、且つＲ$_3$は水素であり、且つ化合物の置換基Ｒ$_2$は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５０】

表３２：式（Ｉ）（ここで、Ｒ$_1$はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘ

はＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５１】

表３３：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＯであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５２】

表３４：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＯであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５３】

表３５：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５４】

表３６：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５５】

表３６：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５６】

表３７：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５７】

表３８：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５８】

表３９：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１５９】

表４０：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１６０】

表４１：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3はエチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１６１】

表４２：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１６２】

表４３：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１６３】
表４４：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＳであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６４】
表４５：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＳであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６５】
表４６：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６６】
表４７：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６７】
表４８：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６８】
表４９：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１６９】
表５０：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はエチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７０】
表５１：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はｎ－プロピルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７１】
表５２：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７２】
表５３：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７３】
表５４：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７４】
表５５：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７５】
表５６：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり

、ＸはＯであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７６】
表５７：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＯであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７７】
表５８：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７８】
表５９：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）であり、ＸはＯであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１７９】
表６０：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８０】
表６１：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８１】
表６２：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８２】
表６３：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８３】
表６４：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結合であり、且つR_3はエチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８４】
表６５：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８５】
表６６：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、Ｘは結NCH_3であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８６】
表６７：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＳであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８７】
表６８：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＳであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物

【０１８８】
表６９：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１８９】
表７０：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3はＣH_3であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９０】
表７１：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９１】
表７２：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９２】
表７３：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９３】
表７４：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９４】
表７５：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９５】
表７６：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９６】
表７７：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９７】
表７８：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＮＣH_3であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９８】
表７９：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０１９９】
表８０：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．

１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２００】
表８１：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０１】
表８２：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０２】
表８３：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０３】
表８４：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０４】
表８５：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3は水素であり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０５】
表８６：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）であり、ＸはＳであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０６】
表８７：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはＮＨであり、且つR_3はメチルであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０７】
表８８：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－であり、ＸはNCH_3であり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2は、表Ａの列Ａ．１～Ａ．１８３のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２０８】
表８９：表２～８８の化合物（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は単結合である）
【０２０９】
表Ｂ：一般式（Ｉ）（ここで、R_1，R_3及びＺは式（Ｉ）に記載の通りであり、且つ炭素原子２２位と２３位との間の結合は二重結合である）の化合物

【表２３】

番号	R_2	R_4
B.1	$-CH_2CH_2CH_2-$	
B.2	$-CH_2(CH_2)_2CH_2-$	
B.3	$-CH_2(CH_2)_3CH_2-$	
B.4	$-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$	
B.5	$-CH_2CH(CH_3)OCH(CH_3)CH_2-$	
B.6	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2-$	
B.7	$-CH_2CH_2NHCH_2CH_2-$	
B.8	$-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2-$	

【０２１０】
表９０：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１１】
表９１：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１２】
表９２：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１３】
表９３：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１４】
表９４：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１５】
表９５：式（Ｉ）（ここで、R_1はｓｅｃ－ブチル（Ｂ１ａ）又はイソプロピル（Ｂ１ｂ）であり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１６】
表９６：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１７】
表９７：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物
【０２１８】

表９８：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２１９】

表９９：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２０】

表１００：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２１】

表１０１：式（Ｉ）（ここで、R_1はシクロヘキシルであり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２２】

表１０２：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２３】

表１０３：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｏ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２４】

表１０４：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２５】

表１０５：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、Ｚは－Ｃ（＝Ｓ）－であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２６】

表１０６：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はＨであり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２７】

表１０７：式（Ｉ）（ここで、R_1は１－メチル－ブチルであり、ＺはSO_2であり、ＸはＮであり、且つR_3はCH_3であり、且つ化合物の置換基R_2及びR_4は、表Ｂの列Ｂ．１～Ｂ．８のいずれか１つに相当する）の化合物

【０２２８】

表１０８：表７２～８９の化合物（ここで、炭素原子２２位と２３位の間の結合は単結合である）

【０２２９】

作物保護における使用のための製剤例（％＝重量パーセント）

実施例Ｆ１：乳剤	ａ）	ｂ）	ｃ）
活性成分	２５％	４０％	５０％
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	５％	８％	６％
ヒマシ油ポリエチレングリコールエーテル（３６モルＥＯ）	５％	－	－
トリブチルフェノールポリエチレングリコールエーテル	－	１２％	４％

（３０モルＥＯ）
シクロヘキサノン － １５％ ２０％
キシレン混合物 ６５％ ２５％ ２０％
細かく粉砕した活性成分と添加物を混合することにより、水で希釈した所望の濃度の乳濁液を生成する乳剤が生じる。
【０２３０】
実施例Ｆ２：溶液 ａ） ｂ） ｃ） ｄ）
活性成分 ８０％ １０％ ５％ ９５％
エチレングリコールモノメチルエーテル ２０％ － －
ポリエチレングリコール（ＭＷ４００） － ７０％ －
Ｎ－メチルピロリド－２－オン ２０％ － － －
エポキシ化ココナッツ油 － － － １％
ベンジン（沸点範囲：１６０～１９０℃） － － ９４％ －
細かく粉砕した活性成分と添加物を混合することにより、微小滴の形態での使用に適した溶液が生じる。
【０２３１】
実施例Ｆ３：粒剤 ａ） ｂ） ｃ） ｄ）
活性成分 ５％ １０％ ８％ ２１％
カオリン ９４％ － ７９％ ５４％
高分散ケイ酸 １％ － １３％ ７％
アタパルジャイト － ９０％ － １８％
活性成分をジクロロメタンに溶解し、当該溶液をキャリヤー混合物上に噴霧し、そして溶媒を減圧下で蒸発させる。
【０２３２】
実施例Ｆ４：水和剤 ａ） ｂ） ｃ）
活性成分 ２５％ ５０％ ７５％
リグノスルホン酸ナトリウム ５％ ５％ －
ラウリル硫酸ナトリウム ３％ － ５％
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム － ６％ １０％
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル － ２％ －
（７～８モルＥＯ）
高分散ケイ酸 ５％ １０％ １０％
カオリン ６２％ ２７％ －
活性成分と添加物を一緒に混合し、そして当該混合物を適当なミル内ですりつぶすことで、水で希釈されて所望の濃度の懸濁液を形成しうる水和剤が生成する。
【０２３３】
実施例Ｆ５：乳剤
活性成分 １０％
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル（４～５モルＥＯ） ３％
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム ３％
ヒマシ油ポリエチレングリコールエーテル（３６モルＥＯ） ４％
シクロヘキサノン ３０％
キシレン混合物 ５０％
細かく粉砕した活性成分と添加物を混合し、水で希釈した所望の濃度の乳濁液を生成する乳剤をもたらす。
【０２３４】
実施例Ｆ６：押出粒剤
活性成分 １０％
リグノスルホン酸ナトリウム ２％
カルボキシメチルセルロース １％

カオリン　８７％
活性成分と添加物を一緒に混合し、当該混合物を粉砕し、水で湿らせ、押出し、そして造粒し、そして当該粒剤は気流内で乾燥される。
【０２３５】
実施例Ｆ７：コーティング型粒剤
活性成分　３％
ポリエチレングリコール（ＭＷ２００）　３％
カオリン　９４％
ミキサー内での、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに対する細かく粉砕した活性成分の均一な適用により、無粉塵性のコーティング粒剤が生成する。
【０２３６】
実施例Ｆ８：懸濁液
活性成分　４０％
エチレングリコール　１０％
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル（１５モルＥＯ）　６％
リグノスルホン酸ナトリウム　１０％
カルボキシメチルセルロース　１％
ホルムアルデヒド水溶液（３７％）　０．２％
水性シリコン油乳濁液（７５％）　０．８％
水　３２％
細かく粉砕した活性成分と添加物を混合し、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を生成する懸濁液濃縮物をもたらす。
【０２３７】
生物学的実施例：
実施例Ｂ１：スポドプテラ・リトラリス(Spodoptera littoralis)に対する作用
若いダイズ植物を、１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る水性乳濁液のスプレー混合物で噴霧し、スプレーコーティングが乾燥した後、当該植物は、第一段階にある１０匹の毛虫のスポドプテラ・リトラリス(Spodoptera littoralis)が住まわされ、そしてプラスチック容器内に植えられる。３日後、個体群の低下率及び食害の低下率（％活性）が、処理した植物上での死んだ毛虫の数及び食害と、未処理の植物上のものと比較することによって決定される。
【０２３８】
当該表の化合物は、本試験において良好な活性を示す。特に、化合物１．００２、１．００４及び１．００５は９０％以上本試験において有効である。
【０２３９】
実施例Ｂ２：スポドプテラ・リトラリス(Spodoptera littoralis)に対する全身作用
トウモロコシの苗を１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る試験溶液中に据える。６日後、葉を切り落とし、ペトリ皿中の湿ったろ紙上に据え、そしてL_1期の１２～１５匹のスポドプテラ・リトラリス(Spodoptera littoralis)の幼虫を群がらせる。４日後、個体群の低下率（％活性）が、処理した植物上で死んだ毛虫の数と、未処理の植物上でのものとを比較することによって決定される。
【０２４０】
当該表の化合物は、本試験において良好な活性を示す。特に、１．００１～１．００８は９０％以上本試験において有効である。
【０２４１】
実施例Ｂ３：ヘリオディス・ヴィレセンス(Heliothis virescens)に対する作用
０～２４時齢の、３０～３５個のヘリオディス・ヴィレセンス(Heliothis virescens)の卵を、人工の栄養層を載せたペトリ皿内のろ紙上に据える。０．８ｍｌの１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る試験溶液を当該ろ紙上にピペッティングする。６日後に評価を行う。個体群の低下率（％活性）が、処理した植物上で死んだ卵及び幼虫の数と、未処

理の植物上でのものとを比較することによって決定される。

【０２４２】

当該表の化合物は、本試験において良好な活性を示す。特に、１．００２、１．００４及び１．００５は９０％以上本試験において有効である。

【０２４３】

実施例Ｂ４：プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella)の毛虫に対する作用

若いキャベツ植物に、１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る水性乳剤のスプレー混合物をスプレーする。スプレーコーティングが乾燥した後、キャベツ植物は、第一段階にある１０匹の毛虫のプルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella)が住まわされ、そしてプラスチック容器内に植えられる。評価は３日後にする。個体群の低下率及び食害の低下率（％活性）が、処理した植物上での死んだ毛虫の数及び食害と、未処理の植物上のものとを比較することによって決定される。

【０２４４】

当該表の化合物は、本試験においてプルテラ・キシロステラに対して良好な活性を示す。特に、１．００２、１．００４及び１．００５は９０％以上本試験において有効である。

【０２４５】

実施例Ｂ５：ジアブロチカ・バルテアタ(Diabrotica balteata)に対する作用

トウモロコシの苗を、１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る水性乳剤スプレー混合物でスプレーし、スプレーコーティングが乾燥した後、トウモロコシの苗は、第二段階にある１０匹のジアブロチカ・バルテアタ(Diabrotica balteata)が住まわされ、そしてプラスチック容器内に据えられる。６日後、個体群の低下率（％活性）が、処理した植物上で死んだ毛虫の数と、未処理の植物上でのものとを比較することによって決定される。

【０２４６】

当該表の化合物は、本試験において良好な活性を示す。特に、１．００２、１．００４及び１．００５は９０％以上本試験において有効である。

【０２４７】

実施例Ｂ６：テトラニカス・ウルチカエ(Tetranychus urticae)に対する作用

若いマメ植物に、テトラニカス・ウルチカエ(Tetranychus urticae)の混合した個体群を住まわせ、そして１日後に１２．５ｐｐｍの試験化合物を含んで成る水性乳剤スプレー混合物をスプレーする。当該植物を６日間２５℃でインキュベートし、そしてその後評価する。個体群の低下率（％活性）が、処理した植物上で死んだ卵、幼虫及び成体の数と、未処理の植物上でのものとを比較することによって決定される。

【０２４８】

当該表の化合物は、本試験において良好な活性を示す。特に、１．００２、１．００４及び１．００５は９０％以上本試験において有効である。

フロントページの続き

(74)代理人 100117019
弁理士 渡辺 陽一
(74)代理人 100141977
弁理士 中島 勝
(74)代理人 100166028
弁理士 北谷 賢次
(72)発明者 トブラー，ハンス
スイス国，ツェーハー－４０５８ バーゼル，シュバルツバルトアレー ２１５，シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
(72)発明者 マーフィー ケッサビ，フィオナ
スイス国，ツェーハー－４０５８ バーゼル，シュバルツバルトアレー ２１５，シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

審査官 荒木 英則

(56)参考文献 特開平０３－１４１２９１（ＪＰ，Ａ）
特開昭６４－０４２４８３（ＪＰ，Ａ）
特開平０５－２５５３４２（ＪＰ，Ａ）
米国特許第０５３９９７１７（ＵＳ，Ａ）
特開平０２－２１２４９１（ＪＰ，Ａ）
特開昭５８－１７６５９１（ＪＰ，Ａ）
Federal Register, 65(8), pp.1796-1802 (2000)
MROZIK, H., et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 5(20), pp.2435-2440 (1995)

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
C07H 1/00-99/00
A01N 43/00-43/24
A01P 7/00- 7/04
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)