

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6826977号
(P6826977)

(45) 発行日 令和3年2月10日 (2021.2.10)

(24) 登録日 令和3年1月20日 (2021.1.20)

(51) Int.Cl.

F I

C O 7 D 401/04 (2006.01)

C O 7 D 401/04 C S P

C O 7 D 401/14 (2006.01)

C O 7 D 401/14

C O 7 D 403/04 (2006.01)

C O 7 D 403/04

A O 1 N 43/56 (2006.01)

A O 1 N 43/56 G

A O 1 N 43/84 (2006.01)

A O 1 N 43/84 I O I

請求項の数 3 (全 239 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2017-529037 (P2017-529037)
 (86) (22) 出願日 平成27年12月1日 (2015.12.1)
 (65) 公表番号 特表2017-537915 (P2017-537915A)
 (43) 公表日 平成29年12月21日 (2017.12.21)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2015/078164
 (87) 国際公開番号 W02016/087421
 (87) 国際公開日 平成28年6月9日 (2016.6.9)
 審査請求日 平成30年11月28日 (2018.11.28)
 (31) 優先権主張番号 14195937.9
 (32) 優先日 平成26年12月2日 (2014.12.2)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシャフト
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム
 ・ライン、アルフレート・ノベール・シュト
 ラーセ・50
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

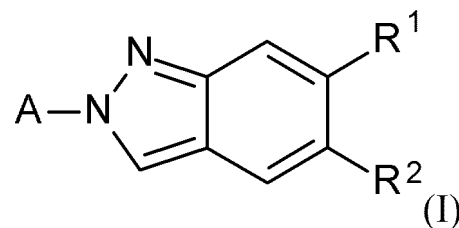
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての二環式化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

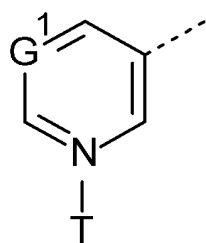
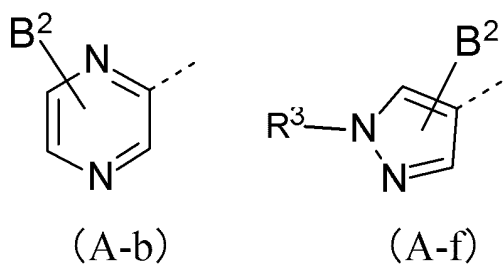
下記式 (I) の化合物：

【化 1】



[式中、
 A が、(A-b)、(A-f) および (A-a)：

【化 2】



(A-a)

からなる群からの A 基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

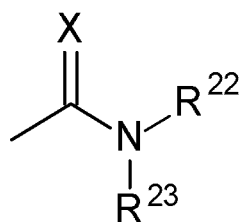
A が (A-b) または (A-f) である場合には、

B² が、水素を表し；

R¹ が、水素を表し；

R² が、c) 下記式：

【化 3】

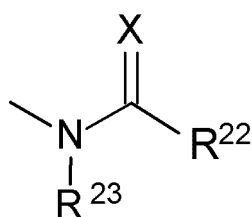


の基を表し；

または

R² が、d) 下記式：

【化 4】



の基を表し；

Xが、酸素を表し；

R^3 が、 C_1-C_4 -アルキルを表し；

R^2 が基c)を表す場合、 $R^{2,2}$ が、 C_1-C_6 -アルキル、シアノー置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、ジ- (C_1-C_4 -アルキル) アミノスルホニルからなる群からの基を表し；

R^2 が基c)を表す場合、 $R^{2,3}$ が、水素および C_1-C_6 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^2 が基d)を表す場合、 $R^{2,2}$ が、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキルならびにハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-または C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-置換されていてもよいフェニルからなる群からの基を表し；

R^2 が基d)を表す場合、 $R^{2,3}$ が、水素および C_1-C_6 -アルキルからなる群からの基を表し；

Aが(A-a)である場合には、

G^1 が、NまたはC- B^1 を表し；

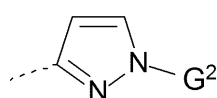
B^1 が、水素およびフッ素からなる群からの基を表し；

Tが、電子対を表し；

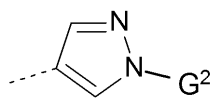
R^1 が、水素を表し；

R^2 が、a a)

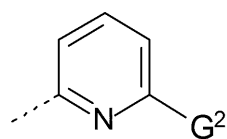
【化5】



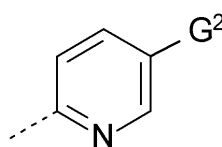
(B-3)



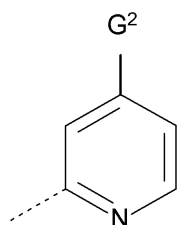
(B-4)



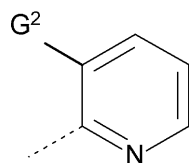
(B-21)



(B-22)



(B-35)



(B-36)

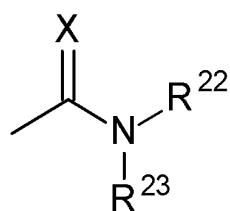
からなる群からの基を表し；

G^2 が、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、

C₁ - C₄ - アルキルスルホニル - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；また

R² が、c) 下記式：

【化 6】



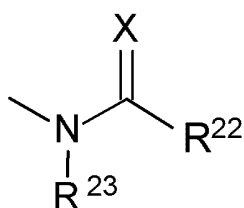
10

の基を表し；

または

R² が、d) 下記式：

【化 7】



20

の基を表し；

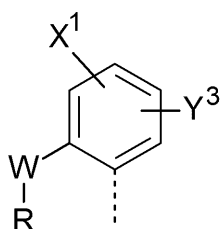
または

R² が、f) ハロアルキルを表し；

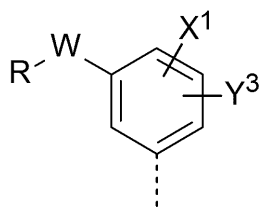
X が、酸素を表し；

R^{2 2} が、(D-1) から (D-3)：

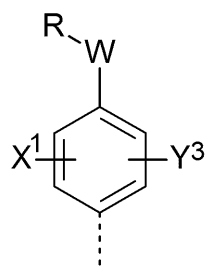
【化 8】



(D-1)



(D-2)



(D-3)

40

からなる群からの基を表し、

破線が、基 c) における窒素原子または基 d) における炭素原子への結合を表し；

R が、各場合でフッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよい C₁ - C₄ - アルキルを表し；

X¹ が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチルおよびエチルからなる群からの基を表し；

W が、S、SO および SO₂ からなる群からの基を表し；

50

Y^3 が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチルおよびエチルからなる群からの基を表し；
 $R^{2,3}$ が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルキルチオアルキル、アルケニルチオアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキルからなる群からの基を表す式（I）の化合物。

【請求項 2】

少なくとも一つの請求項 1 に記載の式（I）の化合物および一般的な増量剤および／または界面活性剤を含む組成物。

【請求項 3】

有害生物を防除するための、請求項 1 に記載の式（I）の化合物または請求項 2 に記載の組成物の使用であって、但し、人体における使用を除く前記使用。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、新規二環式化合物、それら化合物を含んでいる組成物、害虫（animal pest）を防除するためのそれらの使用、並びに、それらを調製するための方法および中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

最近、殺虫特性を有する二環式化合物が開示された（WO 2015/038503 A1）。

20

【0003】

WO 2003/090751 A1 には、特に 4-[[2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾリル-5-イル]オキシ]断片を含む MMP-13 選択的メタロプロテイナーゼ阻害剤の製造および医薬的使用が記載されている。

【0004】

現代の作物保護組成物は、例えば、作用の程度、作用の持続性および作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性の問題、および、別の活性化化合物または製剤助剤との組合せ可能性についての問題は、活性化化合物を合成するのに必要とされる費用の問題と同様に、ある種の役割を果たす。さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由により、新規作物保護組成物の探求は、完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して少なくとも個々の性質に関して改善されている特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

【特許文献 1】WO 2015/038503 A1

【特許文献 2】WO 2003/090751 A1

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

40

【0006】

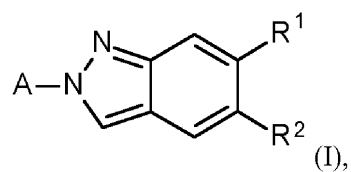
本発明の目的は、さまざまな局面下において有害生物防除剤（pesticide）のスペクトルを拡大させる化合物を提供することであった。

【課題を解決するための手段】

【0007】

この目的、および、明示的には示されていないが本明細書中で論じられている文脈から認識または誘導され得るさらなる目的は、下記式（I）の化合物：

【化 1】



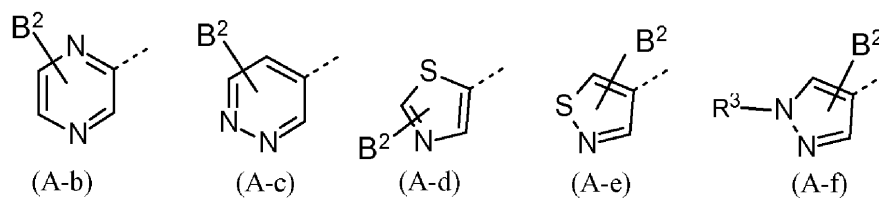
【0008】

〔式中、

A は、(A-b) から (A-f) :

【化 2】

10



【0009】

からなる群から選択される基を表し

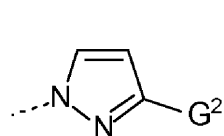
破線は、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し、

B² は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ならびに、各場合で置換されていてもよいシクロアルキルおよびシクロアルケニルからなる群からの基を表し；

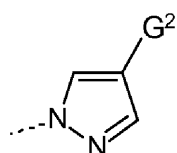
20

R¹ は、水素、アルキル、アルコキシおよびシアノからなる群からの基を表し、R² は、a) 下記のものからなる群からの B 基

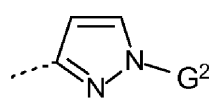
【化 3】



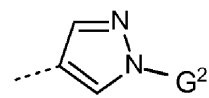
(B-1)



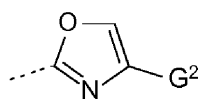
(B-2)



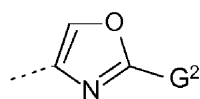
(B-3)



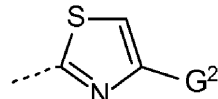
(B-4)



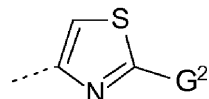
(B-5)



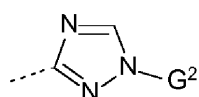
(B-6)



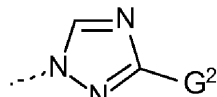
(B-7)



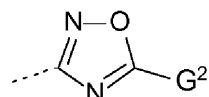
(B-8)



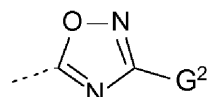
(B-9)



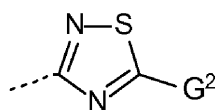
(B-10)



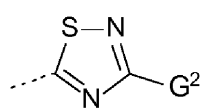
(B-11)



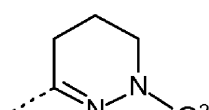
(B-12)



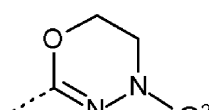
(B-13)



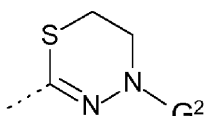
(B-14)



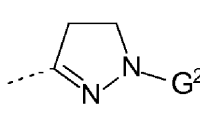
(B-15)



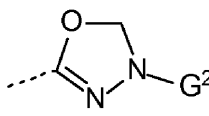
(B-16)



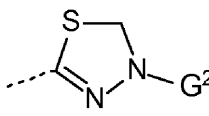
(B-17)



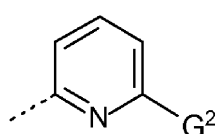
(B-18)



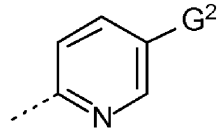
(B-19)



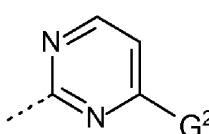
(B-20)



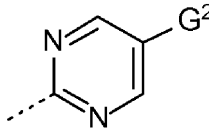
(B-21)



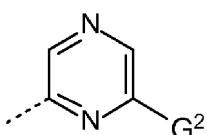
(B-22)



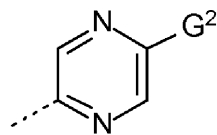
(B-23)



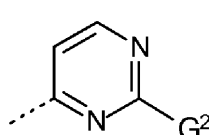
(B-24)



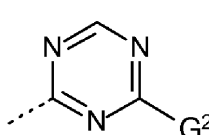
(B-25)



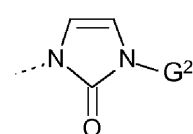
(B-26)



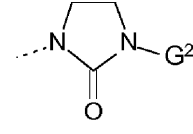
(B-27)



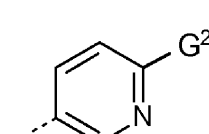
(B-28)



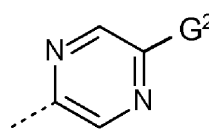
(B-29)



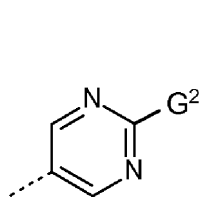
(B-30)



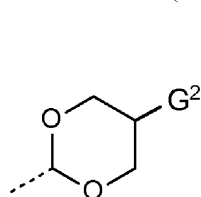
(B-31)



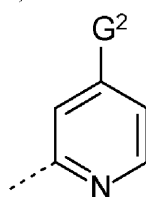
(B-32)



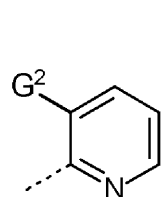
(B-33)



(B-34)



(B-35)



(B-36)

【 0 0 1 0 】

を表し、

10

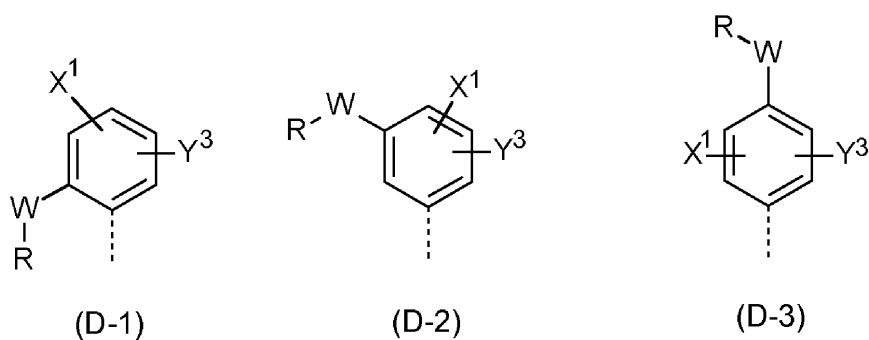
20

30

40

50

破線は、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、
 R^2 は、(b) (D-1) から (D-3) からなる群からの D 基
 【化 4】



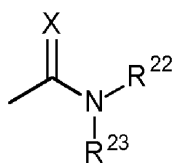
10

【0011】

を表し、

破線は、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、
 R^2 は、c) 下記式の基

【化 5】



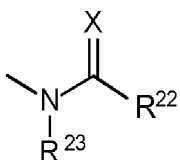
20

【0012】

を表し；または、

R^2 は、d) 下記式の基

【化 6】



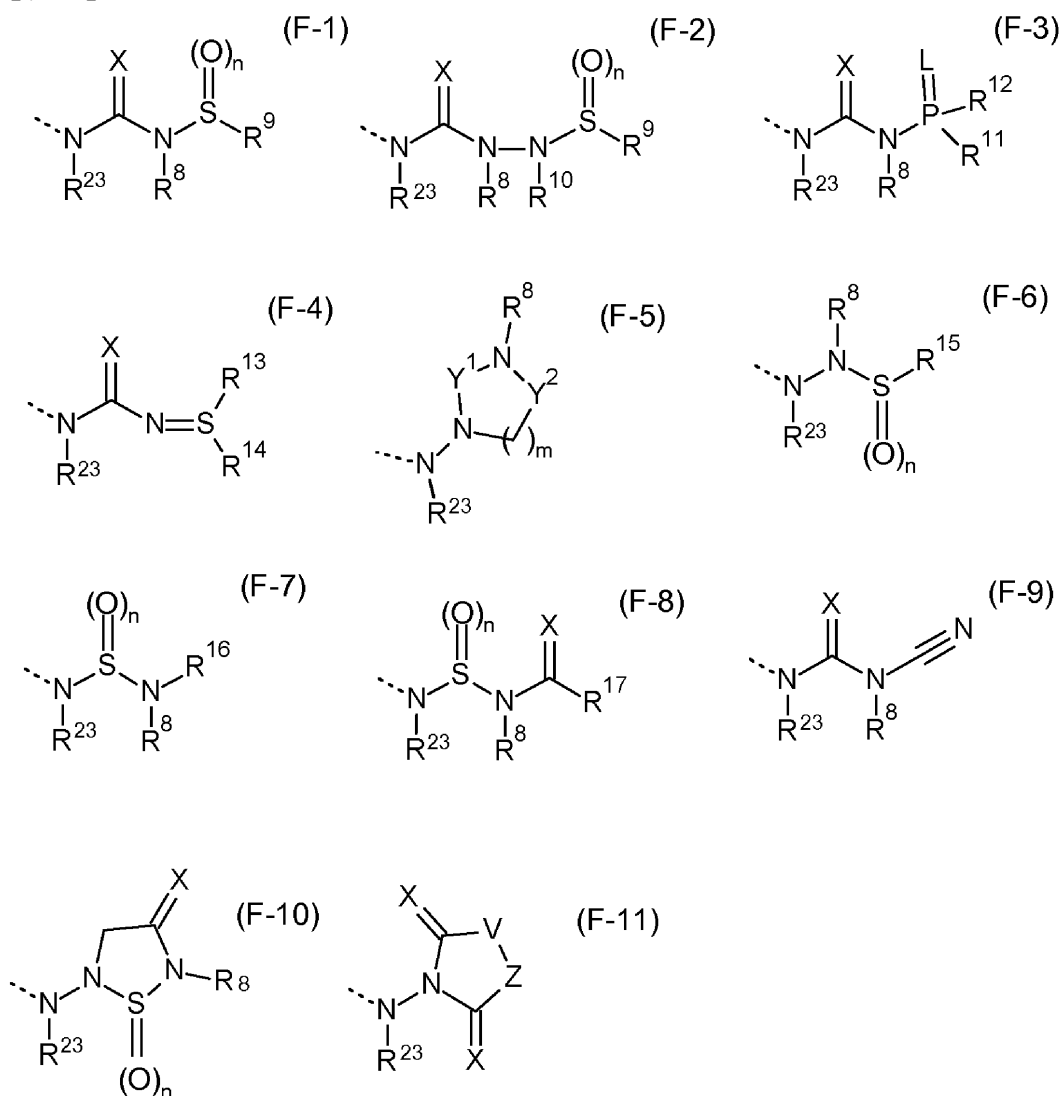
30

【0013】

基を表し；または、

R^2 は、e) (F-1) から (F-11) からなる群からの基

【化 7】



【 0 0 1 4 】

を表し、

破線は、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、

R² は、f) ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

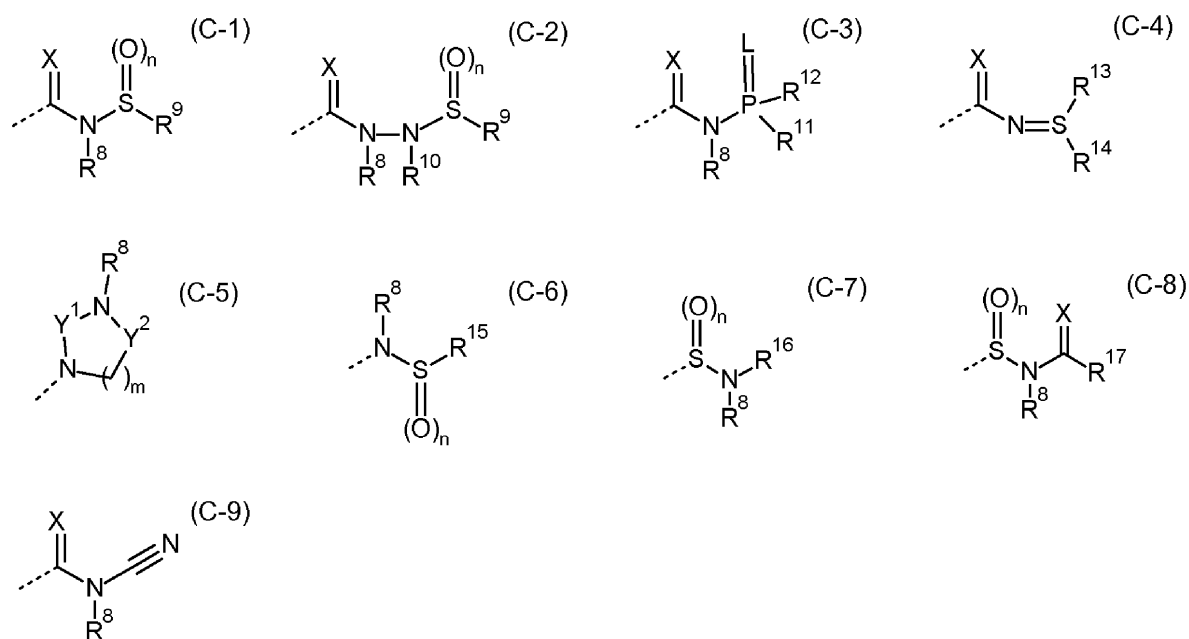
G² は、水素を表すか、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、アルキルアミノ、ハロアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキル、ハロアルキル、飽和もしくは不飽和のシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、置換されていてもよく、および、1 個以上のヘテロ原子で中断されていてもよい）、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン化アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、ビス（アルコキシ）アルキル、ビス（ハロアルコキシ）アルキル、アルコキシ（アルキルスルファニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルフィニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルホニル）アルキル、ビス（アルキルスルファニル）アルキル、ビス（ハロアルキルスルファニル）アルキル、ビス（ヒドロキシアルキルスルファニル）アルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、α-ヒドロキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、α-アルコキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、C(X²)NR³R⁴、NR⁶R⁷、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサラニル、ジオキセパニル、ジオキソカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル

、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリノニル（これらに関しては、アルキル、ハロアルキル、アルコキシおよびアルコシアルキルで置換されていてもよい）、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキルおよびハロアルキルで置換されていてもよい）、ヘテロアリール基〔ピリジル、ピリジルN-オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコシアルキル、アルキルチオ、アルキルチオアルキルおよびシクロアルキルで置換されていてもよい）〕、および、ヘテロアリールアルキル基〔トリアゾリルアルキル、ピリジルアルキル、ピリミジルアルキルおよびオキサジアゾリルアルキル（これらに関しては、ハロゲンおよびアルキルで置換されていてもよい）〕からなる群からの基を表し；

または、

G²は、(C-1)から(C-9)からなる群からのC基

【化8】



【0015】

を表し；

破線は、B基への結合を表し、

Xは、酸素または硫黄を表し；

X¹は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシおよびハロアルコキシからなる群からの基を表し；

X²は、酸素、硫黄、NR⁵またはNOHを表し；

Lは、酸素または硫黄を表し；

V-Zは、R^{2 4}CH-CHR^{2 5}またはR^{2 4}C=CR^{2 5}を表し；

nは、1または2を表し；

mは、1、2、3または4を表し；

Rは、NR^{1 8}R^{1 9}を表すか、または、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコシアルキル、アルキル-S-アルキル、アルキル-S(O)-アルキル、アルキル-S(O)₂-アルキル、R^{1 8}-CO-アルキル、NR^{1 8}R^{1 9}-CO-アルキル、シク

10

20

30

40

50

ロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルアルキル、複素環、複素環アルキル、フェニル、フェニルアルキル、ヘタリールおよびヘタリールアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

R³ は、水素またはアルキルを表し；

R⁴ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；

R⁵ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；または、

R³ と R⁴ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成し；または、

R³ と R⁵ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、環を形成し；

R⁶ は、水素またはアルキルを表し；

R⁷ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；または、

R⁶ と R⁷ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成し；

R⁸ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルケニル、アルコキシアルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよいアルキルカルボニルおよびアルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよいアルコキシカルボニル、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロアルキルおよびシアノで置換されていてもよいシクロアルキルカルボニル、または、カチオン、または、アルキルもしくはアリールアルキルで置換されていてもよいアンモニウムイオンからなる群からの基を表し；

R⁹ は、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、ならびに、置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基（C-1）および基（F-1）における R⁸ と R⁹ は、それらが結合している N-S（O）_n 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 から 8 員の環（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも一つのカルボニル基を含んでいてもよい）を形成することもでき；

R¹⁰ は、水素またはアルキルを表し；

基（C-2）および基（F-2）における R⁸ と R¹⁰ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 から 8 員の環（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも一つのカル

10

20

30

40

50

ルボニル基を含んでいてもよい)を表すこともでき;

基(C-2)および基(F-2)における R^9 と R^{10} は、それらが結合しているN-S(O)_n基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの1以上のさらなるヘテロ原子ならびに/または少なくとも一つのカルボニル基を含んでいてもよい)を形成することもでき;

R^{11} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し;

10

R^{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し;

基(C-3)および基(F-3)における R^{11} と R^{12} は、それらが結合しているリン原子と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい5~7員の環(ここで、該環は、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および硫黄からなる群からの1個または2個のヘテロ原子を含んでいてもよい)を形成することもでき;

20

R^{13} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し;

R^{14} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し;

R^{15} は、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい)、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、ならびに、置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し;

30

基(C-6)および基(F-6)における R^8 と R^{15} は、それらが結合しているN-S(O)_n基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4~8員の環(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの1個以上のさらなるヘテロ原子ならびに/または少なくとも1のカルボニル基を含んでいてもよい)を形成することもでき;

R^{16} は、水素、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい)、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、ならびに、置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し;

40

基(C-7)および基(F-7)における R^8 と R^{16} は、それらが結合している窒素原子と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの1個以上のさらなるヘテロ原子ならびに/または少なくとも1のカルボニル基を含んでいてもよい)を形成することもでき;

50

R^{17} は、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、ならびに、置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基（C-8）および基（F-8）における R^8 と R^{17} は、それらが結合している N-C（X）基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4～8 員の環（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも 1 のカルボニル基を含んでいてもよい）を形成することもでき；

R^{18} は、水素、ヒドロキシ、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルおよびシクロアルケニルアルキル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキル、ならびに、置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

R^{19} は、水素からなる群からの基を表すか、または、アルカリ金属イオンもしくはアルカリ土類金属イオンを表すか、または、 C_1-C_4 -アルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表すか、または、各場合でハロゲン-もしくはシアノ-で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル基を表し；

Y^1 および Y^2 は、互いに独立に、 $C=O$ または $S(O)_2$ を表し；

Y^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシおよび $NR^{20}R^{21}$ からなる群からの基を表し；

W は、O、S、SO および SO_2 からなる群からの基を表し；

R^{22} は、アルキル、ハロゲン-、カルバモイル-、チオカルバモイル-もしくはシアノ-で置換されていてもよいシクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキルオキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルチオアルキルオキシ、アルキルスルフィニルアルキルオキシ、アルキルスルホニルアルキルオキシ、ハロアルキルチオアルキル、ハロゲンアルキルスルフィニルアルキル、ハロアルキルスルホニルアルキル、アルキルチオアルケニル、アルキルスルフィニルアルケニル、アルキルスルホニルアルケニル、アルケニルチオアルキル、アルケニルスルフィニルアルキル、アルケニルスルホニルアルキル、アルキルカルボニルアルキル、ハロアルキルカルボニルアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、ハロアルコキシカルボニルアルキル、アルキルアミノスルホニル、ジ（アルキルアミノ）スルホニルからなる群からの基を表し；または、

$R^{22} = d$ ）である場合は、

R^{22} はさらに、置換されていてもよいアリールを表すか、（E-1）から（E-51）

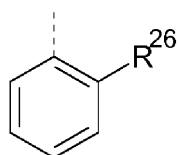
10

20

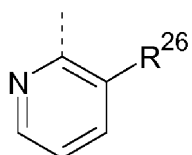
30

40

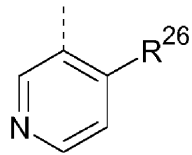
【化 9】



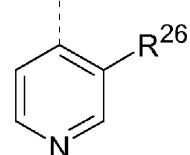
E-1



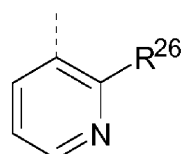
E-2



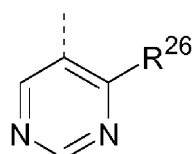
E-3



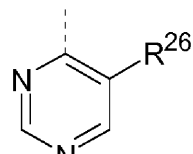
E-4



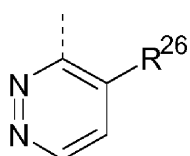
E-5



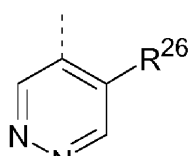
E-6



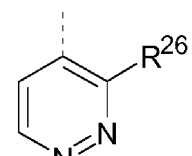
E-7



E-8



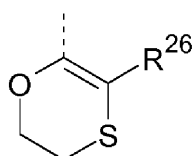
E-9



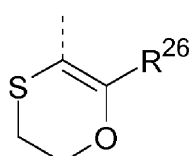
E-10



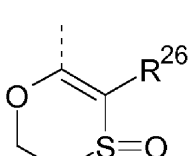
E-11



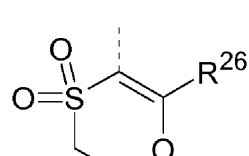
E-12



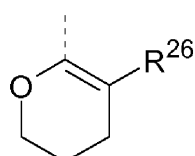
E-13



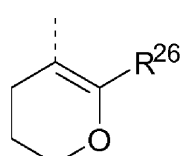
E-14



E-15



E-16

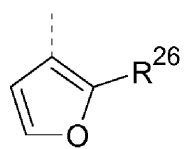


E-17

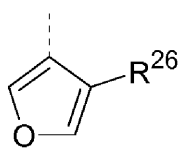
10

20

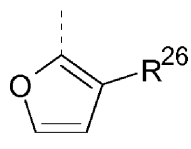
30



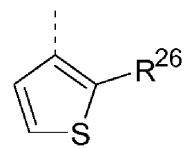
E-18



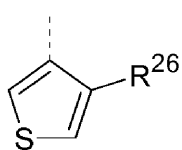
E-19



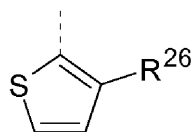
E-20



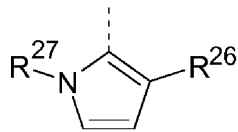
E-21



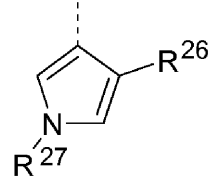
E-22



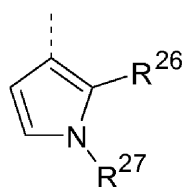
E-23



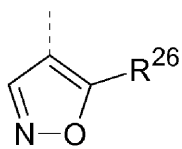
E-24



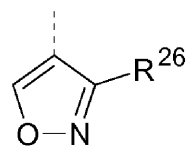
E-25



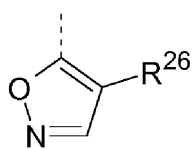
E-26



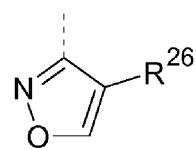
E-27



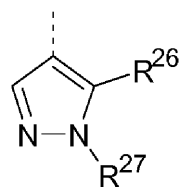
E-28



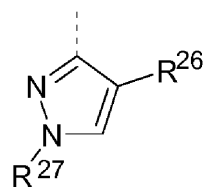
E-29



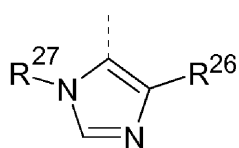
E-30



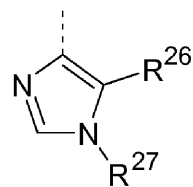
E-31



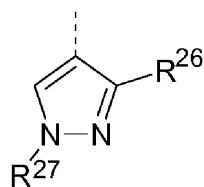
E-32



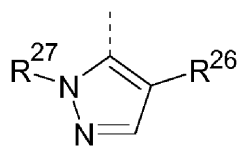
E-33



E-34



E-35



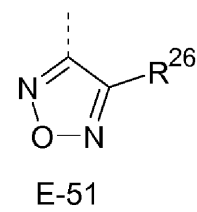
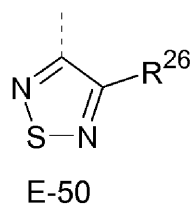
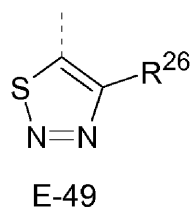
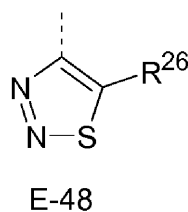
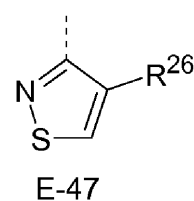
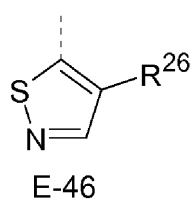
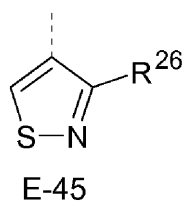
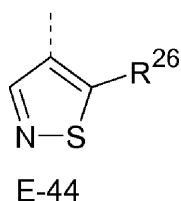
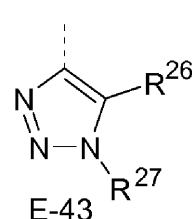
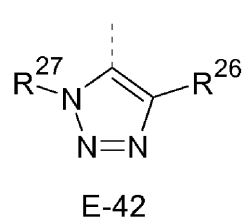
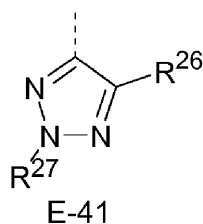
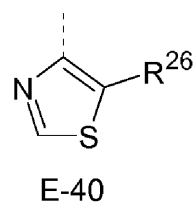
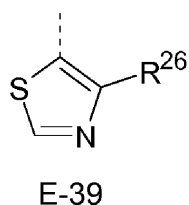
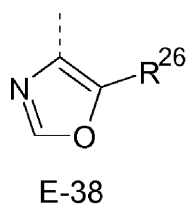
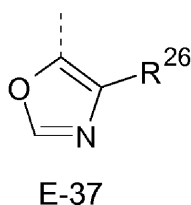
E-36

10

20

30

40



【0016】

からなる群からの基を表し；

R²⁰は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、ならびに、各場合
で置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアル
キルアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオ
キシ、アルキルカルボニルオキシ、アルケニルカルボニルオキシ、アルキニルカルボニ
ルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルスル
ホニルオキシ、アルキルアミノ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、シクロアルキル
アミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、シクロアル
キルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルカルボニル、アルコ
キシイミノアルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボ
ニル、ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、アルキルアミノスルホニル
、アルキルスルホニルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、アルケニルカルボニルアミノ
、アルキニルカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルコキシカルボニ
ルアミノ、アルキルチオカルボニルアミノ、ビスシクロアルキル、アリール、アリールオキ
シ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシ（ここで、該置換基は、互いに独立に、
ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、アルキルおよびハロアルキルからなる
群から選択される。）からなる群からの基を表し；

R²¹は、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル
、シクロアルキルアルキル、シアノアルキル、アルキルカルボニル、アルケニルカルボニ
ル、ハロアルキルカルボニル、ハロアルケニルカルボニル、アルコキシアルキル、アルコ
キシカルボニル、アルキルスルホニルおよびハロアルキルスルホニルからなる群からの基
を表し；

R²³は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケ
ニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、アル

10

20

30

40

50

キルチオアルキル、アルケニルチオアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキルからなる群からの基を表し；および、

R^{24} は、水素を表すか、または、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；および、

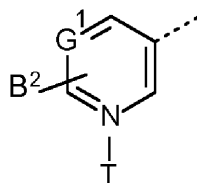
R^{25} は、水素を表すか、または、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

R^{27} は、水素またはアルキルを表し；および、

R^{26} は、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキルまたはシアノアルキルを表す。]；ならびに

A が、A 基 (A-a)：

【化 10】



(A-a)

【0017】

を表し；

破線が式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

G^1 が、N または C-B¹ を表し；

B¹ が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシおよび各場合で置換されていてもよいシクロアルキルおよびシクロアルケニルからなる群からの基を表し；

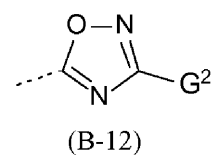
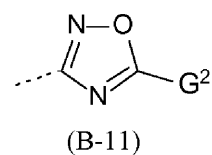
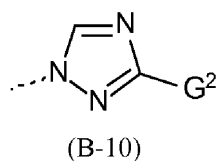
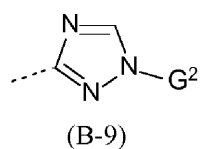
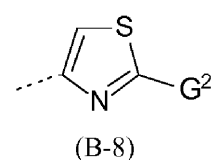
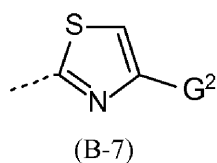
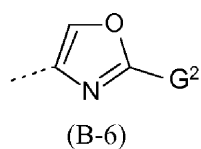
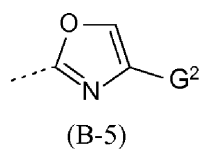
B² が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシおよび各場合で置換されていてもよいシクロアルキルおよびシクロアルケニルからなる群からの基を表し；

T が、酸素または電子対を表し；

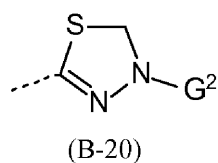
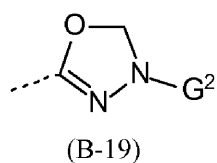
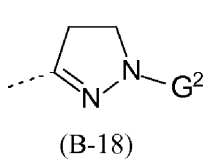
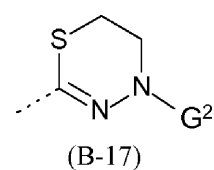
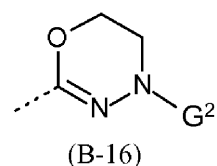
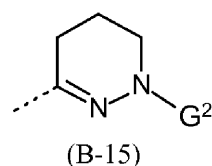
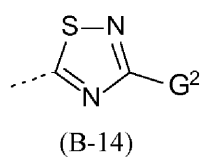
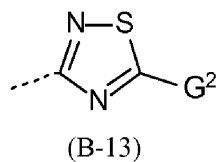
R¹ が、水素、アルキル、アルコキシおよびシアノからなる群からの基を表し；

R² が a)

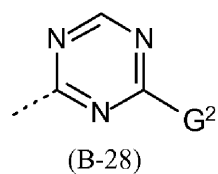
【化 1 1】



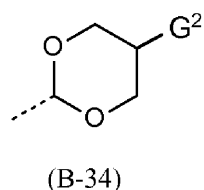
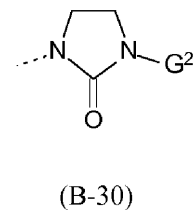
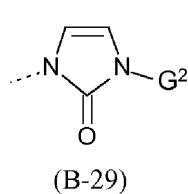
10



20



30



40

【0 0 1 8】

からなる群からの B 基を表し；

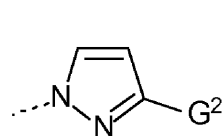
破線が式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；

G² が、水素またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、アルキルアミノ、ハロアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、飽和もしくは不飽和のシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、置換されていてもよく、および、1 以上のヘテロ原子で中断されていてもよい）、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン化アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル

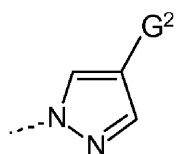
50

、ビス（アルコキシ）アルキル、ビス（ハロアルコキシ）アルキル、アルコキシ（アルキルスルファニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルフィニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルホニル）アルキル、ビス（アルキルスルファニル）アルキル、ビス（ハロアルキルスルファニル）アルキル、ビス（ヒドロキシアルキルスルファニル）アルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 α -ヒドロキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、 α -アルコキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキソラニル、ジオキセパニル、ジオキソカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル（これらに関しては、アルキル、ハロアルキル、アルコキシおよびアルコキシアルキルで置換されていてもよい。）〕、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキルおよびハロアルキルで置換されていてもよい。））、ヘテロアリール基〔ピリジル、ピリジルN-オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオ、アルキルチオアルキルおよびシクロアルキルで置換されていてもよい。）〕およびヘテロアリールアルキル基〔トリアゾリルアルキル、ピリジルアルキル、ピリミジルアルキルおよびオキサジアゾリルアルキル（これらに関しては、ハロゲンおよびアルキルで置換されていてもよい。）〕からなる群からの基を表し；または

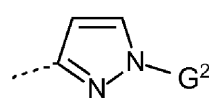
R^2 が、a a) 下記のB基のうちの一つ：



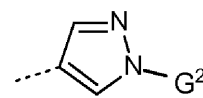
(B-1)



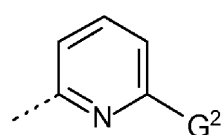
(B-2)



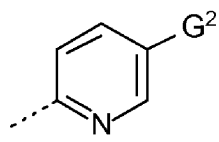
(B-3)



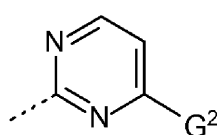
(B-4)



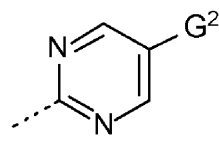
(B-21)



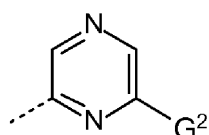
(B-22)



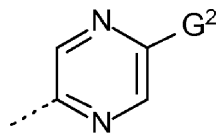
(B-23)



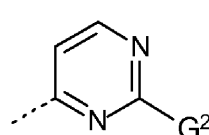
(B-24)



(B-25)



(B-26)



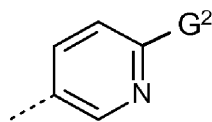
(B-27)

10

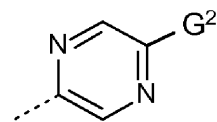
20

30

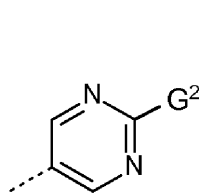
40



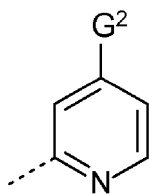
(B-31)



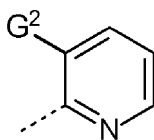
(B-32)



(B-33)



(B-35)



(B-36)

【0019】

を表し、

破線が式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；

G^2 が、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、アルキルアミノ、ハロアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、飽和もしくは不飽和のシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、置換されていてもよく、および、1 個以上のヘテロ原子で中断されていてもよい）、シクロアルキルアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、ハロゲン化アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、ハロアルキルチオアルキル、ハロアルキルスルフィニルアルキル、ハロアルキルスルホニルアルキル、ビス（アルコキシ）アルキル、ビス（ハロアルコキシ）アルキル、アルコキシ（アルキルスルファニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルフィニル）アルキル、アルコキシ（アルキルスルホニル）アルキル、ビス（アルキルスルファニル）アルキル、ビス（ハロアルキルスルファニル）アルキル、ビス（ヒドロキシアルキルスルファニル）アルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 α -ヒドロキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、 α -アルコキシイミノアルコキシカルボニルアルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキソカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル（これらに関しては、アルキル、ハロアルキル、アルコキシおよびアルコキシアルキルで置換されていてもよい。）〕、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキルおよびハロアルキルで置換されていてもよい。）、ヘテロアリール基〔イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオ、アルキルチオアルキルおよびシクロアルキルで置換されていてもよい。）〕およびヘテロアリールアルキル基〔トリアゾリルアルキル、ピリジルアルキル、ピリミジルアルキルおよびオキサジアゾリルアルキル（これらに関しては、ハロゲンおよびアルキルで置換されていてもよい。）〕からなる群からの基を表し；、または

R^2 が a) もしくは a a) 下に列記された基のうちの一つを表す場合、 G^2 が、

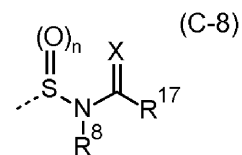
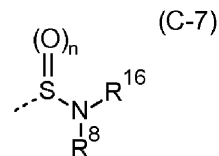
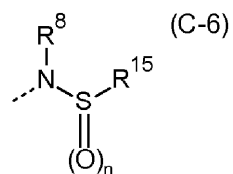
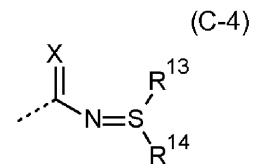
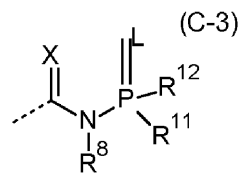
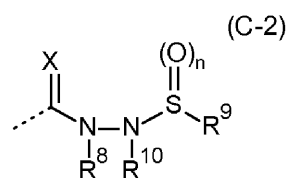
10

20

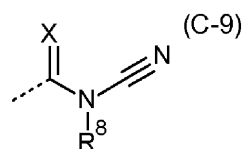
30

40

【化 1 3】



10

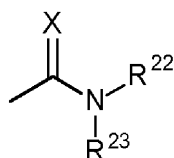


【 0 0 2 0 】

からなる群から選択される C 基も表し、
破線が、B 基への結合を表し、または
R² が c) 下記式：

20

【化 1 4】

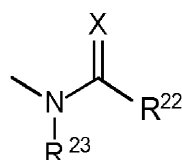


【 0 0 2 1 】

の基を表し；または
R² が、d) 下記式：

30

【化 1 5】



【 0 0 2 2 】

の基を表し；
または
R² が、e)

40

からなる群からの F 基を表し；

R² が、 f) ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

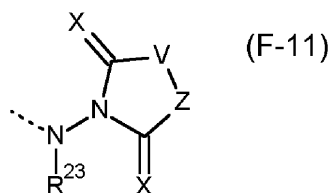
X^2 が、酸素、硫黄、 NR^5 または NOH を表し；

V-Zが、 $R^{2-4}CH-CHR^{2-5}$ または $R^{2-4}C=CR^{2-5}$ を表し；

mが、1、2、3または4を表し；

R⁴ が、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルルホニルアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群らの基を表し；

10



30

からなる群からの F 基を表し；

破線が、式（I）における炭素原子への結合を表し、または

R² が、 f) ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

Xが、酸素または硫黄を表し；

X^2 が、酸素、硫黄、 NR^5 または NOH を表し；

Lが、酸素または硫黄を表し；

V-Zが、 $R^{2,4}CH-CHR^{2,5}$ または $R^{2,4}C=CR^{2,5}$ を表し；

n が、1 または 2 を表し；

mが、1、2、3または4を表し；

R³ が、水素またはアルキルを表し；

R⁴ が、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；

R⁵ が、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；または

R^3 および R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒に、環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい。）を形成しており；または

R^3 および R^5 が、それらが結合している窒素原子と一緒に環を形成しており；

R^6 が、水素またはアルキルを表し；

R^7 が、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルチオアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘタリールアルキルからなる群からの基を表し；または

R^6 および R^7 が、それらが結合している窒素原子と一緒に、環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい。）を形成しており；、

R^8 が、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルケニル、アルコキシアルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよいアルキルカルボニルおよびアルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよいアルコキシカルボニル、ハロゲン-、アルキル-、アルコキシ-、ハロアルキル-およびシアノ-で置換されていてもよいシクロアルキルカルボニル、または、カチオン、または、アルキル-もしくはアリールアルキル-で置換されていてもよいアンモニウムイオンからなる群からの基を表し；

R^9 が、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

R^{10} が、水素またはアルキルを表し；

基（C-2）および（F-2）における R^8 および R^{10} が、それらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 から 8 員環（ここで、該環は、硫黄、酸素（酸素原子は、互いに直接隣接してはならない。）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいてもよい）を表してもよく、

基（C-2）および（F-2）における R^9 および R^{10} が、それらが結合している N-S(O)_n 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 から 8 員の環（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの 1 個以上のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいてもよい）を形成することもでき；

R^{11} が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

R^{12} が、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

基（C-3）および（F-3）における R^{11} および R^{12} が、それらが結合している

リン原子とともに、飽和または不飽和の置換されていてもよい5から7員の環（ここで、該環は、酸素（酸素原子は互いに直接隣接してはならない。）および硫黄からなる群からの1個もしくは2個のヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成していてもよく、

$R^{1\ 3}$ が、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

$R^{1\ 4}$ が、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

$R^{1\ 5}$ が、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基（C-6）および（F-6）における R^8 および $R^{1\ 5}$ が、それらが結合しているN-S（O）_n 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの1個以上のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいてもよい。）を形成することもでき；

$R^{1\ 6}$ が、水素、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基（C-7）および（F-7）における R^8 および $R^{1\ 6}$ が、それらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員環（ここで、該環は、硫黄、酸素（酸素原子は互いに直接隣接してはならない。）および窒素からなる群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいてもよい）を形成していてもよく、

$R^{1\ 7}$ が、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基（C-8）および（F-8）における R^8 および $R^{1\ 7}$ が、それらが結合しているN-C（X）基とともに、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員環（ここで、該環は、硫黄、酸素（酸素原子は互いに直接隣接してはならない。）および窒素からなる群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいてもよい）を形成していてもよく；

Y^1 および Y^2 が、互いに独立に、C=OまたはS（O）₂を表し、

$R^{2\ 2}$ が、（D-1）から（D-3）：

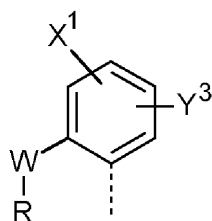
10

20

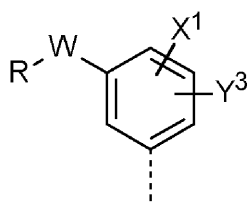
30

40

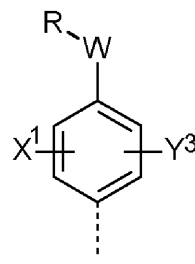
【化 17】



(D-1)



(D-2)



(D-3)

10

【0024】

からなる群からの基を表し、

破線が、基 c) における窒素原子への結合、または基 d) における炭素原子への結合を表し、

X^1 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシおよびハロアルコキシからなる群からの基を表し；

Y^3 が、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシおよび $NR^{20}R^{21}$ からなる群からの基を表し；

W が、S、SO および SO_2 からなる群からの基を表し；

R が、 $NR^{18}R^{19}$ を表し、またはアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、アルキル-S-アルキル、アルキル-S(O)-アルキル、アルキル-S(O)₂-アルキル、 $R^{18}-CO-$ アルキル、 $NR^{18}R^{19}-CO-$ アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルアルキル、複素環、複素環アルキル、フェニル、フェニルアルキル、ヘタリールおよびヘタリールアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

20

R^{18} が、水素、ヒドロキシ、各場合で置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルおよびアルキニル、各場合で置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルおよびシクロアルケニルアルキル（ここで、該環は、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい）、各場合で置換されていてもよいアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

30

R^{19} が、水素からなる群からの基を表し、アルカリ金属イオンもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、または C_1-C_4 -アルキルで 1 から 4 置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または各場合でハロゲン置換もしくはシアノ置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル基を表し、

R^{20} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシおよび各場合で置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルケニルカルボニルオキシ、アルキニルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アルキルアミノ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、シクロアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルカルボニル、アルコキシイミノアルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、アルキルアミノスルホニル、アルキルスルホニルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、アルケニルカルボニルアミノ、アル

40

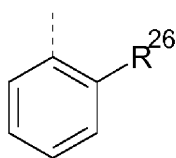
50

キニルカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルチオカルボニルアミノ、ビスシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシからなる群からの基を表し、前記置換基が互いに独立に、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、アルキルおよびハロアルキルからなる群から選択され、

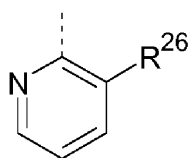
R^{21} が、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルアルキル、シアノアルキル、アルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、ハロアルケニルカルボニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルおよびハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；または

R^{22} が、E-1 から E-51：

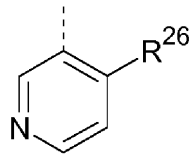
【化18】



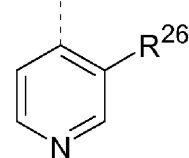
E-1



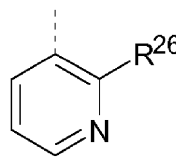
E-2



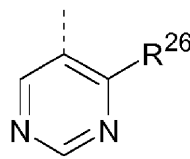
E-3



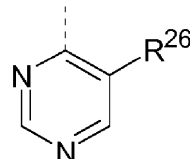
E-4



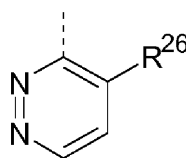
E-5



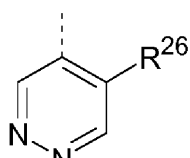
E-6



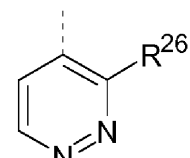
E-7



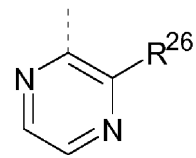
E-8



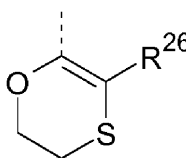
E-9



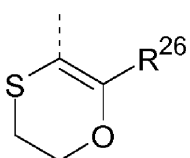
E-10



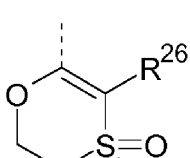
E-11



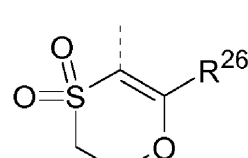
E-12



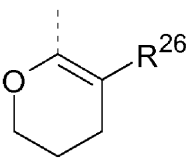
E-13



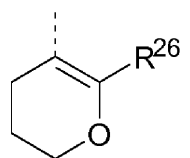
E-14



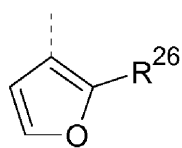
E-15



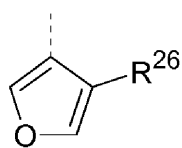
E-16



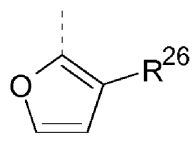
E-17



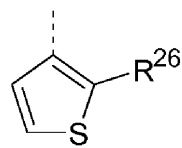
E-18



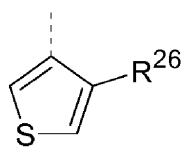
E-19



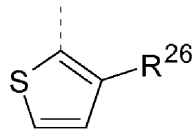
E-20



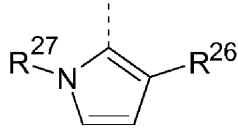
E-21



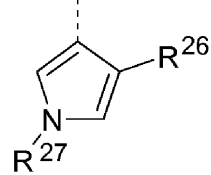
E-22



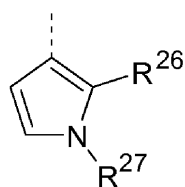
E-23



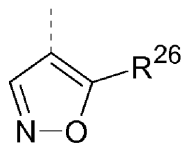
E-24



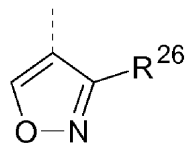
E-25



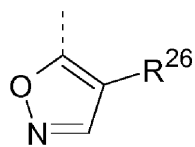
E-26



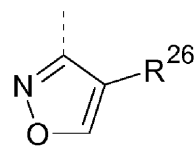
E-27



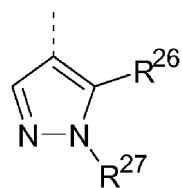
E-28



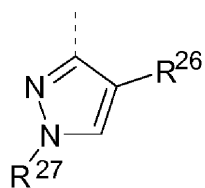
E-29



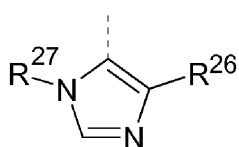
E-30



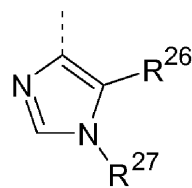
E-31



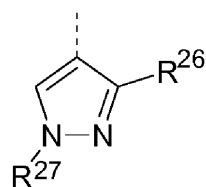
E-32



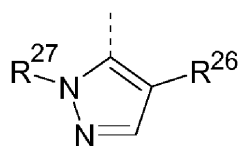
E-33



E-34



E-35



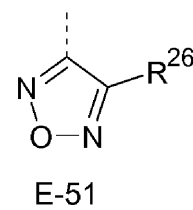
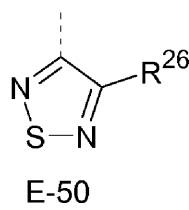
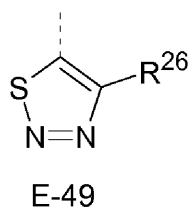
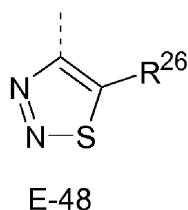
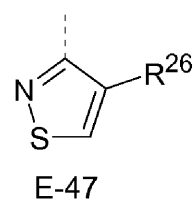
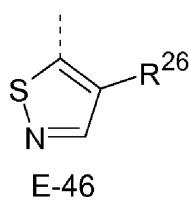
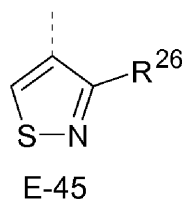
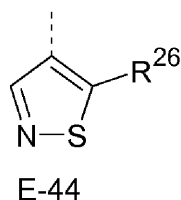
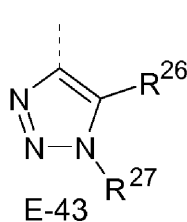
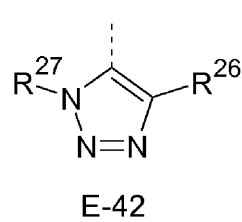
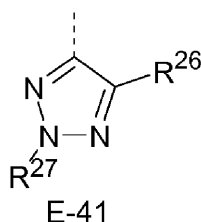
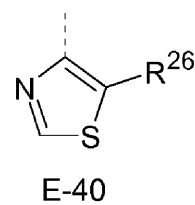
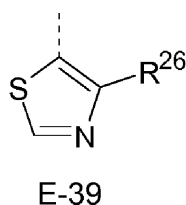
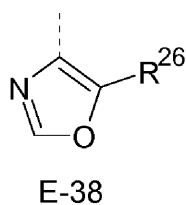
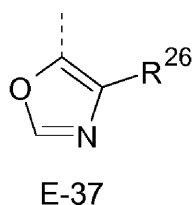
E-36

10

20

30

40



【0025】

からなる群からの基を表し；

R²³が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルキルチオアルキル、アルケニルチオアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキルからなる群からの基を表し；

R²⁴が、水素またはアルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

R²⁵が、水素またはアルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルからなる群からの各場合で置換されていてもよい基を表し；

R²⁷が、水素またはアルキルを表し；

R²⁶が、水素、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキルまたはシアノアルキルを表す式（I）の化合物によって達成される。

【0026】

さらに、式（I）の化合物、さらには式（I）によって包含されない表1で列記された化合物が、有害生物防除剤として、例えば、節足動物に対して、特に、昆虫類に対して、優れた効力を有しており、ならびに、さらに、植物と、特に、作物植物と、極めて良好な適合性を概して有しており、ならびに／または、望ましい毒性学的特性および／もしくは望ましい環境的に関連した特性を有しているということも分かった。

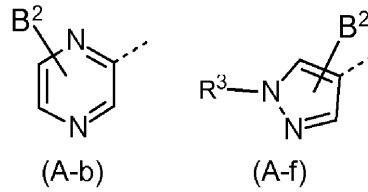
【発明を実施するための形態】

【0027】

好ましい範囲（1）：好ましいものは、

Aが、（A-b）および（A-f）

【化 1 9】



【 0 0 2 8 】

からなる群からの A 基を表し、

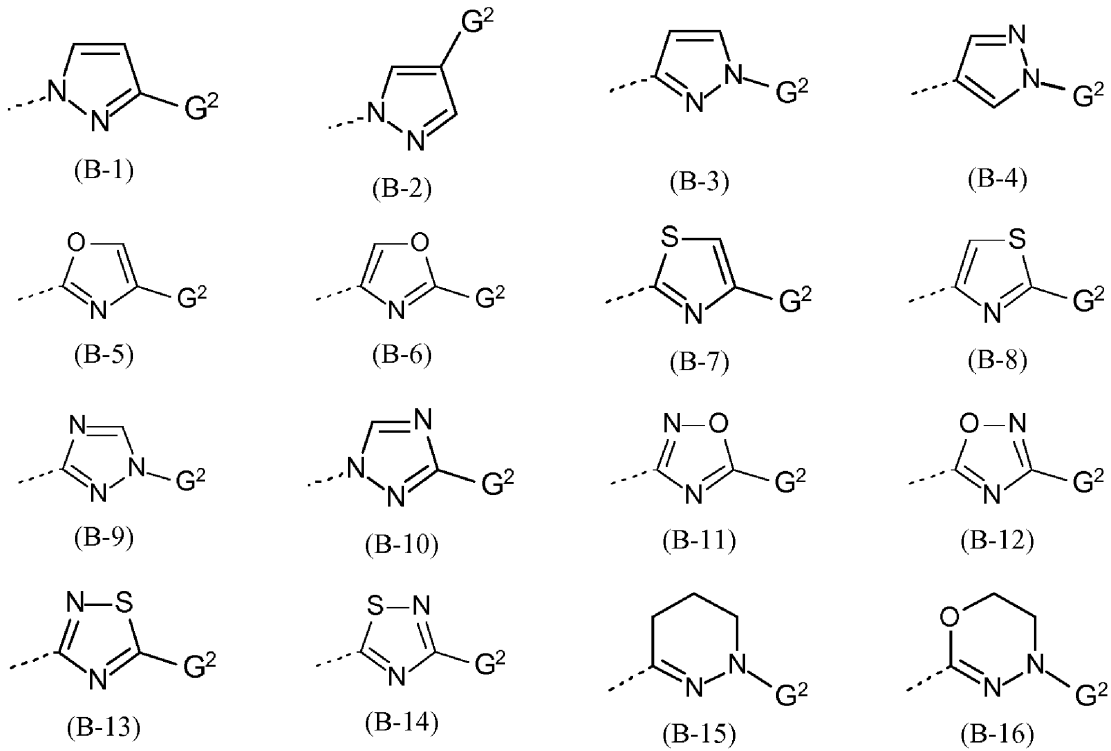
破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

B² が、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキルおよび C₁ - C₄ - ハロアルキルからなる群からの基を表し；

R¹ が、水素、C₁ - C₆ - アルキルおよび C₁ - C₆ - アルコキシからなる群からの基を表し；

R² が、a)

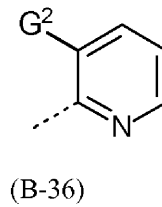
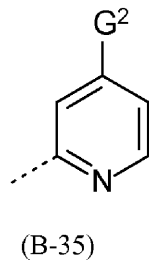
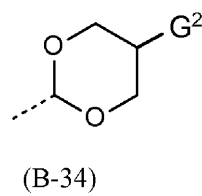
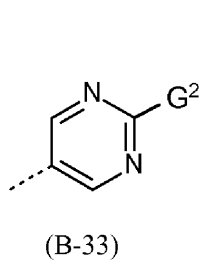
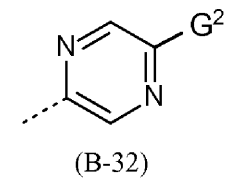
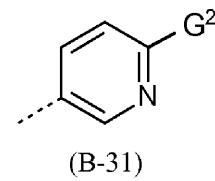
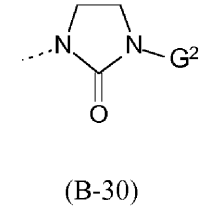
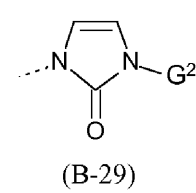
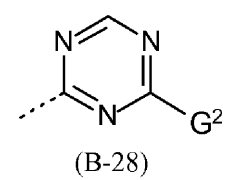
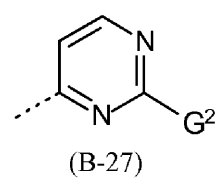
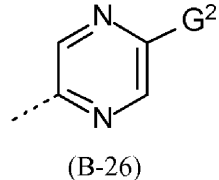
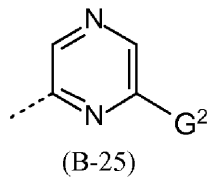
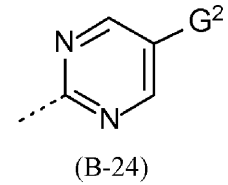
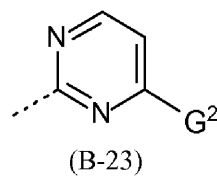
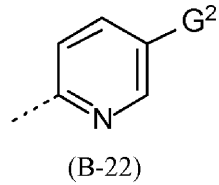
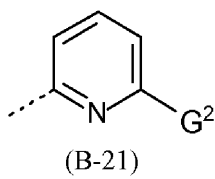
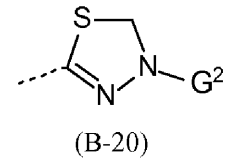
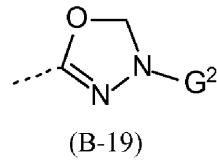
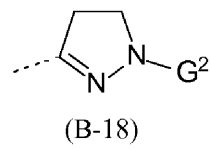
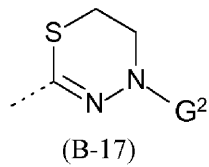
【化 2 0】



10

20

30



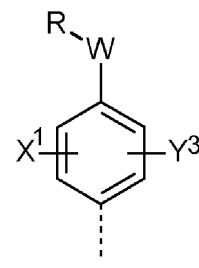
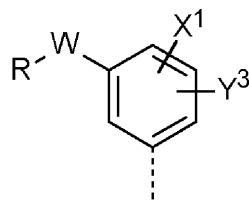
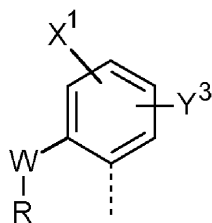
【 0 0 2 9 】

からなる群からの B 基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、

R² が、b) (D-1) から (D-3)

【化 2 1】



【 0 0 3 0 】

からなる群からの基を表し

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、

R² が、c) 下記式

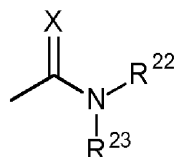
10

20

30

40

【化 2 2】

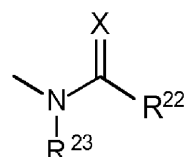


【0031】

の基を表し；または、

R² が、d) 下記式

【化 2 3】

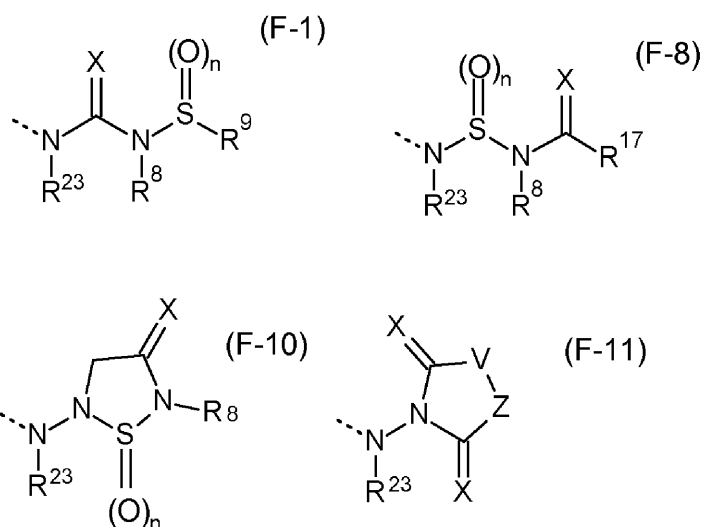


【0032】

の基を表し；または、

R² が、e) (F-1)、(F-8)、(F-10) および (F-11)

【化 2 4】



【0033】

からなる群からの基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または、

R² が、f) C₁ - C₆ - ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

G² が、水素を表すか、または、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ハロ - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄ - アルキル) - アミノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルケニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ハロゲン化 C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ビス (C₁ - C₄ - アルコキシ) - C₁ - C₄ - アルキル、ビス (ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ) - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - (C₁ - C₄ - アルキルスルファニル) - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - (C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル) - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - (C₁ - C₄ - アルキルスルホニル) - C₁ - C₄ - アルキル、ビス (C₁ - C₄ - アルキルスルファニル) - C₁ - C₄ - アルキ

10

20

30

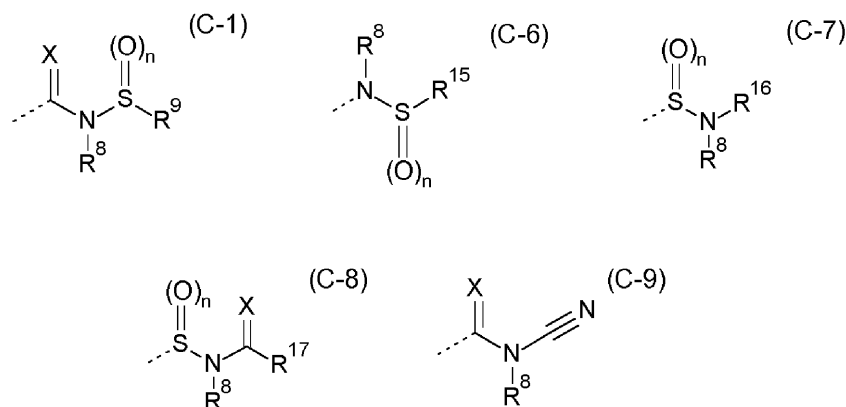
40

50

ル、ビス（ハロー-C₁-C₄-アルキルスルファニル）-C₁-C₄-アルキル、ビス（ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキルスルファニル）-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-C₁-C₄-アルキル、α-ヒドロキシイミノ-C₁-C₄-アルコキシカルボニル-C₁-C₄-アルキル、α-C₁-C₄-アルコキシイミノ-C₁-C₄-アルコキシカルボニル-C₁-C₄-アルキル、C(X²)NR³R⁴、NR⁶R⁷、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキサカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル（これらに関しては、C₁-C₄-アルキル、ハロー-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルで置換されていてもよい）〕、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキルおよびハロー-C₁-C₄-アルキルで置換されていてもよい）、ヘテロアリール基〔ピリジル、ピリジルN-オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、ハロー-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、ハロー-C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキルおよびC₃-C₆-シクロアルキルで置換されていてもよい）〕、および、ヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル基〔トリアゾリル-C₁-C₄-アルキル、ピリジル-C₁-C₄-アルキル、ピリミジル-C₁-C₄-アルキルおよびオキサジアゾリル-C₁-C₄-アルキル（これらに関しては、ハロゲンおよびC₁-C₄-アルキルで置換されていてもよい）〕からなる群からの基を表し；または、

G²が、(C-1)および(C-6)から(C-9)

【化25】



【0034】

からなる群からの基を表し、

破線が、B基への結合を表し；

Xが、酸素または硫黄を表し；

X¹が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシおよびC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群からの基を表し；

10

20

30

40

50

X^2 が、酸素、硫黄、 NR^5 または NOH を表し；

$V-Z$ が、 $R^{24}CH-CHR^{25}$ または $R^{24}C=CR^{25}$ を表し；

n が、1 または 2 を表し；

R が、 $NR^{18}R^{19}$ を表すか、または、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル- $S-C_1-C_4$ -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル- $S(O)-C_1-C_4$ -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル- $S(O)_2-C_1-C_4$ -アルキル（これらは、それぞれ、ハロゲン、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）またはシアノでモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表すか、 $R^{18}-CO-C_1-C_4$ -アルキルを表すか、または、 $NR^{18}R^{19}-CO-C_1-C_4$ -アルキルを表すか、または、 C_3-C_6 -シクロアルキル（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルで置換されていてもよい）を表すか、または、 C_3-C_8 -シクロアルケニル（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルでモノ置換またはジ置換されていてもよい）を表すか、または、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルでモノ置換またはジ置換されていてもよい）を表すか、または、 C_3-C_6 -シクロアルケニル- C_1-C_4 -アルキル（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルでモノ置換またはジ置換されていてもよい）を表すか、または、複素環（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルでモノ置換またはジ置換されていてもよい）を表すか、または、複素環- C_1-C_4 -アルキル（ここで、これは、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルでモノ置換またはジ置換されていてもよい）を表すか、または、フェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキル、ヘタリールおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキル（これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシでモノないしトリ置換されていてもよい）を表し；

R^3 が、水素または C_1-C_6 -アルキルを表し；

R^4 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^5 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；または、

R^3 と R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒に、4 から 7 員の環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの 1 個または 2 個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を

10

20

30

40

50

形成し；

R^6 が、水素または C_1-C_4 -アルキルを表し；

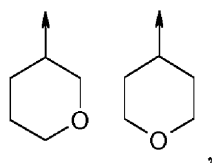
R^7 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；または、

R^6 と R^7 が、それらが結合している窒素原子と一緒に、4 から 7 員の環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの 1 個または 2 個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成し；

R^8 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-およびシアノ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表すか、または、カチオンを表すか、または、 C_1-C_6 -アルキル-もしくはアリール- C_1-C_6 -アルキル-で置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

R^9 が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-および C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-もしくは C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル（ここで、一つの環員が、硫黄、酸素（ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からのヘテロ原子で置き換えられていてもよい。）（ここでは、特に、

【化 2 6】



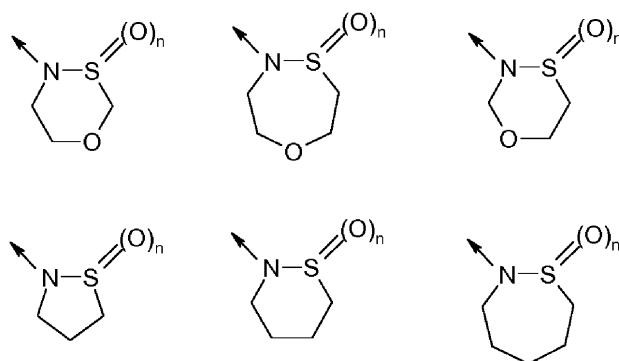
【0035】

を表し、矢印は、各場合で、基（C-1）および基（F-1）における硫黄原子への結合を示している。）、ならびに、各場合でハロゲン-、シアノ-（アルキル部分での場合も）、ニトロ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_6 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル

一、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルもしくはアミノカルボニルで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキルからなる群からの基を表すか、 $NR'R''$ [ここで、 R' および R'' は、互いに独立に、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群からの基を表す] を表し；

基 (C-1) および基 (F-1) における R^8 と R^9 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい飽和または不飽和の5から7員の環 (ここで、該環は、硫黄、酸素 (ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない) および窒素からなる群からの1個もしくは2個のヘテロ原子ならびに／または少なくとも1個の (好ましくは、1個の) カルボニル基を含んでもよい) を形成することもでき；特に、 R^8 と R^9 が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、

【化27】



【0036】

[ここで、矢印は、各場合で、C(X) 基への結合を示す。]

からなる群からの基を表すことができ；

R^{1-5} が、各場合でメチル、シアノ、カルバモイルで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でメチル、トリフルオロメチル、ハロゲン、シアノもしくはカルバモイルで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_2 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル (ここで、該環は、硫黄、酸素 (ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない) および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでもよい)、各場合で C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4 -アルキル)-アミノ、ハロゲン、ニトロもしくはシアノで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_2 -アルキル、ならびに、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルキル- C_1-C_4 -アルコキシカルボニルもしくは C_1-C_4 -アルキルスルホニルで置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

基 (C-6) における R^8 と R^{1-5} が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環 (ここで、該環は、硫黄、酸素 (ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない) および窒素からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子ならびに／または少なくとも1個の

カルボニル基を含んでいてもよい)を形成することもでき;

R¹⁶が、水素、各場合でメチル、シアノ、カルバモイルもしくはカルボキシルで置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₄-アルケニルおよびC₂-C₄-アルキニル、各場合でハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアミノ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルもしくはC₁-C₆-アルキルカルボニルで置換されていてもよいC₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキルおよびC₃-C₆-シクロアルケニル(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい)、各場合でハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアミノ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルもしくはC₁-C₆-アルキルカルボニルで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール-C₁-C₂-アルキルおよびヘテロアリール-C₁-C₂-アルキル、ならびに、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルもしくはC₁-C₆-アルキルカルボニルで置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し;

R¹⁷が、各場合でハロゲン、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルもしくはC₁-C₆-ハロアルキルスルホニルで置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルおよびC₂-C₆-アルキニル、各場合でハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシもしくはC₁-C₆-ハロアルコキシで置換されていてもよいC₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルおよびC₃-C₆-シクロアルケニル、N-ピロリジニル、N-ピペリジニル、N-モルホリニル、N-チオモルホリニル、N-チオモルホリニル1-オキシド、N-チオモルホリニル1, 1-ジオキシド、N-ピペラジニル、N-1-メチルピペラジニルもしくはN-2-オキソ-1-メチルピペラジニル、各場合でハロゲン、シアノ(アルキル部分での場合も)、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシ

10

20

30

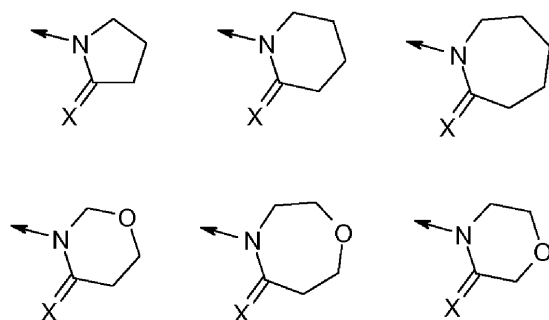
40

50

—C₁—C₆—アルキル—、C₁—C₆—ハロアルコキシ—C₁—C₆—アルキル—、C₂—C₆—アルケニル—、C₂—C₆—アルキニル—、C₃—C₆—シクロアルキル—C₁—C₆—アルキル—、C₁—C₆—アルキルカルボニル—、C₁—C₆—アルコキシカルボニル—もしくはアミノカルボニル—で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール—C₁—C₆—アルキル、ヘテロアリール—C₁—C₆—アルキルからなる群からの基を表すか、または、NR' R'' [ここで、R' および R'' は、互いに独立に、それぞれ、水素、C₁—C₆—アルキル、C₁—C₆—ハロアルキル、C₃—C₆—シクロアルキル、C₁—C₆—アルコキシ、C₁—C₆—アルキルカルボニルおよび C₁—C₆—アルコキシカルボニルからなる群からの基を表す] を表し；

基 (C-8) および基 (F-8) における R⁸ と R¹⁷ が、それらが結合している N—C (X) 基と一緒に、ハロゲン—、C₁—C₆—アルキル—、C₁—C₆—ハロアルキル—、C₁—C₆—アルコキシ—、C₁—C₆—ハロアルコキシ—で置換されていてもよい飽和または不飽和の 5 から 7 員の環 (ここで、該環は、硫黄、酸素 (ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない) および窒素からなる群からの 1 個もしくは 2 個のさらなるヘテロ原子ならびに／または 1 個のカルボニル基を含んでいてもよい) を形成することもでき；特に、R⁸ と R¹⁷ が、それらが結合している N—C (X) 基と一緒に、

【化 28】



【0037】

からなる群からの基を表すことができ、

矢印は、各場合で、基 (C-8) および基 (F-8) における硫黄原子への結合を示しており；

R¹⁸ が、水素、ヒドロキシからなる群からの基、または、C₁—C₆—アルキル、C₁—C₆—アルコキシ、C₁—C₆—アルコキシ—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₆—アルキル—S—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₆—アルキル—S (O)—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₆—アルキル—S (O)₂—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₆—アルキルカルボニル、C₁—C₆—アルコキシカルボニル、C₃—C₆—シクロアルキル、C₃—C₆—シクロアルケニル、C₃—C₆—シクロアルキル—C₁—C₃—アルキル、C₃—C₆—シクロアルケニル—C₁—C₃—アルキル、複素環、複素環—C₁—C₃—アルキル (これらは、それぞれ、ハロゲンでモノ置換もしくは多置換されていてもよい)、シアノでモノ置換もしくはジ置換されていてもよい)、ならびに、フェニル、フェニル—C₁—C₃—アルキル、ヘタリールおよびヘタリール—C₁—C₃—アルキル (これらは、それぞれ、C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—ハロアルキル、C₁—C₄—アルコキシ、C₁—C₄—ハロアルコキシ、C₃—C₆—シクロアルキル、ハロゲンまたはシアノで 1 から 4 置換されていてもよい) からなる群からの基を表し；

R¹⁹ が、水素、アルカリ金属イオンもしくはアルカリ土類金属イオンを表すか、C₁—C₄—アルキルで 1 から 4 置換されていてもよいアンモニウムイオンを表すか、または、C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—アルコキシ、C₁—C₄—アルコキシ—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—アルキル—S—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—アルキル—S (O)—C₁—C₄—アルキルおよび C₁—C₄—アルキル—S (O)₂—C₁—C₄—アルキル (これらは、それぞれ、ハロゲンでモノ置換もしくは多置換されていてもよい)、シアノでモノ置換もしくはジ置換されていてもよい) からなる群からの基を表し

;

Y^3 が、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシおよび $NR^{20}R^{21}$ からなる群からの基を表し；

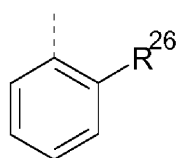
Wが、O、S、SOおよび SO_2 からなる群からの基を表し；

R^{22} が、 C_1-C_6 -アルキルからなる群、または、ハロゲン-、カルバモイル-、チオカルバモイル-もしくはシアノーで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_2-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_2-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミノスルホニル、ジ (C_1-C_4 -アルキル) アミノスルホニルからなる群からの基を表し；

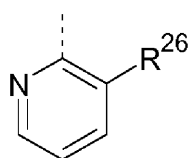
$R^2 = d$) である場合は、

R^{22} が、さらに、ハロゲン-、シアノー、ニトロ-、アミノ-、ヒドロキシー、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ-、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルオキシ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、 C_3-C_6 -アルケニルアミノ-、 C_3-C_6 -アルキニルアミノ-、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_3-C_6 -アルケニルチオ-、 C_3-C_6 -アルキニルチオ-、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、アミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル-、ジ (C_1-C_6) -アルキルアミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-もしくはジ (C_1-C_6 -アルキル) -アミノで置換されていてもよいアリールも表すか、(E-1) から (E-51)

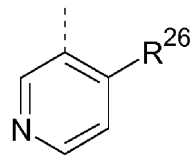
【化 2 9】



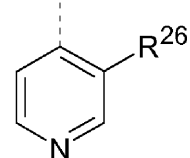
E-1



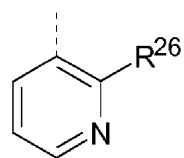
E-2



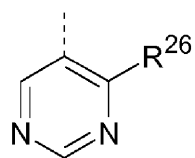
E-3



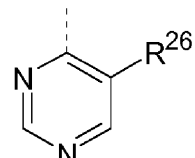
E-4



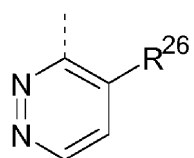
E-5



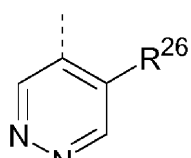
E-6



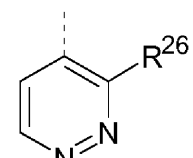
E-7



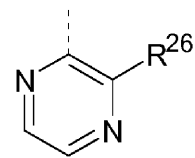
E-8



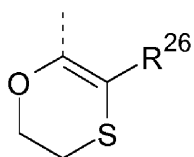
E-9



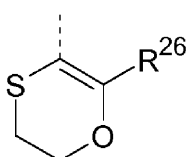
E-10



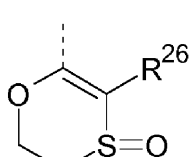
E-11



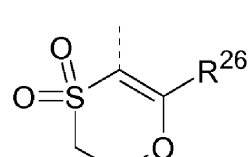
E-12



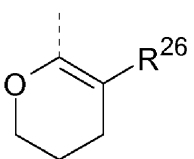
E-13



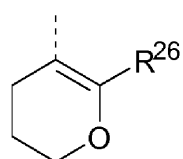
E-14



E-15



E-16

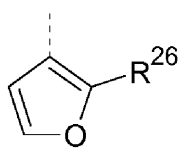


E-17

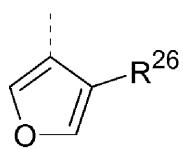
10

20

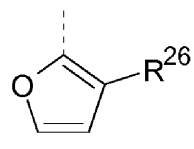
30



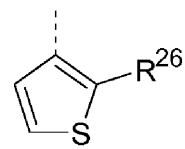
E-18



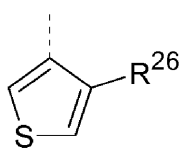
E-19



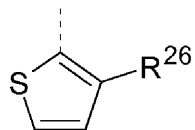
E-20



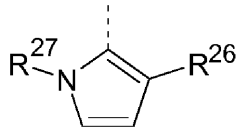
E-21



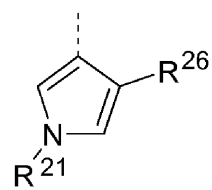
E-22



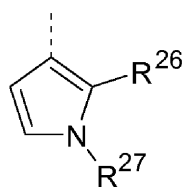
E-23



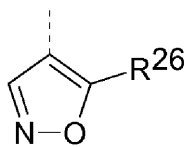
E-24



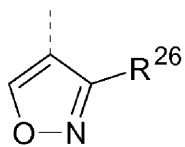
E-25



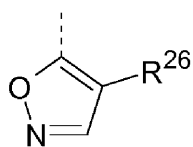
E-26



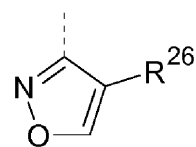
E-27



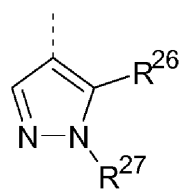
E-28



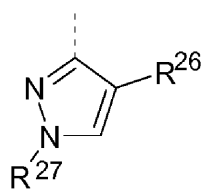
E-29



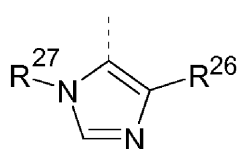
E-30



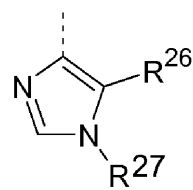
E-31



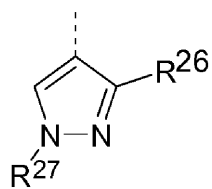
E-32



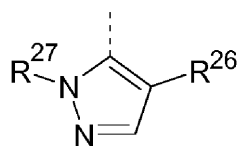
E-33



E-34



E-35



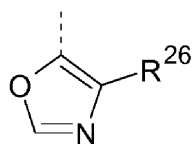
E-36

10

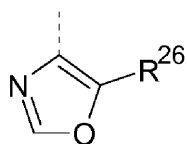
20

30

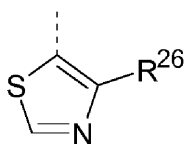
40



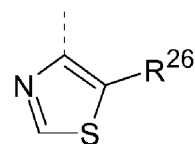
E-37



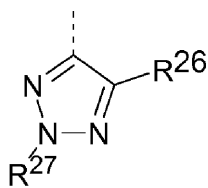
E-38



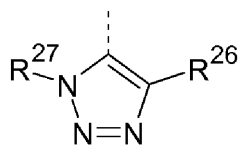
E-39



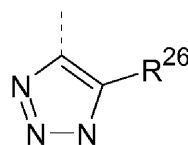
E-40



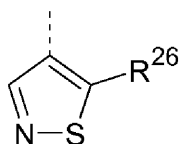
E-41



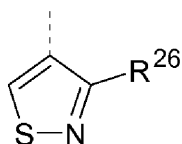
E-42



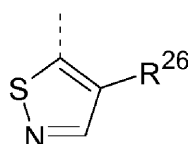
E-43



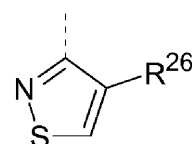
E-44



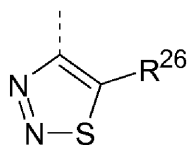
E-45



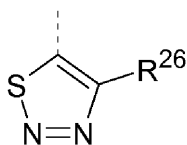
E-46



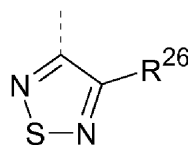
E-47



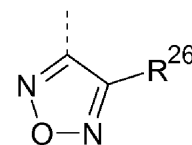
E-48



E-49



E-50



E-51

【0038】

からなる群からの基も表し；

R²⁰が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、シアノ－C₁－C₆－アルキル、C₂－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－ハロアルコキシ、C₃－C₆－アルケニルオキシ、C₃－C₆－アルキニルオキシ、C₃－C₆－シクロアルキルオキシ、C₁－C₆－アルキルカルボニルオキシ、C₂－C₆－アルケニルカルボニルオキシ、C₂－C₆－アルキニルカルボニルオキシ、C₃－C₆－シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁－C₆－アルコキシカルボニルオキシ、C₁－C₆－アルキルスルホニルオキシ、C₁－C₆－アルキルアミノ、C₃－C₆－アルケニルアミノ、C₃－C₆－アルキニルアミノ、C₃－C₆－シクロアルキルアミノ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₁－C₆－ハロアルキルチオ、C₃－C₆－アルケニルチオ、C₃－C₆－アルキニルチオ、C₃－C₆－シクロアルキルチオ、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、C₁－C₆－アルキルカルボニル、C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁－C₆－アルキルアミノカルボニル、ジ－(C₁－C₆)－アルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁－C₆－アルキルアミノスルホニル、C₁－C₆－アルキルスルホニルアミノ、C₁－C₆－アルキルカルボニルアミノ、C₁－C₆－アルキルチオカルボニルアミノからなる群からの基、または、フェニル、フェノキシ、ピリジニルおよびピリジニルオキシ（これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁－C₆－アルキルおよびC₁－C₆－ハロアルキルからなる群からの基で置換されていてもよい）からなる群からの基を表し；

R²¹が、水素、C₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₃－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₆－シクロ

10

20

30

40

50

アルキル- C_1-C_6 -アルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルおよび C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；

$R^{2\ 3}$ が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、および C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

$R^{2\ 4}$ が、水素を表すか、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、フェニルおよびフェニル- C_1-C_2 -アルキルからなる群からの各場合でハロゲン-もしくはシアノ-で置換されていてもよい基を表し；

$R^{2\ 5}$ が、水素を表すか、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、フェニルおよびフェニル- C_1-C_2 -アルキルからなる群からの各場合でハロゲン-もしくはシアノ-で置換されていてもよい基を表し；

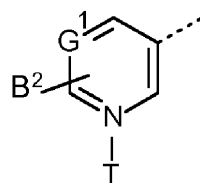
$R^{2\ 7}$ が、水素または C_1-C_4 -アルキルを表し；

$R^{2\ 6}$ が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_2 -アルキルまたはシアノ- C_1-C_4 -アルキルを表す、式 (I) の化合物、

ならびに

A が、A 基：

【化 30】



(A-a)

【0039】

を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

G^1 が、N または $C-B^1$ を表し；

B^1 が、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群からの基を表し；

B^2 が、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群からの基を表し；

T が、酸素または電子対を表し；

R^1 が、水素、 C_1-C_6 -アルキルおよび C_1-C_6 -アルコキシからなる群からの基を表し；

R^2 が、a)：

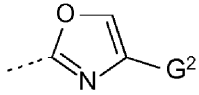
10

20

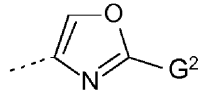
30

40

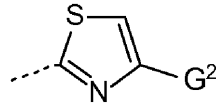
【化 3 1】



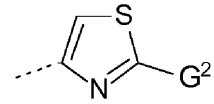
(B-5)



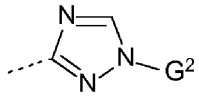
(B-6)



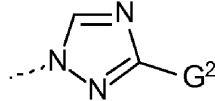
(B-7)



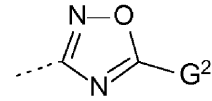
(B-8)



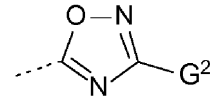
(B-9)



(B-10)

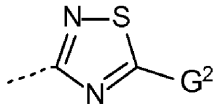


(B-11)

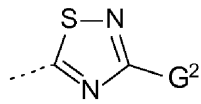


(B-12)

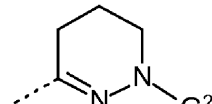
10



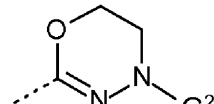
(B-13)



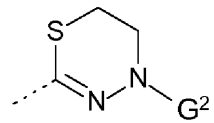
(B-14)



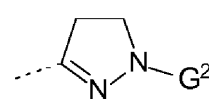
(B-15)



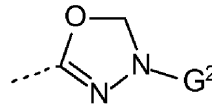
(B-16)



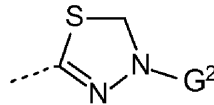
(B-17)



(B-18)

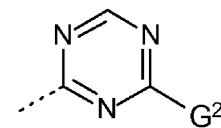


(B-19)



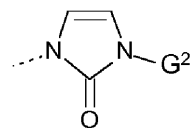
(B-20)

20

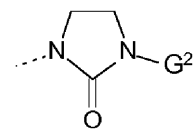


(B-28)

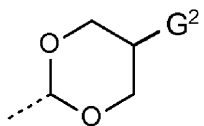
30



(B-29)



(B-30)



(B-34)

40

【0040】

からなる群からのB基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し、

G² が、水素を表し、またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ハロ - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、C₁ - C₄ - ジアルキルアミノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - シクロアルケニル、C₁ - C₄ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C

50

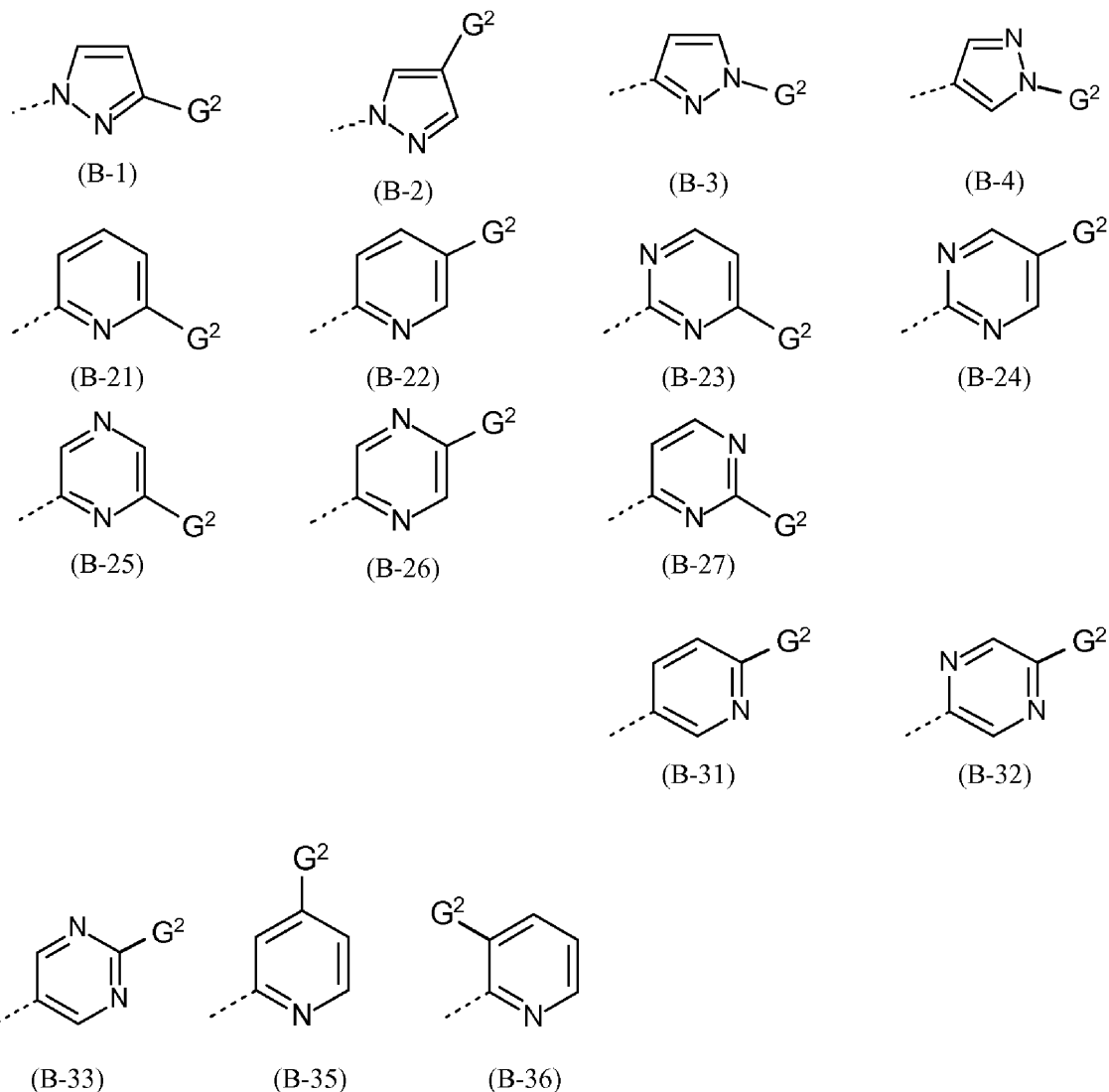
4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン化 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルフィニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルホニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 α -ヒドロキシイミノ- C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 α - C_1-C_4 -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキサカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル(これらに関しては、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)〕、フェニル(これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキルおよびハロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)、ヘテロアリール基〔ピリジル、ピリジルN-オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル(これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルキルで置換されていてもよい)〕およびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル基〔トリアゾリル- C_1-C_4 -アルキル、ピリジル- C_1-C_4 -アルキル、ピリミジル- C_1-C_4 -アルキルおよびオキサジアゾリル- C_1-C_4 -アルキル(これらに関しては、ハロゲンおよび C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)〕からなる群からの基を表し；または
 R^2 が、a a) 下記のB基：

10

20

30

【化 3 2】



【0041】

のうちの一つを表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し、

G^2 が、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -ジアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン化 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルフィニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルホニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 α -ヒドロキシイミノ- C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 α - C_1-C_4 -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチ

10

20

30

40

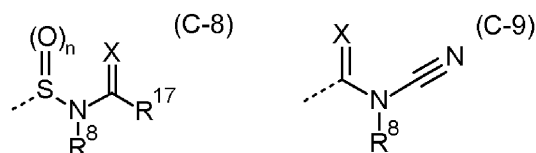
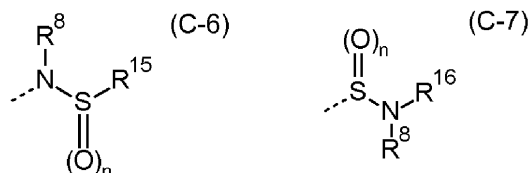
50

オ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキソカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリノニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリノニル（これらに関しては、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）〕、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキルおよびハロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）、ヘテロアリアル基〔イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルキルで置換されていてもよい）〕およびヘテロアリアル- C_1-C_4 -アルキル基〔トリアゾリル- C_1-C_4 -アルキル、ピリジル- C_1-C_4 -アルキル、ピリミジル- C_1-C_4 -アルキルおよびオキサジアゾリル- C_1-C_4 -アルキル（これらに関しては、ハロゲンおよび C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）〕からなる群からの基を表し；または

R^2 が a) または a a) 下で列記された基のうちの一つを表す場合、

G^2 が

【化 3 3】



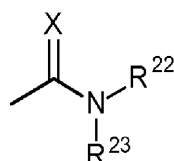
【0042】

からなる群からの C 基も表し、

破線が B 基への結合を表し、または

R^2 が、c) 下記式：

【化 3 4】



【0043】

の基を表し；または

R^2 が、d) 下記式：

10

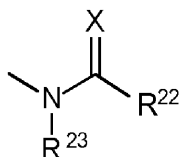
20

30

40

50

【化 3 5】



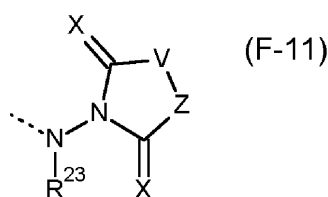
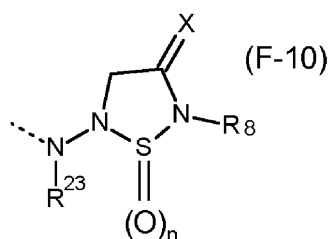
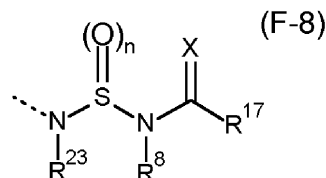
【0044】

の基を表し；または

R² が、e)

【化 3 6】

10



20

【0045】

からなる群から選択される F 基を表し；

破線が式 (I) における炭素原子への結合を表し、または

R² が、f) C₁ - C₆ - ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

X が、酸素または硫黄を表し；

X² が、酸素、硫黄、NR⁵ または NOH を表し；

30

V - Z が、R^{2 4} CH - CHR^{2 5} または R^{2 4} C = CR^{2 5} を表し；

n が、1 または 2 を表し；

R³ が、水素または C₁ - C₆ - アルキルを表し；

R⁴ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、アリール、アリール - C₁ - C₄ - アルキルおよびヘタリール - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

40

R⁵ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、アリール、アリール - C₁ - C₄ - アルキルおよびヘタリール - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；または

R³ および R⁴ が、それらが結合している窒素原子とともに、4 から 7 員環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの 1 個もしくは 2 個のさらなるヘテロ原子を含んでもよい

50

)を形成しており、

R^6 が、水素または C_1-C_4 -アルキルを表し；

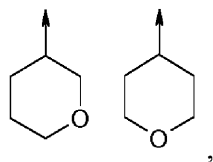
R^7 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；または

R^6 および R^7 が、それらが結合している窒素原子とともに、4から7員環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成しており、

R^8 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-およびシアノ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表し、またはカチオンまたは C_1-C_6 -アルキル-もしくはアリール- C_1-C_6 -アルキル-置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

R^9 が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-および C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-もしくは C_1-C_6 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル（ここで、1個の環員が、硫黄、酸素（酸素原子同士が互いに直接隣接してはならない）および窒素（ここでは、特に、

【化37】



【0046】

を表し、矢印は各場合で、基（C-1）および基（F-1）における硫黄原子への結合を示す。）からなる群からのヘテロ原子によって置き換わっていてもよい。）各場合でハロゲン-、シアノ-（アルキル部分でも）、ニトロ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_6 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シ

クロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルもしくはアミノカルボニル置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ (R' および R'' は、互いに独立に、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群からの基を表す。)を表し、または

R^{1-5} が、各場合でメチル、シアノ、カルバモイル置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でメチル、トリフルオロメチル、ハロゲン、シアノもしくはカルバモイル置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_2 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル(ここで、該環は、硫黄、酸素(ここで、酸素原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群から選択される少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいてもよい)、各場合で C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_4 -アルキル)-アミノ、ハロゲン、ニトロまたはシアノ置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルキル- C_1-C_4 -アルコキシカルボニルもしくは C_1-C_4 -アルキルスルホニル置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し;

基($C-6$)における R^8 および R^{1-5} が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環を形成することもでき、それは硫黄、酸素(ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない)および窒素からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいてもよく;

R^{1-6} が、水素、各場合でメチル、シアノ、カルバモイルもしくはカルボキシル置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルもしくは C_1-C_6 -アルキルカルボニル置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル(これらの環は、硫黄、酸素(酸素原子は互いに直接隣接してはならない。))および窒素からなる群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含むことができる。)、各場合でハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルまたは C_1-C_6 -アルキルカルボニル置換されてい

10

20

30

40

50

もよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_2 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルもしくは C_1-C_6 -アルキルカルボニル置換されていてもよいアミノ基からなる群からの基を表し；

R^{1-7} が、各場合でハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルもしくは C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシもしくは C_1-C_6 -ハロアルコキシ置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、N-ピロリジニル、N-ペリジニル、N-モルホリニル、N-チオモルホリニル、N-チオモルホリニル1-オキシド、N-チオモルホリニル1, 1-ジオキシド、N-ペラジニル、N-1-メチルペラジニルまたはN-2-オキソ-1-メチルペラジニル、各場合でハロゲン、シアノ（アルキル部分でも）、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ（ C_1-C_6 -アルキル）アミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルもしくはアミノカルボニル置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ （ R' および R'' は、互いに独立に、それぞれ、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群からの基を表す。）を表し；

基（C-8）および基（F-8）における R^8 および R^{1-7} が、それらが結合しているN-C（X）基とともに、飽和もしくは不飽和のハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ置換されていてもよい5から7員の環（硫黄、酸素（酸素原子同士が互いに直接隣接してはならない。）および窒素からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子および／または1個のカルボニル基を含んでいてもよい。）を形成していてもよく、特に、 R^8 および R^{1-7} が、それらが結合しているN-C（X）基とともに、

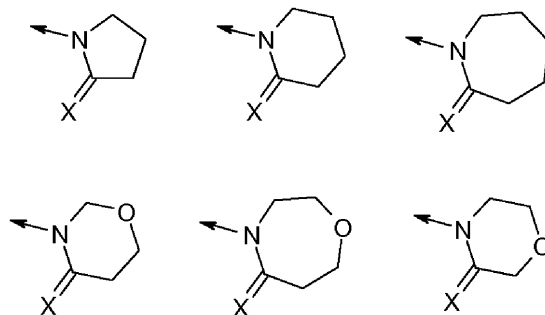
10

20

30

40

【化 3 8】



10

【0047】

からなる群からの基（矢印は各場合で、基（C-8）および基（F-8）における硫黄原子への結合を示す。）を表すことができ、

R^{18} が、水素、ヒドロキシ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S(O)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル- C_1-C_3 -アルキル、複素環、複素環- C_1-C_3 -アルキル（それらはそれぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換されていてもよく、またはシアノによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい。）、およびフェニル、フェニル- C_1-C_3 -アルキル、ヘタリールおよびヘタリール- C_1-C_3 -アルキル（それぞれ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、ハロゲンもしくはシアノによってモノ置換ないしテトラ置換されていてもよい。）からなる群からの基を表し；

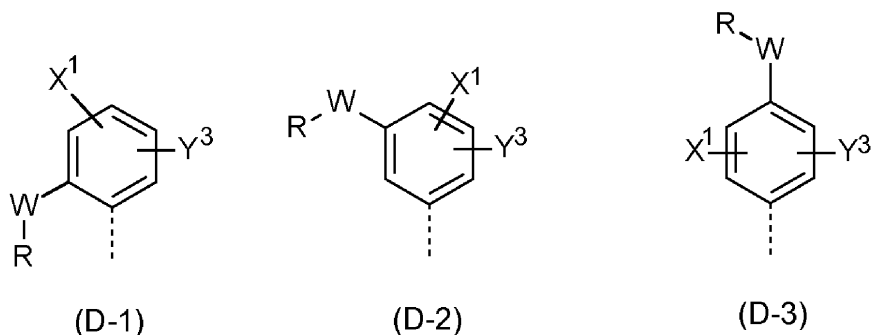
20

R^{19} が、水素、アルカリもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、または C_1-C_4 -アルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_4 -アルキル（それぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換またはシアノによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）からなる群からの基を表し；

30

R^{22} が、(D-1) から (D-3)：

【化 3 9】



40

【0048】

からなる群からの基を表し；

破線が、基 c) における窒素原子への、または基 d) における炭素原子への結合を表し；

X^{18} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシおよび C_1-C_6 -ハ

50

ロアルコキシからなる群からの基を表し；

Rが、 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$ を表し、または C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S(O)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_4 -アルキル（それぞれ、ハロゲン、酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）もしくはシアノによって置換されていてもよい。）を表し、または $\text{R}^{18}-\text{CO}-\text{C}_1-\text{C}_4$ -アルキルを表し、または $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}-\text{CO}-\text{C}_1-\text{C}_4$ -アルキルを表し、 C_3-C_6 -シクロアルキル（これは、酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_8 -シクロアルケニル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 -シクロアルケニル- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、複素環（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノ置換もしくはジ置換されていてもよい）を表し、またはフェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキル、ヘタリールおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキル（それぞれ、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシによってモノ置換ないしトリ置換されていてもよい）を表し；

Y^3 が、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシおよび $\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ からなる群からの基を表し；

Wが、S、SOおよびSO₂からなる群からの基を表し；

または

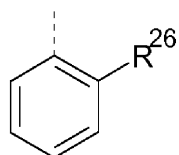
R^{22} が、

10

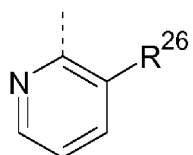
20

30

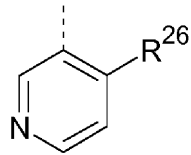
【化 4 0】



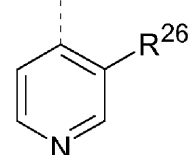
E-1



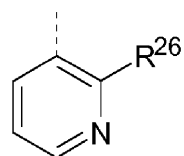
E-2



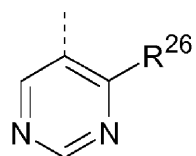
E-3



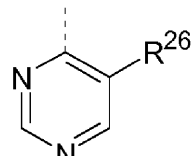
E-4



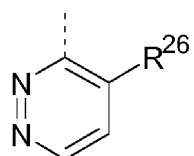
E-5



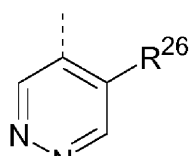
E-6



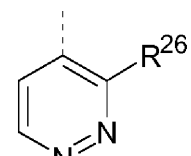
E-7



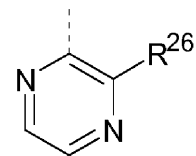
E-8



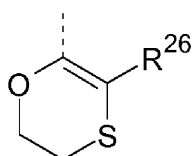
E-9



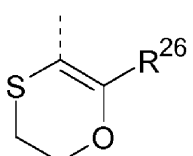
E-10



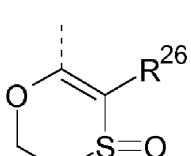
E-11



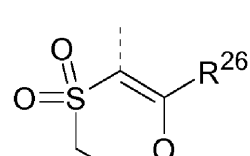
E-12



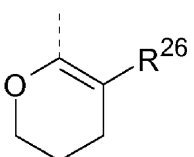
E-13



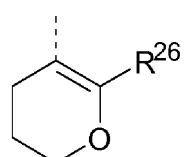
E-14



E-15



E-16

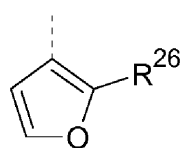


E-17

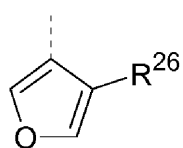
10

20

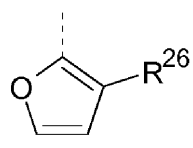
30



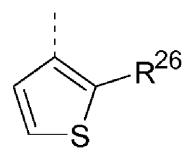
E-18



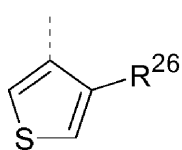
E-19



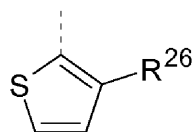
E-20



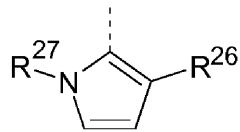
E-21



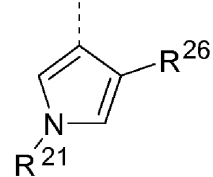
E-22



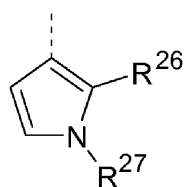
E-23



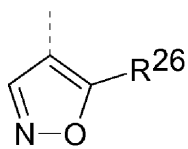
E-24



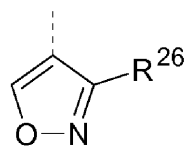
E-25



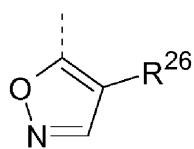
E-26



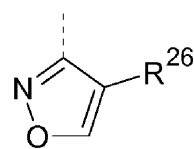
E-27



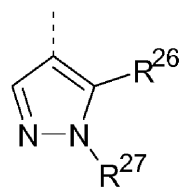
E-28



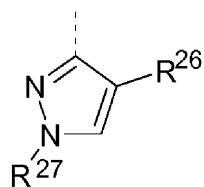
E-29



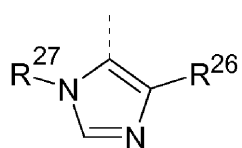
E-30



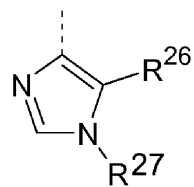
E-31



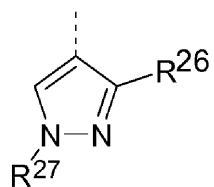
E-32



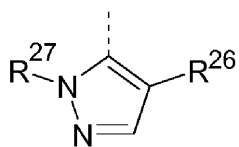
E-33



E-34



E-35



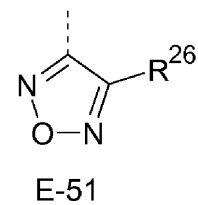
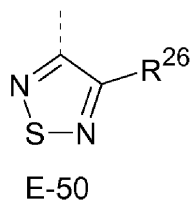
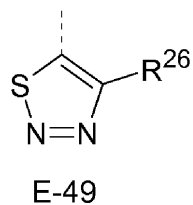
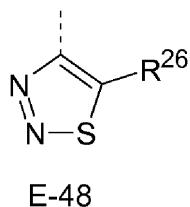
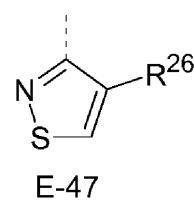
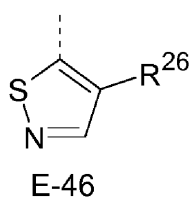
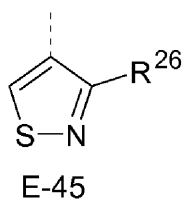
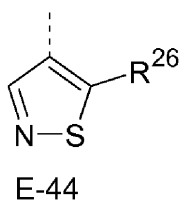
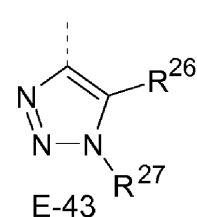
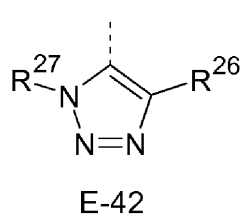
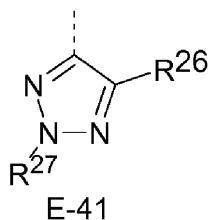
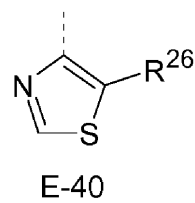
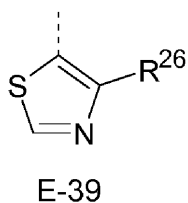
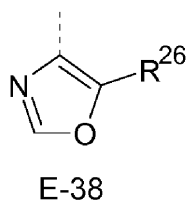
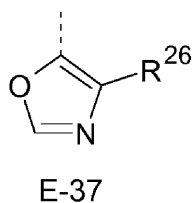
E-36

10

20

30

40



【0049】

からなる群からのE基を表し；

R²⁰は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、シアノ－C₁－C₆－アルキル、C₂－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－ハロアルコキシ、C₃－C₆－アルケニルオキシ、C₃－C₆－アルキニルオキシ、C₃－C₆－シクロアルキルオキシ、C₁－C₆－アルキルカルボニルオキシ、C₂－C₆－アルケニルカルボニルオキシ、C₂－C₆－アルキニルカルボニルオキシ、C₃－C₆－シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁－C₆－アルコキシカルボニルオキシ、C₁－C₆－アルキルスルホニルオキシ、C₁－C₆－アルキルアミノ、C₃－C₆－アルケニルアミノ、C₃－C₆－アルキニルアミノ、C₃－C₆－シクロアルキルアミノ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₁－C₆－ハロアルキルチオ、C₃－C₆－アルケニルチオ、C₃－C₆－アルキニルチオ、C₃－C₆－シクロアルキルチオ、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、C₁－C₆－アルキルカルボニル、C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁－C₆－アルキルアミノカルボニル、ジ－(C₁－C₆)－アルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁－C₆－アルキルアミノスルホニル、C₁－C₆－アルキルスルホニルアミノ、C₁－C₆－アルキルカルボニルアミノ、C₁－C₆－アルキルチオカルボニルアミノ、フェニル、フェノキシ、ピリジニルおよびピリジニルオキシからなる群からの基を表し、それらがそれぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁－C₆－アルキルおよびC₁－C₆－ハロアルキルからなる群からの基によって置換されていてもよく；

R²¹が、水素、C₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₃－C₆－アルケニル、C₂－C₆－アルキニル、C₃－C₆－シクロ

10

20

30

40

50

アルキル-C₁-C₆-アルキル、シアノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₂-C₆-アルケニルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニル、C₂-C₆-ハロアルケニルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルおよびC₁-C₆-ハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；

R^{2 3}が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニルチオ-C₁-C₄-アルキル、シアノ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルからなる群からの基を表し；

R^{2 4}が、水素を表し、またはC₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、フェニルおよびフェニル-C₁-C₂-アルキルからなる群からの各場合でハロゲン置換もしくはシアノ置換されていてもよい基を表し；

R^{2 5}が、水素を表し、またはC₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、フェニルおよびフェニル-C₁-C₂-アルキルからなる群からの各場合でハロゲン置換もしくはシアノ置換されていてもよい基を表し；

R^{2 7}が、水素またはC₁-C₄-アルキルを表し；

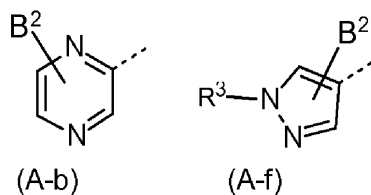
R^{2 6}が、水素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホニル-C₁-C₂-アルキルまたはシアノ-C₁-C₄-アルキルを表す、式（I）の化合物である。

【0050】

好ましい範囲（2）：特に好ましいものは、

Aが、

【化41】



【0051】

からなる群から選択されるA基を表し、

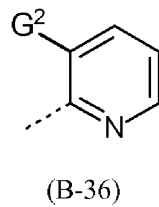
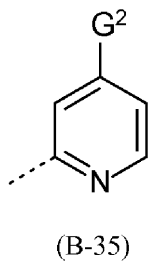
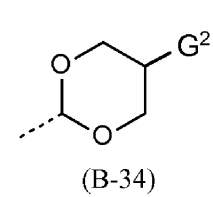
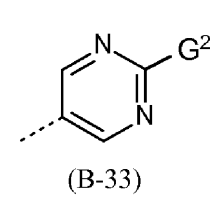
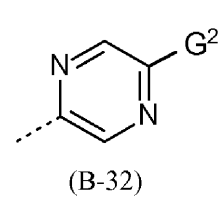
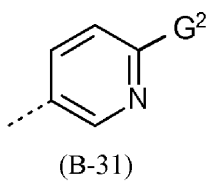
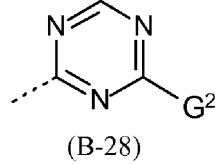
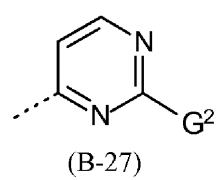
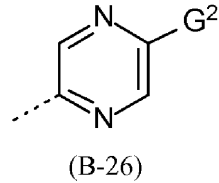
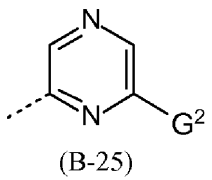
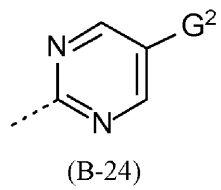
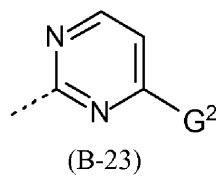
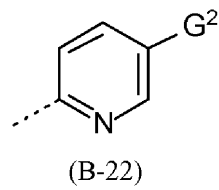
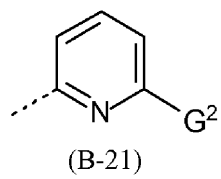
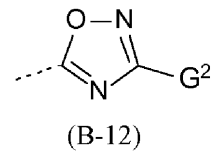
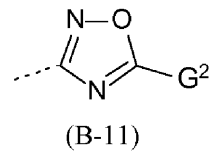
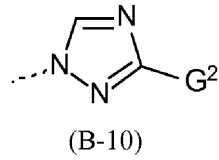
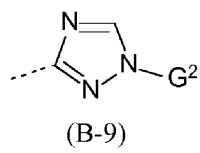
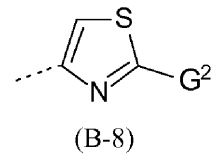
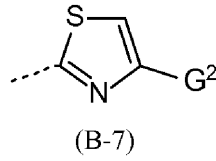
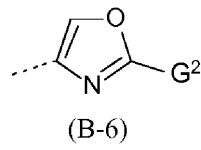
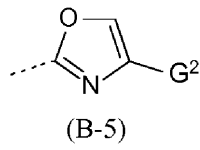
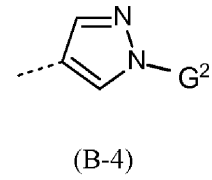
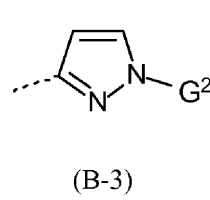
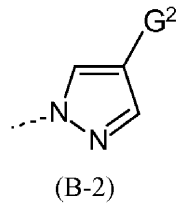
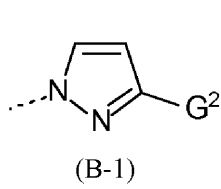
破線が、式（I）の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

B²が、水素、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群からの基を表し；

R¹が、水素、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-アルコキシからなる群からの基を表し；

R²が、a)

【化 4 2】



【 0 0 5 2 】

からなる群から選択される B 基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または
R² が、b) (D-1) から (D-3)：

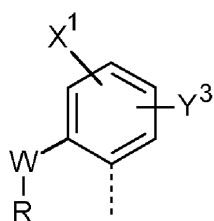
10

20

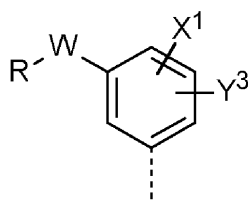
30

40

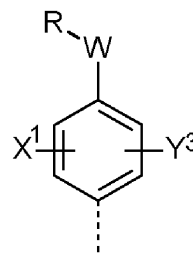
【化 4 3】



(D-1)



(D-2)



(D-3)

10

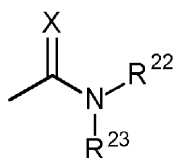
【0053】

からなる群からの基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または

R² が、c) 下記式：

【化 4 4】



20

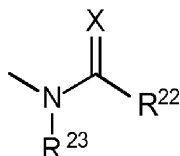
【0054】

の基を表し；

または

R² が、d) 下記式：

【化 4 5】



30

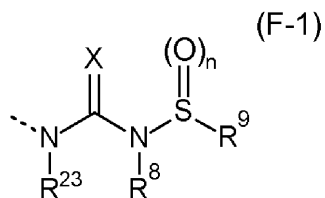
【0055】

の基を表し；

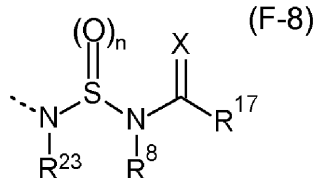
または

R² が、e) (F-1)、(F-8) および (F-10)：

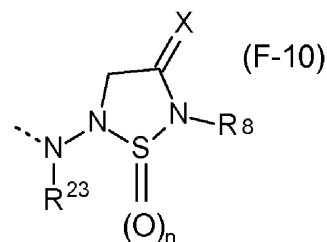
【化 4 6】



(F-1)



(F-8)



(F-10)

40

【0056】

からなる群から選択される F 基を表し、

破線が、式 (I) における炭素原子への結合を表し；または

R² が、f) C₁ - C₆ - ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；G² が、水素またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ハロ - C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄ - アルキル) - アミノ、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ -

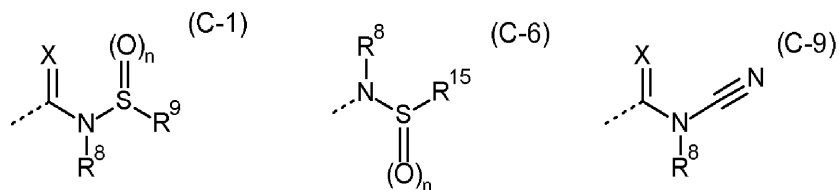
50

C_4 －アルコキシ、 C_1 － C_4 －アルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキル、ハロゲン化 C_1 － C_4 －アルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキル、ビス（ C_1 － C_4 －アルコキシ）－ C_1 － C_4 －アルキル、ビス（ハロ－ C_1 － C_4 －アルコキシ）－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシ－（ C_1 － C_4 －アルキルスルファニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシ－（ C_1 － C_4 －アルキルスルフィニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシ－（ C_1 － C_4 －アルキルスルホニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、ビス（ C_1 － C_4 －アルキルスルファニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、ビス（ハロ－ C_1 － C_4 －アルキルスルファニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、ビス（ヒドロキシ－ C_1 － C_4 －アルキルスルファニル）－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシカルボニル、 C_1 － C_4 －アルコキシカルボニル－ C_1 － C_4 －アルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1 － C_4 －アルキルチオ、 C_1 － C_4 －アルキルスルフィニル、 C_1 － C_4 －アルキルスルホニル、 C_1 － C_4 －ハロアルキルチオ、 C_1 － C_4 －ハロアルキルスルフィニル、 C_1 － C_4 －ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキサカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル（これらに関しては、 C_1 － C_4 －アルキル、ハロ－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシおよび C_1 － C_4 －アルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキルで置換されていてもよい）〕、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 － C_4 －アルキルおよびハロ－ C_1 － C_4 －アルキルで置換されていてもよい）、ヘテロアリアル基〔ピリジル、ピリジルN－オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、 C_1 － C_4 －アルキル、ハロ－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシ、ハロ－ C_1 － C_4 －アルコキシ、 C_1 － C_4 －アルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －アルキルチオ、 C_1 － C_4 －アルキルチオ－ C_1 － C_4 －アルキルおよび C_3 － C_6 －シクロ－ C_1 － C_4 －アルキルで置換されていてもよい）〕およびヘテロアリアル－ C_1 － C_4 －アルキル基〔トリアゾリル－ C_1 － C_4 －アルキル、ピリジル－ C_1 － C_4 －アルキル、ピリミジル－ C_1 － C_4 －アルキルおよびオキサジアゾリル－ C_1 － C_4 －アルキル（これらに関しては、ハロゲンおよび C_1 － C_4 －アルキルで置換されていてもよい）〕からなる群からの基を表し；

または

G^2 が、（C－1）、（C－6）および（C－9）：

【化47】



【0057】

からなる群からの基を表し、

破線がB基への結合を表し；

Xが、酸素を表し；

X^1 が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 C_1 － C_4 －アルキル、 C_1 － C_4 －ハロアルキル、 C_3 － C_6 －シクロアルキル、 C_1 － C_4 －アルコキシおよび C_1 － C_4 －ハロアルコキシからなる群からの基を表し；

X^2 が、酸素、硫黄、 NR^5 または NOH を表し；

n が、2 を表し；

R が、 $NR^{18}R^{19}$ を表し、または C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル- $S-C_1-C_3$ -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル- $S(O)-C_1-C_3$ -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル- $S(O)_2-C_1-C_3$ -アルキル（それぞれ、ハロゲンによってモノないしヘプタ置換されていてもよく、酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）によってモノもしくはジ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または $R^{18}-CO-C_1-C_2$ -アルキルを表し、または $NR^{18}R^{19}-CO-C_1-C_2$ -アルキルを表し、または C_3-C_6 -シクロアルキル（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_8 -シクロアルケニル（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 -シクロアルケニル- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $C=O$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、またはフェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキル、ヘタリールおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキル（それぞれ、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシによってモノないしトリ置換されていてもよい）を表し；

R^3 が、 C_1-C_4 -アルキルを表し；

R^4 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^5 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^6 が、水素または C_1-C_4 -アルキルを表し；

R^7 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール- C_1-C_4 -アルキルまたはヘタリ

10

20

30

40

50

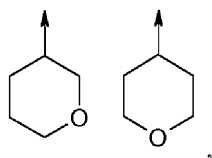
ール-C₁-C₄-アルキルからなる群からの基を表し；、または

R⁶ および R⁷ が、それらが結合している窒素原子とともに、4 から 7 員環を形成しており、その環は窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの 1 個もしくは 2 個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよく；

R⁸ が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C₁-C₆-アルキルカルボニルおよび C₁-C₆-アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C₁-C₆-アルコキシカルボニルおよびハロゲン-
10
C₁-C₆-アルキル-、C₁-C₆-アルコキシ-、C₁-C₆-ハロアルキル-およびシアノ-置換されていてもよい C₃-C₆-シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表し、またはカチオンまたは C₁-C₆-アルキル-もしくはアリール-C₁-C₆-アルキル-置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

R⁹ が、各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-アルキルチオ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-および C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニルおよび C₂-C₄-アルキニル、各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコ
20
キシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-置換されていてもよい C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキルおよび C₃-C₄-シクロアルケニル（1 個もしくは 2 個の環員が、各場合で、硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からのヘテロ原子によって置き換わっていてもよい（ここで、特には、

【化 4 8】



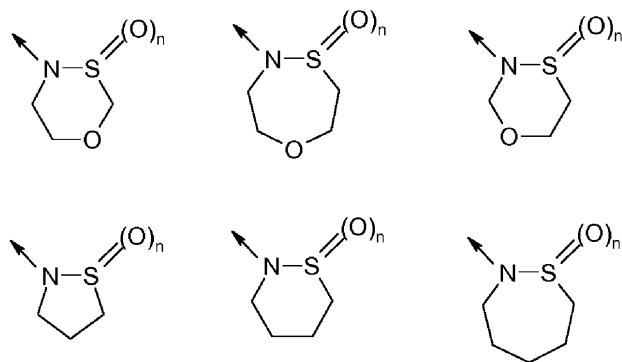
【0058】

を表し、矢印は各場合で、基（C-1）および基（F-1）における硫黄原子への結合を示す）、各場合でハロゲン-、シアノ-（アルキル部分においても）、ニトロ-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₃-C₆-シクロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-アルキルチオ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、C₁-C₄-アルキルアミノ-、ジ（C₁-C₄-アルキル）アミノ-、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシ
40
カルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₂-C₄-アルケニル-、C₂-C₄-アルキニル-、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-アルキルカルボニル-、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール-C₁-C₄-アルキルおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキルからなる群からの基を表し、または NR'¹R''（R'¹ および R'' は、互いに独立に、水素および C₁-C₄-アルキルからなる群からの基を表す。）を表し、または

基（C-1）および基（F-1）における R⁸ および R⁹ が、それらが結合している N-S（O）_n 基とともに、飽和または不飽和のハロゲン-、C₁-C₆-アルキル-、C
50

$1-C_6$ -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ置換されていてもよい5から7員の環（硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの1個もしくは2個のヘテロ原子および／または少なくとも1個および好ましくは正確に1個のカルボニル基を含んでいてもよい）を形成していることもでき、特に、 R^8 および R^9 がそれらが結合しているN-S(O)_n基とともに、

【化49】



10

【0059】

からなる群からの基を表していてもよく（矢印は各場合で、C(X)基への結合を示す。）；

20

R^{15} が、各場合でメチル置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でメチル、ハロゲン、シアノまたはカルバモイル置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_2 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニルからなる群からの基を表し；

基(C-6)における R^8 および R^{15} が、それらが結合しているN-S(O)_n基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい4から8員の環を形成することもでき、それは硫黄、酸素（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいてもよく；

30

R^{17} が、各場合でハロゲン、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、N-ピロリジニル、N-ピペリジニル、N-モルホリニル、N-チオモルホリニル、N-チオモルホリニル1-オキシド、N-チオモルホリニル1,1-ジオキシド、N-ピペラジニル、N-1-メチルピペラジニルおよびN-2-オキソ-1-メチルピペラジニル、各場合でハロゲン、シアノ（アルキル部分においても）、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C₁-C₄-アルキル)アミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ア

40

50

ルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニル置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ (R' および R'' は、互いに独立に、水素および C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表す。)を表し；

R^{18} が、水素、ヒドロキシ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、複素環、複素環- C_1-C_3 -アルキル（それぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）、およびフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルおよびチアゾリルメチル（それぞれ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、 C_1-C_3 -ハロアルコキシ、シクロプロピル、フッ素、塩素、臭素またはシアノによってモノないしトリ置換されていてもよい）からなる群からの基を表し；

R^{19} は、水素を表し、アルカリもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、または C_1-C_4 -アルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_2 -アルキル（それぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）からなる群からの基を表し；

Y^3 が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルコキシからなる群からの基を表し；

Wが、S、SOおよびSO₂ からなる群からの基を表し；

R^2 が基c)を表す場合、 R^{22} が、 C_1-C_6 -アルキル、ハロゲン、カルバモイル、チオカルバモイルまたはシアノ置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキルオキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_2-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_2-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルスルフィニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -

10

20

30

40

50

ハロアルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_4 -アルキル)-アミノスルホニルからなる群からの基を表し；

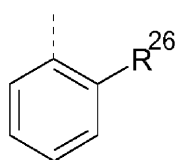
R^2 が基 c) を表す場合、 $R^{2,3}$ が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^2 が基 d) を表す場合、 $R^{2,3}$ が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

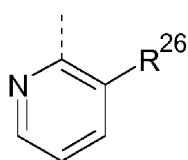
または、 $R^2 = d)$ の場合、

$R^{2,2}$ も、ハロゲン-、シアノ-、ニトロ-、アミノ-、ヒドロキシ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルオキシ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、アミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル-、ジ- (C_1-C_6)-アルキルアミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-置換されていてもよいフェニルを表し、または

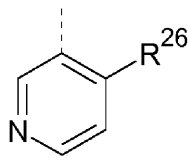
【化 50】



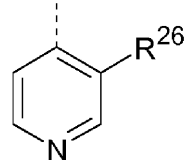
E-1



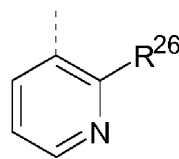
E-2



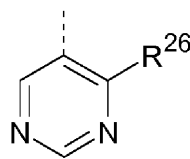
E-3



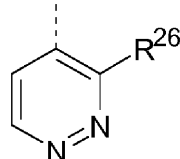
E-4



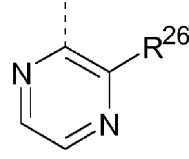
E-5



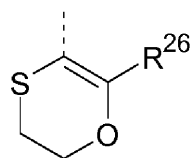
E-6



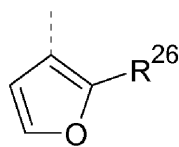
E-10



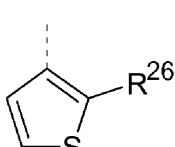
E-11



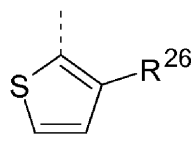
E-13



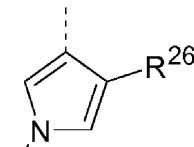
E-18



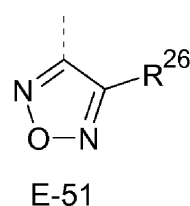
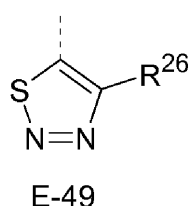
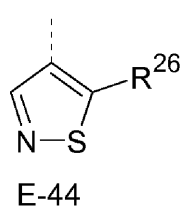
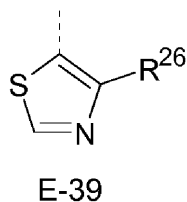
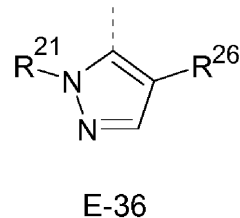
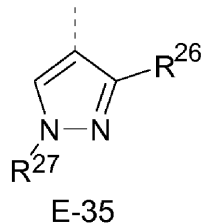
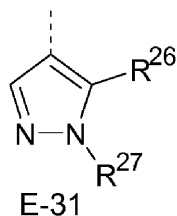
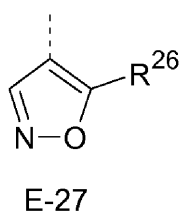
E-21



E-23



E-25



10

【0060】

からなる群からの E 基を表し；

R²⁷ が、水素または C₁ - C₄ - アルキルを表し；

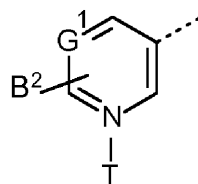
R²⁶ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル - C₁ - C₂ - アルキルまたはシアノ - C₁ - C₄ - アルキルを表す式 (I) の化合物、

20

ならびに

A が、A 基：

【化51】



(A-a)

30

【0061】

を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

G¹ が、N または C - B¹ を表し；

B¹ が、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキルおよび C₁ - C₄ - ハロアルキルからなる群からの基を表し；

B² が、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキルおよび C₁ - C₄ - ハロアルキルからなる群からの基を表し；

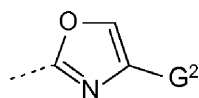
40

T が、酸素または電子対を表し；

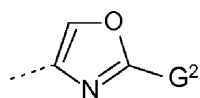
R¹ が、水素、C₁ - C₄ - アルキルおよび C₁ - C₄ - アルコキシからなる群からの基を表し；

R² が、a)

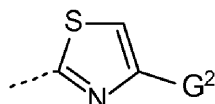
【化 5 2】



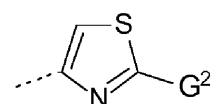
(B-5)



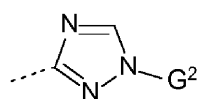
(B-6)



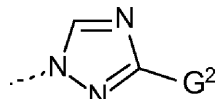
(B-7)



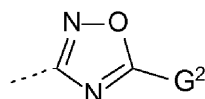
(B-8)



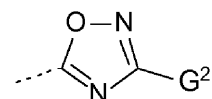
(B-9)



(B-10)

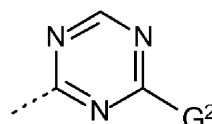


(B-11)

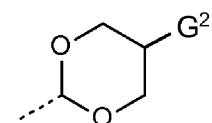


(B-12)

10



(B-28)



(B-34)

20

【0062】

からなる群からのB基を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；

G² は、水素、またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁－C₄－アルキルアミノ、ハロ－C₁－C₄－アルキルアミノ、C₁－C₄－ジアルキルアミノ、C₁－C₄－アルキル、ハロ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ、ハロ－C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ハロゲン化C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ビス (C₁－C₄－アルコキシ)－C₁－C₄－アルキル、ビス (ハロ－C₁－C₄－アルコキシ)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ－(C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ－(C₁－C₄－アルキルスルフィニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ－(C₁－C₄－アルキルスルホニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス (C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス (ハロ－C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス (ヒドロキシ－C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル－C₁－C₄－アルキル、C (X²) NR³R⁴、NR⁶R⁷、C₁－C₄－アルキルチオ、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－アルキルスルホニル、C₁－C₄－ハロアルキルチオ、C₁－C₄－ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₄－ハロアルキルスルホニル、複素環基 [ジオキサニル、ジオキソラニル、ジオキセパニル、ジオキソカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒド

30

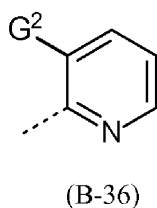
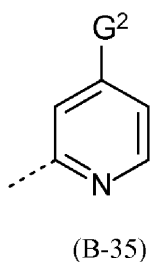
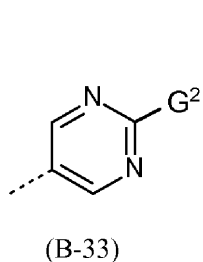
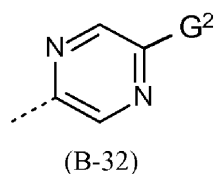
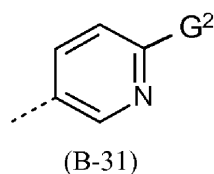
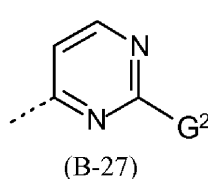
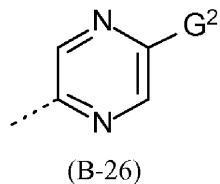
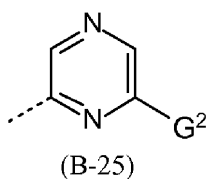
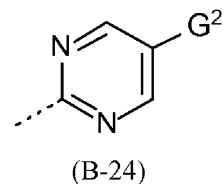
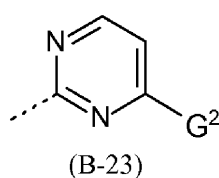
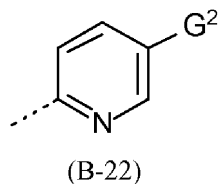
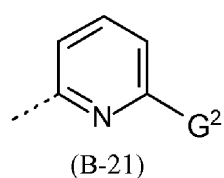
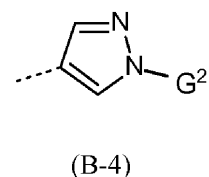
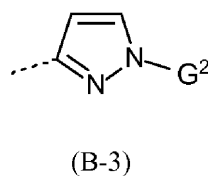
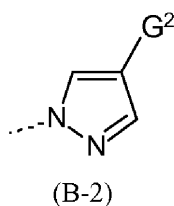
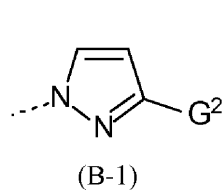
40

50

ロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリノニル（これらに関しては、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）、フェニル（これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキルおよびハロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）、ヘテロアリール基〔ピリジル、ピリジルN-オキシド、ピリミジル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル（これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）〕およびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル基〔トリアゾリル- C_1-C_4 -アルキル、ピリジル- C_1-C_4 -アルキル、ピリミジル- C_1-C_4 -アルキルおよびオキサジアゾリル- C_1-C_4 -アルキル（これらに関しては、ハロゲンおよび C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい）〕からなる群からの基を表し、または

R^2 が、a a)

【化53】



【0063】

からなる群からのB基を表し；

G^2 が、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ハロ-C

10

20

30

40

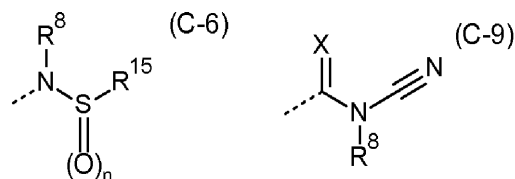
50

C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -ジアルキルアミノ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン化 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルフィニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ-(C_1-C_4 -アルキルスルホニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、複素環基〔ジオキサニル、ジオキサソラニル、ジオキセパニル、ジオキサカニル、オキサチアニル、オキサチオラニル、オキサチエパニル、オキサチオカニル、ジチアニル、ジチオラニル、ジチエパニル、ジチオカニル、オキサチアニルオキシド、オキサチオラニルオキシド、オキサチエパニルオキシド、オキサチオカニルオキシド、オキサチアニルジオキシド、オキサチオラニルジオキシド、オキサチエパニルジオキシド、オキサチオカニルジオキシド、モルホリニル、トリアゾリニル、オキサゾリニル、ジヒドロオキサジアジニル、ジヒドロジオキサジニル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジニルおよびピラゾリニル(これらに関しては、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)〕、フェニル(これに関しては、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキルおよびハロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)、ヘテロアリール基〔イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、フラニル、チエニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニルおよびイソキノリニル(これらに関しては、ハロゲン、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロ- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)〕およびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル基〔トリアゾリル- C_1-C_4 -アルキル、ピリジル- C_1-C_4 -アルキル、ピリミジル- C_1-C_4 -アルキルおよびオキサジアゾリル- C_1-C_4 -アルキル(これらに関しては、ハロゲンおよび C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい)〕からなる群からの基を表し；

または、 R^2 がa)またはaa)下に列記された基のうちの一つを表す場合、

G^2 が、(C-6)および(C-9)：

【化54】



【0064】

からなる群から選択されるC基も表し、

破線がB基への結合を表し；または

R^2 が、c)下記式：

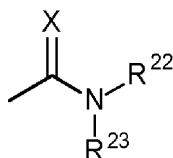
10

20

30

40

【化 5 5】



【0065】

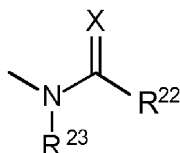
の基を表し；

または

R² が、d) 下記式：

10

【化 5 6】



【0066】

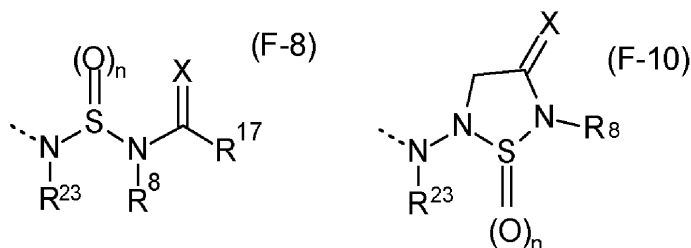
の基を表し；

または

R² が、e) (F-8) および (F-10)：

20

【化 5 7】



【0067】

からなる群から選択される F 基を表し、

30

破線が、式 (I) における炭素原子への結合を表し；または

R² が、f) C₁ - C₆ - ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

X が、酸素を表し；

X² が、酸素、硫黄、NR⁵ または NOH を表し；

n が、2 を表し；

R³ が、C₁ - C₄ - アルキルを表し；

R⁴ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルおよび C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

40

R⁵ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルおよび C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

R⁶ が、水素または C₁ - C₄ - アルキルを表し；

50

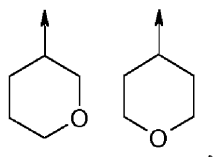
R^7 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；または

R^6 および R^7 が、それらが結合している窒素原子とともに、4から7員環（ここで、該環は、窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよい）を形成しており；

R^8 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-およびシアノ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表し、またはカチオンまたは C_1-C_6 -アルキル-またはアリール- C_1-C_6 -アルキル-置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

R^9 が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル（1個もしくは2個の環員が、各場合で、硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からのヘテロ原子によって置き換わっていてもよい（ここで、特には、

【化58】



【0068】

を表し、矢印は各場合で、基（C-1）における硫黄原子への結合を示す。））、各場合でハロゲン-、シアノ-（アルキル部分においても）、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_4 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_2-C_4 -アルケニル-、 C_2-C_4 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール-

C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ (R' および R'' は、互いに独立に、水素および C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表す。)を表し；

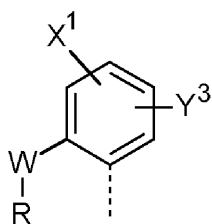
R^{15} が、各場合でメチル-置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合でメチル-、ハロゲン-、シアノ-またはカルバモイル-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_2 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニルからなる群からの基を表し；または

基 ($C-6$) における R^8 および R^{15} が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 から 8 員の環を形成することもでき、それは硫黄、酸素 (ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない) および窒素からなる群からの 1 個もしくは 2 個のさらなるヘテロ原子および/または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいてもよく；

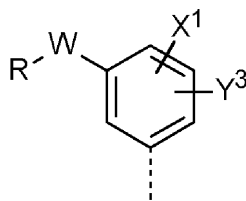
R^{17} が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、 N -ピロリジニル、 N -ピペリジニル、 N -モルホリニル、 N -チオモルホリニル、 N -チオモルホリニル 1-オキシド、 N -チオモルホリニル 1, 1-ジオキシド、 N -ピペラジニル、 N -1-メチルピペラジニルまたは N -2-オキソ-1-メチルピペラジニル、各場合でハロゲン-、シアノ- (アルキル部分においても)、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルアミノ-、ジ (C_1-C_4 -アルキル) アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_2-C_4 -アルケニル-、 C_2-C_4 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ (R' および R'' は、互いに独立に水素および C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表す。)を表し；

R^{22} が、(D-1) から (D-3) ；

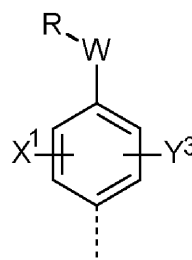
【化 59】



(D-1)



(D-2)



(D-3)

10

20

30

40

50

【0069】

からなる群から選択されるD基を表し、

破線が、基c)における窒素原子への結合または基d)における炭素原子への結合を表し；

Rが、 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$ を表し、または C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_3 -アルキル（これらはそれぞれ、ハロゲンによってモノないしヘプタ置換されていてもよく、酸素によってモノもしくはジ置換されていてもよく（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい。）を表し、または $\text{R}^{18}-\text{CO}-\text{C}_1-\text{C}_2$ -アルキルを表し、または $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}-\text{CO}-\text{C}_1-\text{C}_2$ -アルキルを表し、または C_3-C_6 -シクロアルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_8 -シクロアルケニル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環- C_1-C_4 -アルキル（酸素（これは、 $\text{C}=\text{O}$ をもたらす）、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、またはフェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキル、ヘタリールおよびヘタリール- C_1-C_4 -アルキル（それぞれ、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシによってモノないしトリ置換されていてもよい）を表し；

X^{14} が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルコキシからなる群からの基を表し；

Y^{15} が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルコキシからなる群からの基を表し；

Wが、S、SOおよびSO₂からなる群からの基を表し；

R^{18} が、水素、ヒドロキシ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、複素環、複素環- C_1-C_3 -アルキル（それぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）、およびフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルおよびチアゾリルメチル（それぞれ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_1-C_3

ーアルコキシ、 C_1-C_3 ーハロアルコキシ、シクロプロピル、フッ素、塩素、臭素またはシアノによってモノないしトリ置換されていてもよい) からなる群からの基を表し；

R^{1-9} が、水素を表し、アルカリもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、または C_1-C_4 ーアルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または C_1-C_4 ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルコキシ、 C_1-C_4 ーアルコキシー C_1-C_2 ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルキルー $S-C_1-C_2$ ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルキルー $S(O)-C_1-C_2$ ーアルキルおよび C_1-C_4 ーアルキルー $S(O)_2-C_1-C_2$ ーアルキル (それぞれ、ハロゲンによってモノ置換もしくは多置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい) からなる群からの基を表し；

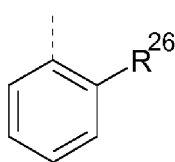
R^2 が基 c) を表す場合、 R^{2-3} が、水素、 C_1-C_6 ーアルキル、 C_2-C_4 ーアルケニル、 C_2-C_4 ーアルキニル、 C_1-C_4 ーアルキルチオー C_1-C_4 ーアルキル、 C_2-C_4 ーアルケニルチオー C_1-C_4 ーアルキル、シアノー C_1-C_4 ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルコキシー C_1-C_4 ーアルキルからなる群からの基を表し；

R^2 が基 d) を表す場合、 R^{2-3} が、水素、 C_1-C_6 ーアルキル、 C_2-C_4 ーアルケニル、 C_2-C_4 ーアルキニル、 C_3-C_6 ーシクロアルキル、 C_3-C_6 ーシクロアルケニル、 C_1-C_6 ーアルコキシ、 C_2-C_6 ーアルケニルオキシ、 C_2-C_6 ーアルキニルオキシ、 C_3-C_6 ーシクロアルキルオキシ、 C_1-C_4 ーアルキルチオー C_1-C_4 ーアルキル、 C_2-C_4 ーアルケニルチオー C_1-C_4 ーアルキル、シアノー C_1-C_4 ーアルキル、 C_1-C_4 ーアルコキシー C_1-C_4 ーアルキルからなる群からの基を表し；

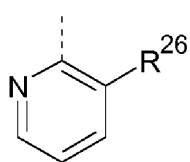
または $R^2 = d)$ の場合、

R^{2-2} が、

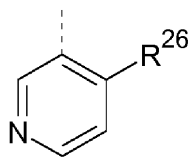
【化 60】



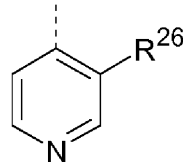
E-1



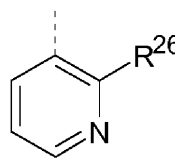
E-2



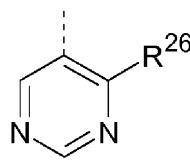
E-3



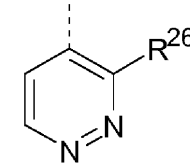
E-4



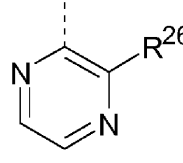
E-5



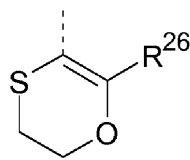
E-6



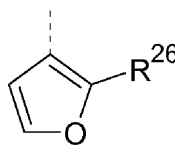
E-10



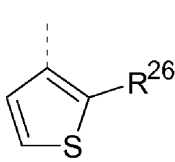
E-11



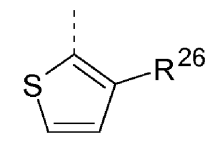
E-13



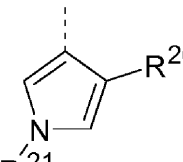
E-18



E-21



E-23



E-25

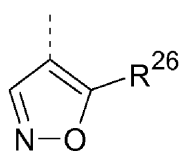
10

20

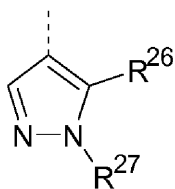
30

40

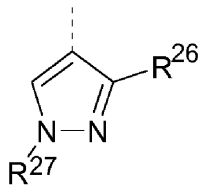
50



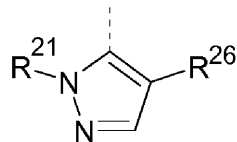
E-27



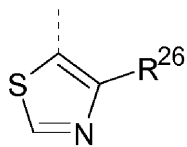
E-31



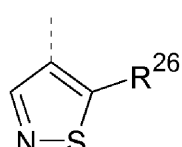
E-35



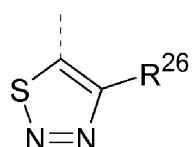
E-36



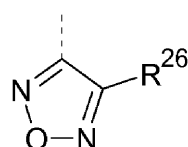
E-39



E-44



E-49



E-51

10

【0070】

からなる群からの E 基も表し；

R²⁷ が、水素または C₁ - C₄ - アルキルを表し；

R²⁶ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル - C₁ - C₂ - アルキルまたはシアノ - C₁ - C₄ - アルキルを表す、式 (I) の化合物である。

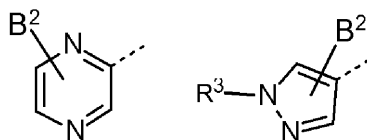
20

【0071】

好ましい範囲 (3) : 非常に特に好ましいものは、

A が、(A-b) および (A-f)

【化61】



(A-b)

(A-f)

30

【0072】

からなる群から選択される A 基を表し、

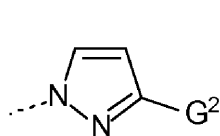
破線が二環化合物の窒素原子への結合を表し；

B² が、水素を表し；

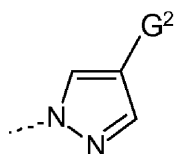
R¹ が、水素を表し；

R² が、a)

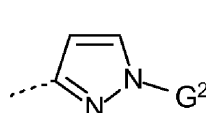
【化62】



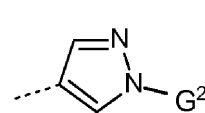
(B-1)



(B-2)

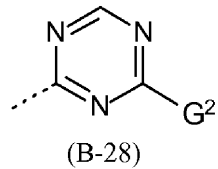
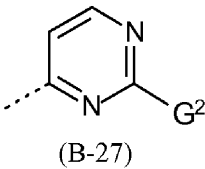
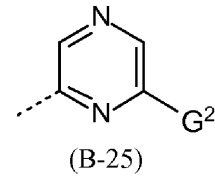
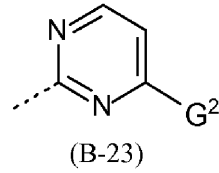
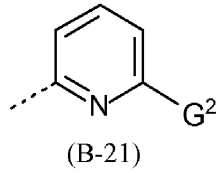
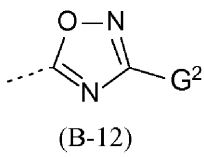
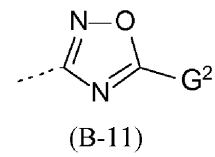
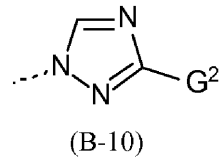
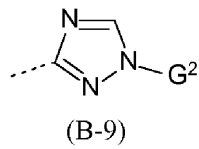
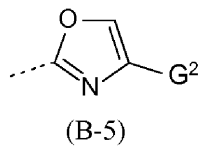


(B-3)



(B-4)

40



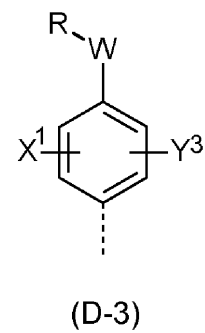
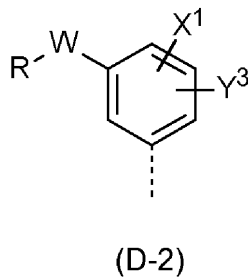
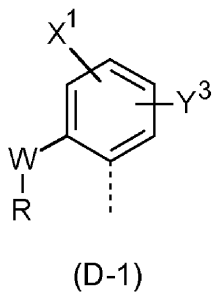
【0073】

からなる群からのB基を表し、

破線が、式（I）の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または

R²が、b）（D-1）から（D-3）；

【化63】



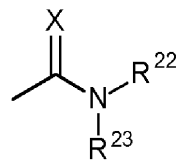
【0074】

からなる群からの基を表し、

破線が、式（I）の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または

R²が、c）下記式；

【化64】



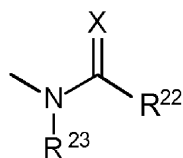
【0075】

の基を表し；

または

R²が、d）下記式；

【化65】



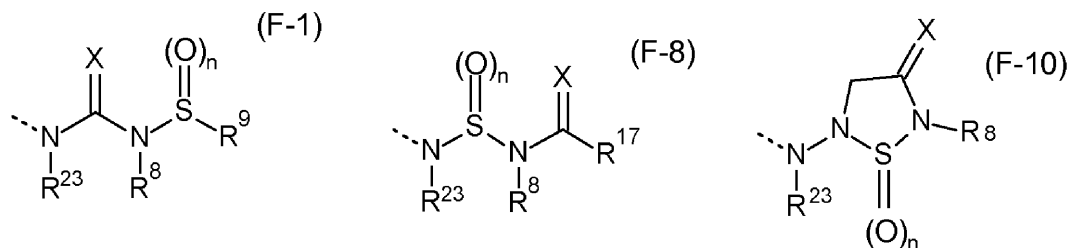
【0076】

の基を表し；

または

R^2 が、e) (F-1)、(F-8) および (F-10) :

【化 6 6】



10

【0077】

からなる群からの基を表し、

破線が式 (I) における窒素原子への結合を表し；または

R^2 が、f) C_1-C_6 -ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

G^2 が、水素またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4 -アルキル)-アミノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン化 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ビス (C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、ビス (ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- (C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- (C_1-C_4 -アルキルスルフィニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- (C_1-C_4 -アルキルスルホニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス (C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス (ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス (ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 $C(X^2)NR^3$ 、 R^4 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；

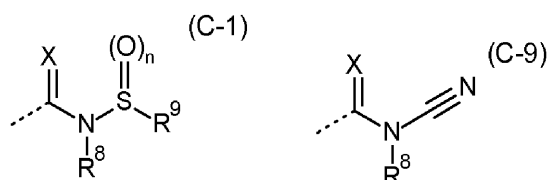
20

30

または

G^2 が、C 基 (C-1) または (C-9) :

【化 6 7】



【0078】

を表し；

破線が、B 基への結合を示しており；

X が、酸素を表し；

X^1 が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシからなる群からの基を表し；

X^2 が、酸素、硫黄、 NR^5 または NOH を表し；

n が、2 を表し；

R が、 $NR^{18}R^{19}$ を表し、または C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -アルキニル、 C_1-C_2 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1

40

50

$-C_2$ －アルキル－ $S-C_1-C_2$ －アルキル、 C_1-C_2 －アルキル－ $S(O)-C_1$ － C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルキル－ $S(O)_2-C_1-C_2$ －アルキル（それぞれ、フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）からなる群からの基を表し、または $R^{18}-CO-C_1-C_2$ －アルキルを表し、または $NR^{18}R^{19}-CO-C_1-C_2$ －アルキルを表し、または C_3-C_6 －シクロアルキル（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによって、または酸素原子（これは、 $C=O$ をもたらす）によってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 －シクロアルケニル（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによって、または酸素原子（これは、 $C=O$ をもたらす）によってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 －シクロアルキル－ C_1-C_2 －アルキル（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または C_3-C_6 －シクロアルケニル－ C_1-C_2 －アルキル（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、または複素環－ C_1-C_2 －アルキル（ C_1-C_2 －アルキル、 C_1-C_2 －アルコキシまたは C_1-C_2 －ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し、またはフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルまたはチアゾリルメチル（それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシによってモノもしくはジ置換されていてもよい）を表し；

R^3 が、 C_1-C_4 －アルキルを表し；

R^4 が、水素、 C_1-C_4 －アルキル、ハロ－ C_1-C_4 －アルキル、シアノ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_2-C_4 －アルキニル、 C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_3-C_6 －シクロアルキル－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル－ C_1-C_4 －アルキルおよび C_1-C_4 －アルキルチオ－ C_1-C_4 －アルキルからなる群からの基を表し；

R^5 が、水素、 C_1-C_4 －アルキル、ハロ－ C_1-C_4 －アルキル、シアノ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_2-C_4 －アルキニル、 C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_3-C_6 －シクロアルキル－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル－ C_1-C_4 －アルキルおよび C_1-C_4 －アルキルチオ－ C_1-C_4 －アルキルからなる群からの基を表し；

R^6 が、水素または C_1-C_4 －アルキルを表し；

R^7 が、水素、 C_1-C_4 －アルキル、ハロ－ C_1-C_4 －アルキル、シアノ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_2-C_4 －アルキニル、 C_1-C_4 －アルコキシ、ハロ－ C_1-C_4 －アルコキシ、 C_1-C_4 －アルコキシ－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル－ C_1-C_4 －アルキル、 C_1-C_4 －アルキルチオ－ C_1-C_4 －アルキル、アリール－ C_1-C_4 －アルキルおよびヘタリール－ C_1-C_4 －アルキルからなる群からの基を表し；または

R^6 および R^7 が、それらが結合している窒素原子とともに、4から7員環を形成しており、それは窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子を含んでいてもよく；

R^8 が、水素、 C_1-C_6 －アルキル、 C_1-C_6 －ハロアルキル、シアノ－ C_1-C_6 －アルキル、 C_1-C_6 －アルコキシ、 C_1-C_6 －ハロアルコキシ、 C_2-C_6 －ア

10

20

30

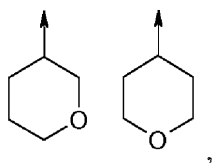
40

50

ルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-およびシアノー置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表し、またはカチオンまたは C_1-C_6 -アルキル-またはアリール- C_1-C_6 -アルキル-置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

R^9 が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル（1個もしくは2個の環員が、各場合で、硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からのヘテロ原子によって置き換わっていてもよい（ここで、特に、

【化68】

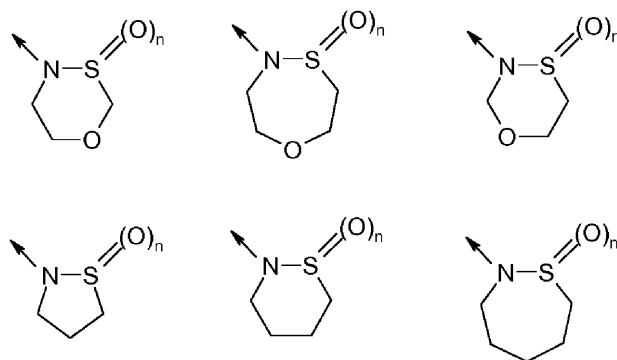


【0079】

を表し、矢印は各場合で、基（ $C-1$ ）および基（ $F-1$ ）における硫黄原子への結合を示す。））、各場合でハロゲン-、シアノー（アルキル部分においても）、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルアミノ-、ジ-（ C_1-C_4 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_2-C_4 -アルケニル-、 C_2-C_4 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ （ R' および R'' は、互いに独立に、水素および C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表す）を表し；または

基（ $C-1$ ）および基（ $F-1$ ）における R^8 および R^9 が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基とともに、飽和または不飽和のハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい5から7員の環（硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素および／または少なくとも1個および好ましくは1個のカルボニル基からなる群からの1個もしくは2個のヘテロ原子を含んでもよい）を形成していてもよく、特に、 R^8 および R^9 が、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基とともに、

【化 6 9】



10

【0080】

からなる群からの基を表すことができ（矢印は、各場合で、C（X）基への結合を示す。）；

R¹⁷が、各場合でハロゲン、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－ハロアルコキシ、C₁－C₄－アルキルチオ、C₁－C₄－ハロアルキルチオ、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₄－アルキルスルホニルおよびC₁－C₄－ハロアルキルスルホニル置換されていてもよいC₁－C₄－アルキル、C₂－C₄－アルケニルおよびC₂－C₄－アルキニル、各場合でハロゲン、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－ハロアルコキシ置換されていてもよいC₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₄－アルキルおよびC₃－C₄－シクロアルケニル、N－ピロリジニル、N－ピペリジニル、N－モルホリニル、N－チオモルホリニル、N－チオモルホリニル1－オキシド、N－チオモルホリニル1，1－ジオキシド、N－ピペラジニル、N－1－メチルピペラジニルおよびN－2－オキソ－1－メチルピペラジニル、各場合でハロゲン、シアノ（アルキル部分においても）、ニトロ、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－ハロアルコキシ、C₁－C₄－アルキルチオ、C₁－C₄－ハロアルキルチオ、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₄－アルキルスルホニル、C₁－C₄－ハロアルキルスルホニル、アミノ、C₁－C₄－アルキルアミノ、ジ（C₁－C₄－アルキル）アミノ、C₁－C₄－アルキルカルボニルアミノ、C₁－C₄－アルコキシカルボニルアミノ、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルコキシ－C₁－C₄－アルキル、C₂－C₄－アルケニル、C₂－C₄－アルキニル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルキルカルボニル、C₁－C₄－アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニル置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール－C₁－C₄－アルキル、ヘテロアリール－C₁－C₄－アルキルからなる群からの基を表し、またはNR' R''（R'およびR''は、互いに独立に、水素およびC₁－C₄－アルキルからなる群からの基を表す。）を表し；

20

30

40

R¹⁸が、水素、ヒドロキシからなる群からの基を表し、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルキル－S－C₁－C₂－アルキル、C₁－C₄－アルキル－S（O）－C₁－C₂－アルキル、C₁－C₄－アルキル－S（O）₂－C₁－C₂－アルキル、C₁－C₄－アルキルカルボニル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₃－アルキル、複素環および複素環－C₁－C₃－アルキル（それぞれ、フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）、およびフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルおよびチアゾリルメチル（それぞれ、C₁－C

50

R^{1-9} が、水素、アルカリもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、 C_1-C_4 -アルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_2 -アルキル（フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい）からなる群からの基を表し；

Y³ が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシからなる群からの基を表し；

R² が基 c) を表す場合、R^{2 3} が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

R² が基 d) を表す場合、R² が、C₁—C₄—アルキル、シアノ—置換されていて
もよい C₃—C₆—シクロアルキル、C₁—C₄—ハロアルキル、C₁—C₄—アルキル
チオ—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—アルキルスルフィニル—C₁—C₄—アルキ
ル、C₁—C₄—アルキルスルホニル—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—ハロアルキ
ルチオ—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—ハロアルキルスルフィニル—C₁—C₄—
アルキル、C₁—C₄—ハロアルキルスルホニル—C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—
アルキルチオ—C₂—C₄—アルケニル、C₁—C₄—アルキルスルフィニル—C₂—C₄—
アルケニル、C₁—C₄—アルキルスルホニル—C₂—C₄—アルケニル、C₂—C₄—
アルケニルチオ—C₁—C₄—アルキル、C₂—C₄—アルケニルスルフィニル—C

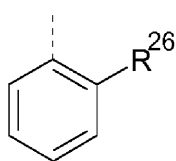
C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルスルホニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_4 -アルキル)-アミノスルホニルからなる群からの基を表し；

R^2 が基 d) を表す場合、 $R^{2,3}$ が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

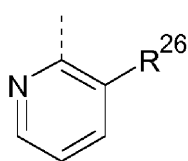
$R^2 = d)$ である場合、

$R^{2,2}$ が、ハロゲン-、シアノ-、ニトロ-、アミノ-、ヒドロキシ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ-、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルオキシ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、 C_3-C_6 -アルケニルアミノ-、 C_3-C_6 -アルキニルアミノ-、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_3-C_6 -アルケニルチオ-、 C_3-C_6 -アルキニルチオ-、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、アミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル-、ジ- (C_1-C_6 -アルキル)-アミノカルボニル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミン-置換されていてもよいフェニルも表し、下記の E 基：

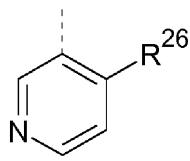
【化 70】



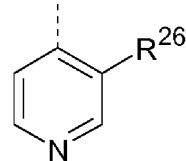
E-1



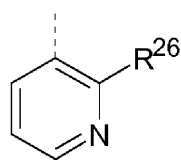
E-2



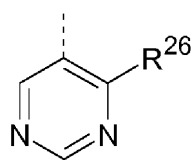
E-3



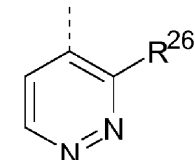
E-4



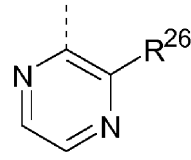
E-5



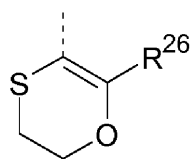
E-6



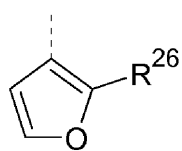
E-10



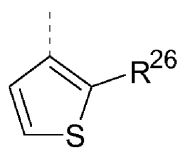
E-11



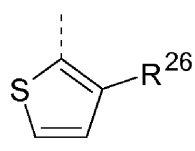
E-13



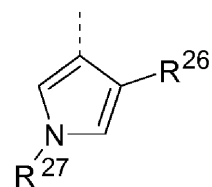
E-18



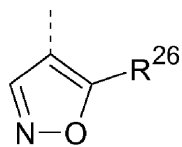
E-21



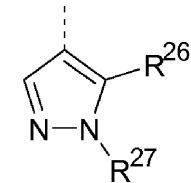
E-23



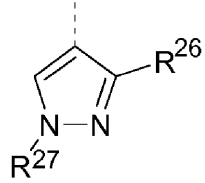
E-25



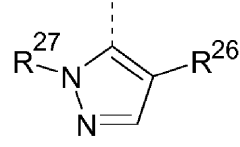
E-27



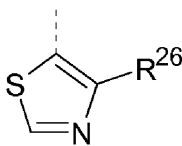
E-31



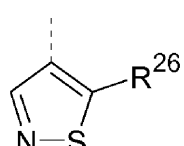
E-35



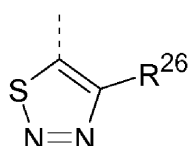
E-36



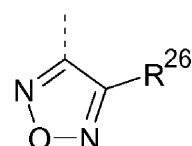
E-39



E-44



E-49



E-51

【0081】

のうちの一つを表し；

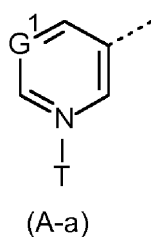
R^{27} が、水素またはメチルを表し；

R^{26} が、水素、メチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、プロペニル、プロパルギル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、メトキシメチル、メチルチオエチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルエチルまたはシアノメチルを表す式 (I) の化合物；

ならびに

A が、A 基：

【化71】



【0082】

を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

G^1 が、N または $C-B^1$ を表し；

B^1 が、水素およびフッ素からなる群からの基を表し；

T が、酸素または電子対を表し；

R^1 が、水素を表し；

R^2 が、a)

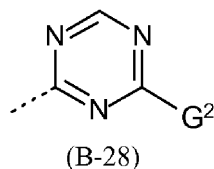
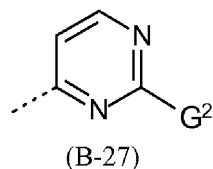
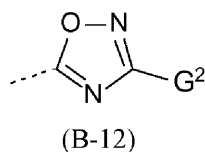
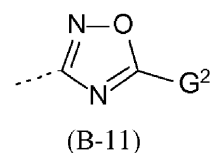
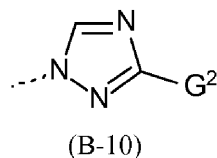
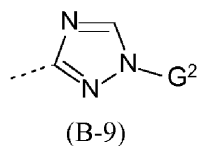
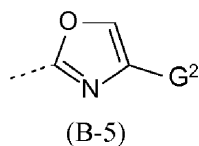
10

20

30

40

【化 7 2】



10

【0083】

からなる群からの基を表し、

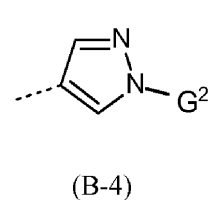
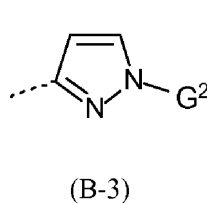
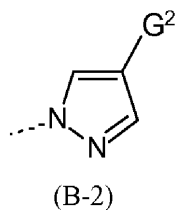
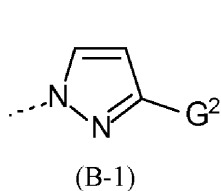
破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；

G² が、水素またはハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁－C₄－アルキルアミノ、
 、ハロ－C₁－C₄－アルキルアミノ、C₁－C₄－ジアルキルアミノ、C₁－C₄－ア
 ルキル、ハロ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ、ハロ－C₁－C₄－ア
 ルコキシ、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ハロゲン化C₁－C₄－ア
 ルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ビス (C₁－C₄－アルコキシ)－C₁－C₄－アル
 キル、ビス (ハロ－C₁－C₄－アルコキシ)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ア
 ルコキシ－ (C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－
 アルコキシ－ (C₁－C₄－アルキルスルフィニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－
 C₄－アルコキシ－ (C₁－C₄－アルキルスルホニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス
 (C₁－C₄－アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス (ハロ－C₁－C₄－
 アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、ビス (ヒドロキシ－C₁－C₄－
 アルキルスルファニル)－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシカルボニル、
 C₁－C₄－アルコキシカルボニル－C₁－C₄－アルキル、C (X²) NR³R⁴、N
 R⁶R⁷、C₁－C₄－アルキルチオ、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－
 アルキルスルホニル、C₁－C₄－ハロアルキルチオ、C₁－C₄－ハロアルキルスル
 フィニルおよびC₁－C₄－ハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；

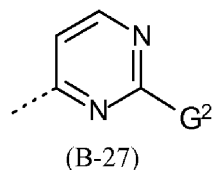
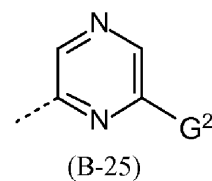
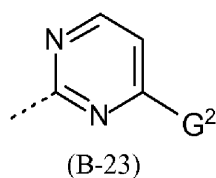
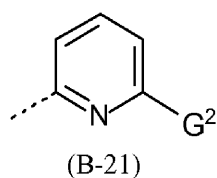
または

R² が、a a)

【化 7 3】



40



10

【0084】

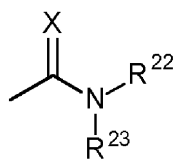
からなる群からの基を表し；

G^2 が、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -ジアルキルアミノ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン化 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ(C_1-C_4 -アルキルスルフィニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ(C_1-C_4 -アルキルスルホニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、ビス(ヒドロキシ- C_1-C_4 -アルキルスルファニル)- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル- C_1-C_4 -アルキル、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルからなる群からの基を表し；または

20

R^2 が、c) 下記式：

【化74】



30

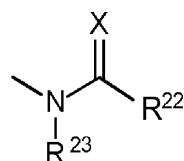
【0085】

の基を表し；

または

R^2 が、d) 下記式：

【化75】



40

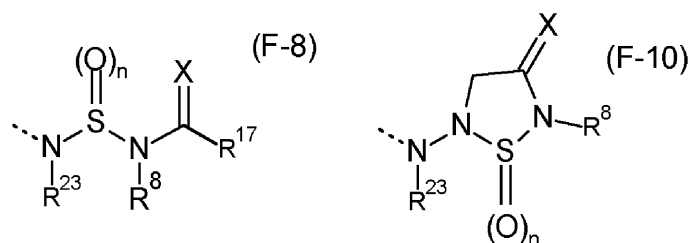
【0086】

の基を表し；

または

R^2 が、e) (F-8) および (F-10)：

【化 7 6】



【0087】

からなる群からの基を表し、

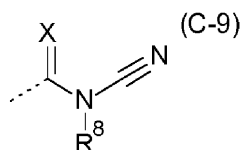
破線が、式 (I) における窒素原子への結合を表し；または

R² が、f) C₁ - C₆ - ハロアルキル、カルボキシルおよびアミノからなる群からの基を表し；

または

G² が、C 基：

【化 7 7】



【0088】

を表し、

破線が B 基への結合を表し；

X が、酸素を表し；

X² が、酸素、硫黄、NR⁵ または NOH を表し；

n が、2 を表し；

R³ が、C₁ - C₄ - アルキルを表し；

R⁴ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルおよび C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

R⁵ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルおよび C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；

R⁶ が、水素または C₁ - C₄ - アルキルを表し；

R⁷ が、水素、C₁ - C₄ - アルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルキル、シアノ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、アリール - C₁ - C₄ - アルキルおよびヘタリール - C₁ - C₄ - アルキルからなる群からの基を表し；または

R⁶ および R⁷ が、それらが結合している窒素原子とともに、4 から 7 員環を形成しており、それは窒素、酸素および硫黄（ここで、酸素原子と硫黄原子は、互いに直接隣接してはならない）からなる群からの 1 個もしくは 2 個のさらなるヘテロ原子を含んでいても

10

20

30

40

50

よく；

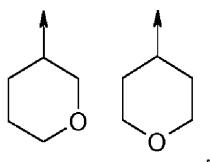
R^8 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、各場合でハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-およびシアノ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルからなる群からの基を表し、またはカチオンまたは C_1-C_6 -アルキル-またはアリール- C_1-C_6 -アルキル-置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し；

10

R^9 が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル（1個もしくは2個の環員が、各場合で、硫黄、酸素（酸素原子同士は互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群からのヘテロ原子によって置き換わっていてもよい（ここで、特には、

20

【化78】



【0089】

を表し、矢印は各場合で基（C-1）における硫黄原子への結合を示す。）各場合でハロゲン-、シアノ-（アルキル部分においても）、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_4 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_2-C_4 -アルケニル-、 C_2-C_4 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し、または $NR'R''$ （ R' および R'' は、互いに独立に、水素および C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表す。）を表し；

30

40

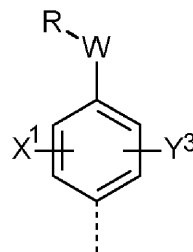
R^{17} が、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアル

50

10

20

【 0 0 9 0 】



(D-3)

30

破線が、基 c) における窒素原子または基 d) における炭素原子への結合を表し；

40

50

)を表し、または複素環 (C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシまたは C_1-C_2 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい)を表し、または複素環- C_1-C_2 -アルキル (C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシまたは C_1-C_2 -ハロアルキルによってモノもしくはジ置換されていてもよい)を表し、またはフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルまたはチアゾリルメチル (それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシによってモノもしくはジ置換されていてもよい)を表し；

X^1 が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシからなる群からの基を表し；

Wが、S、SOおよび SO_2 からなる群からの基を表し；

Y^3 が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシからなる群からの基を表し；

R^{1-8} が、水素、ヒドロキシからなる群からの基を表し、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、複素環および複素環- C_1-C_3 -アルキル (それぞれ、フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい)、およびフェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、フラニル、ピリジニルメチルおよびチアゾリルメチル (それぞれ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、 C_1-C_3 -ハロアルコキシ、シクロプロピル、フッ素、塩素、臭素またはシアノによってモノないしトリ置換されていてもよい)を表し；

R^{1-9} が、水素、アルカリもしくはアルカリ土類金属イオンを表し、 C_1-C_4 -アルキルでモノないしテトラ置換されていてもよいアンモニウムイオンを表し、または C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキル-S(O)- C_1-C_2 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルキル-S(O)₂- C_1-C_2 -アルキル (それぞれ、フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよく、またはシアノによってモノもしくはジ置換されていてもよい)からなる群からの基を表し；または

R^2 が基c)を表す場合、 R^{2-3} が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

R^2 が基d)を表す場合、 R^{2-3} が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルケニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルチオ- C_1-C_4 -アルキル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基を表し；

$R^2 = d)$ の場合、

R^{2-2} が、下記のE基：

10

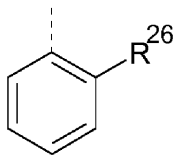
20

30

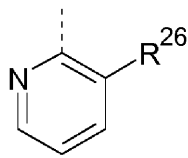
40

50

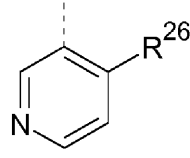
【化 8 0】



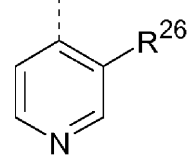
E-1



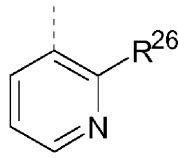
E-2



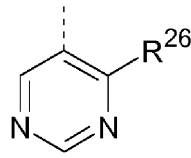
E-3



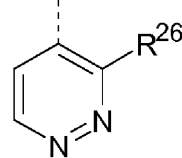
E-4



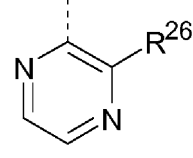
E-5



E-6

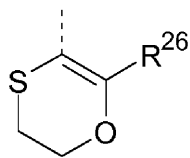


E-10



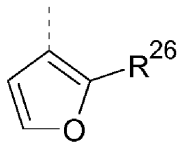
E-11

10

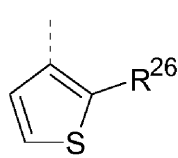


E-13

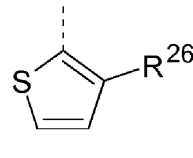
20



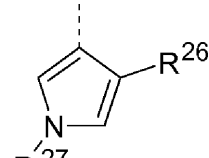
E-18



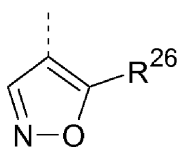
E-21



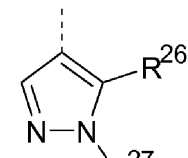
E-23



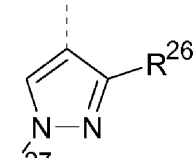
E-25



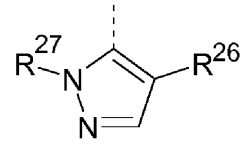
E-27



E-31

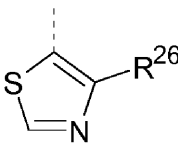


E-35

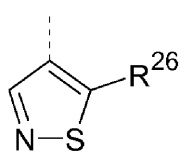


E-36

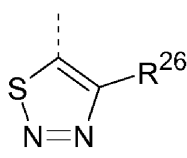
30



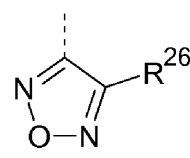
E-39



E-44



E-49



E-51

【0091】

40

のうちの一つも表し；

R^{27} が、水素またはメチルを表し；

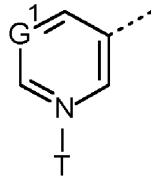
R^{26} が、水素、メチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、プロピニル、プロパルギル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、メトキシメチル、メチルチオエチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルエチルまたはシアノメチルを表す式 (I) の化合物である。

【0092】

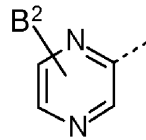
好ましい範囲 (4)：式 (I) の化合物の特定の群は、

A が、(A-a)、(A-b) および (A-f)：

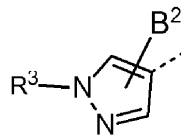
【化 8 1】



(A-a)



(A-b)



(A-f)

10

【0093】

からなる群からの基を表し、

破線が、二環化合物の窒素原子への結合を表し；

G^1 が、N または $C-B^1$ を表し；

B^1 が、水素およびフッ素からなる群からの基を表し；

B^2 が、水素を表し；

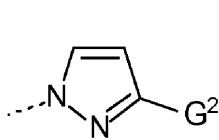
T が、電子対を表し；

R^1 が、水素を表し；

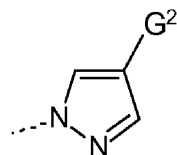
R^2 が、a) 下記の基：

20

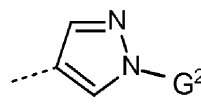
【化 8 2】



(B-1)

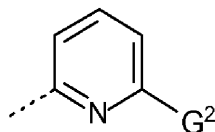


(B-2)

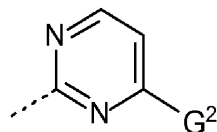


(B-4)

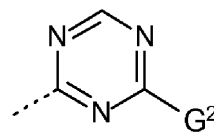
30



(B-21)



(B-23)



(B-28)

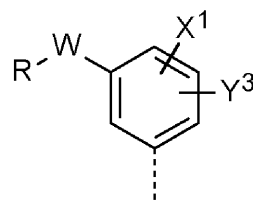
【0094】

のうちの一つを表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の炭素原子への結合を表し；または

R^2 が、b) 基 (D-2)：

【化 8 3】



(D-2)

40

【0095】

を表し、

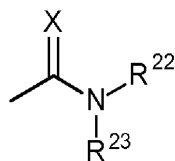
50

破線が、式（I）の二環化合物の炭素原子への結合を表し；

または

R²が、c）下記式の基：

【化84】



【0096】

10

を表し；

または

R²が、f）C₁－C₆－ハロアルキルを表し；

G²が、水素、C₁－C₄－アルキルおよびハロ－C₁－C₄－アルキルからなる群からの基を表し；

Xが、酸素を表し；

X¹が、水素、フッ素、塩素および臭素からなる群からの基を表し；

Rが、フッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよいC₁－C₄－アルキルを表し；

R³が、C₁－C₄－アルキルを表し；

20

Wが、S、SOおよびSO₂からなる群からの基を表し；

Y³が、メチルまたはエチルを表し；

R²²が、C₁－C₆－アルキル、シアノ－置換されていてもよいC₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－ハロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₄－アルキルスルホニルおよびジ（C₁－C₄－アルキルアミノ）スルホニルからなる群からの基を表し；

R²³が、水素またはC₁－C₆－アルキルを表す、化合物の群である。

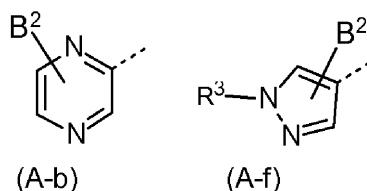
【0097】

好ましい範囲（5）：式（I）の化合物のさらなる特定の群は、

Aが、（A-b）および（A-f）：

30

【化85】



【0098】

からなる群から選択されるA基を表し、

破線が、式（I）の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

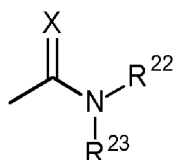
40

B²が、水素を表し；

R¹が、水素を表し；

R²が、c）下記式：

【化86】



【0099】

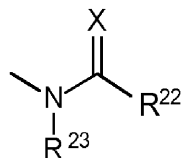
50

の基を表し；

または

R^2 が、d) 下記式：

【化 8 7】



【0100】

10

の基を表し；

X が、酸素を表し；

R^3 が、 C_1-C_4 -アルキルを表し；

R^2 が基 c) を表す場合、 R^{22} が、 C_1-C_6 -アルキル、シアノ-置換されていて
もよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキ
シ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキ
ル、ジ- (C_1-C_4 -アルキル) アミノスルホニルからなる群からの基を表し；

R^2 が基 c) を表す場合、 R^{23} が、水素および C_1-C_6 -アルキルからなる群から
の基を表し；

R^2 が基 d) を表す場合、 R^{22} が、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルキ
ルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル- C_1-C_4 -アル
キルおよび C_1-C_4 -アルキルスルホニル- C_1-C_4 -アルキルからなる群からの基
を表し；

20

R^2 が基 d) を表す場合、 R^{23} が、水素および C_1-C_6 -アルキルからなる群から
の基を表し；

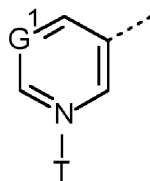
$R^2 = d)$ である場合、

R^{22} が、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-および C_1-C_6 -ハロアルキルスル
フィニル-置換されていてもよいフェニルも表してもよい化合物、および

A が、下記の A 基：

【化 8 8】

30



(A-a)

【0101】

を表し、

破線が、式 (I) の二環化合物の窒素原子への結合を表し；

40

G^1 が、N または $C-B^1$ を表し；

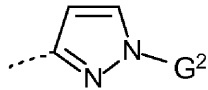
B^1 が、水素およびフッ素からなる群からの基を表し；

T が、電子対を表し；

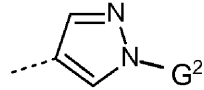
R^1 が、水素を表し；

R^2 が、a a)

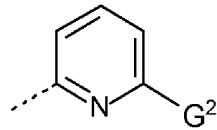
【化 8 9】



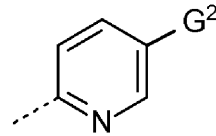
(B-3)



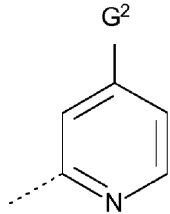
(B-4)



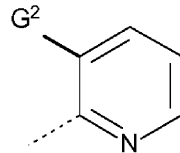
(B-21)



(B-22)



(B-35)



(B-36)

10

20

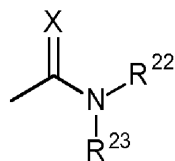
【0102】

からなる群からの基を表し；

G² が、ハロゲン、C₁－C₄－アルキルチオ、C₁－C₄－アルキルスルフィニル、C₁－C₄－アルキルスルホニル、C₁－C₄－ハロアルキルチオ、C₁－C₄－ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₄－ハロアルキルスルホニル、C₁－C₄－アルキルチオ－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルキルスルフィニル－C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルキルスルホニル－C₁－C₄－アルキルからなる群からの基を表し；または

R² が、c) 下記式：

【化 9 0】



30

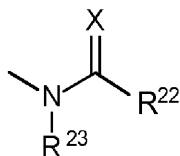
【0103】

の基を表し；

または

R² が、d) 下記式：

【化 9 1】



40

【0104】

の基を表し；

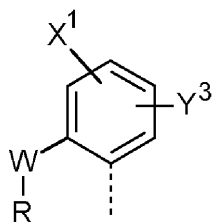
または

R² が、f) ハロアルキルを表し；

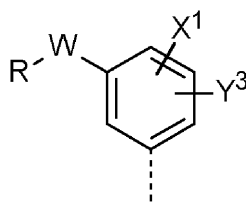
X が、酸素を表し；

50

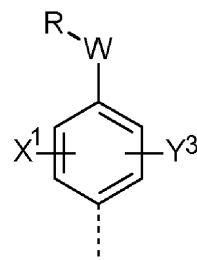
R^{22} が、(D-1)から(D-3)：
【化92】



(D-1)



(D-2)



(D-3)

10

【0105】

からなる群からの基を表し、

破線が、基c)における窒素原子または基d)における炭素原子への結合を表し；

Rが、各場合でフッ素、塩素によってモノ、ジ、トリ、テトラもしくはペンタ置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルを表し；

X^1 が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチルおよびエチルからなる群からの基を表し；

Wが、S、SOおよび SO_2 からなる群からの基を表し；

Y^3 が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチルおよびエチルからなる群からの基を表す、式(I)の化合物の群である。

20

【0106】

上記定義において、例えば、「該環は、硫黄、酸素（酸素原子と硫黄原子が、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群から選択される少なくとも1個のヘテロ原子を含んでもよい」または「1個もしくは2個の環員が、各場合で、硫黄、酸素（酸素原子同士が、互いに直接隣接してはならない）および窒素からなる群から選択されるヘテロ原子で置き換えられていてもよい」などの表現で、硫黄および／または窒素が環中に存在している場合、別段の断りがない限り、その硫黄は、SOまたは SO_2 の形態で存在していてもよく； $-N=$ の形態ではない場合の窒素ならびにNHは、N-アルキル（特別には、 $N-C_1-C_6$ -アルキル）の形態で存在することもできる。

【0107】

30

定義の組合せが好ましい範囲(1)を形成している好ましい定義においては、別段の断りがない限り、

カチオンは、リチウム、ナトリウム、カリウム、ルビジウム、セシウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、好ましくは、リチウム、ナトリウム、カリウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、または、

ベリリウム、マグネシウム、カルシウム、ストロンチウム、バリウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオン、好ましくは、マグネシウムおよびカルシウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオンを表し；

ハロゲンとは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素および臭素からなる群から選択され；

40

アリール（これは、より大きな単位（例えば、アリールアルキル）の一部分としてのアリールを包含する）は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルを表し；

ヘタリール（「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位（例えば、ヘタリールアルキル）の一部分としてのヘタリールを包含する）は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリ

50

ダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニルおよびインドリジニルからなる群から選択され；

複素環は、1個もしくは2個の窒素原子および／または1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含んでいる4員、5員または6員の飽和環、例えば、アゼチジニル、アゾリジニル、アジナニル、オキセタニル、オキソラニル、オキサニル、ジオキサニル、チエタニル、チオラニル、チアニル、テトラヒドロフリル、ピペラジニル、モルホリニルなどを表す。

10

【0108】

定義の組合せが好ましい範囲(2)を形成している特に好ましい定義においては、別段の断りがない限り、

カチオンは、リチウム、ナトリウム、カリウム、ルビジウム、セシウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、好ましくは、リチウム、ナトリウム、カリウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、または、

ベリリウム、マグネシウム、カルシウム、ストロンチウム、バリウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオン、好ましくは、マグネシウムおよびカルシウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオンを表し；

20

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素および臭素からなる群から選択され；

アリール(これは、より大きな単位(例えば、アリールアルキル)の一部分としてのアリールを包含する)は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルを表し；

ヘタリール(「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位(例えば、ヘタリールアルキル)の一部分としてのヘタリールを包含する)は、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニルからなる群から選択され；

30

複素環は、アゼチジニル、アゾリジニル、アジナニル、オキセタニル、オキソラニル、オキサニル、ジオキサニル、チエタニル、チオラニル、チアニル、テトラヒドロフリル、ピペラジニル、モルホリニルからなる群から選択される。

【0109】

定義の組合せが好ましい範囲(3)を形成している極めて特に好ましい定義およびとりわけ好ましい定義においては、別段の断りがない限り、

カチオンは、リチウム、ナトリウム、カリウム、ルビジウム、セシウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、好ましくは、リチウム、ナトリウム、カリウムからなる群から選択されるアルカリ金属イオン、または、

40

ベリリウム、マグネシウム、カルシウム、ストロンチウム、バリウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオン、好ましくは、マグネシウムおよびカルシウムからなる群から選択されるアルカリ土類金属イオンを表し；

複素環は、オキセタニル、チエタニル、テトラヒドロフリルおよびモルホリニルを表し；

アリールは、フェニルを表し；

ヘタリール(「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位(例えば、ヘタリールアルキル)の一部分としてのヘタリールを包含する)は、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、チアゾリルおよびピラゾリルからなる群からの基を表す。

50

【0110】

好ましい範囲（４）を形成する定義においては、

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素および臭素を表す。

【0111】

ハロゲンで置換されている基（例えば、ハロアルキル）は、１ハロゲン化されているか、または、可能な置換基の最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であってもまたは異なってもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表し、特に、フッ素、塩素または臭素を表す。

10

【0112】

飽和または不飽和の炭化水素基（例えば、アルキルまたはアルケニル）は、それぞれ、可能である場合は、直鎖または分枝鎖であることができ、このことは、例えばアルコキシにおける場合のように、ヘテロ原子と組み合わされている場合も包含する。

【0113】

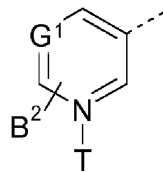
別段の断りがない限り、置換されていてもよい基は、モノ置換または多置換されることができ、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であってもまたは異なってもよい。

【0114】

式（A-a）

20

【化93】



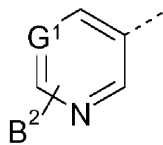
(A-a)

【0115】

の基AにおけるTが電子対を表す場合、該基は、下記式

30

【化94】



【0116】

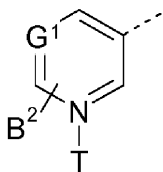
のピリジン誘導体として存在している。

【0117】

式（A-a）

40

【化95】



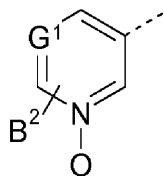
(A-a)

【0118】

の基AにおけるTが酸素を表す場合、該基は、下記式

50

【化 9 6】



【0119】

のピリジンN-オキシド誘導体として存在している。

【0120】

ここで、形式電荷（窒素における「+」および酸素における「-」）は、説明から省略されている。

10

【0121】

概括的に与えられているかまたは好ましい範囲内において記載されている基の定義または説明は、対応するように、最終生成物に当てはまり、ならびに、出発物質および中間体に当てはまる。基についてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0122】

本発明によれば、好ましいのは、好ましいものとして上記で記載されている意味の組合せを含んでいる、式（I）の化合物（好ましい範囲（1））である。

【0123】

20

本発明によれば、特に好ましいのは、特に好ましいものとして上記で記載されている意味の組合せを含んでいる、式（I）の化合物（好ましい範囲（2））である。

【0124】

本発明によれば、極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいものとして上記で記載されている意味の組合せを含んでいる、式（I）の化合物（好ましい範囲（3））である。

【0125】

本発明によれば、とりわけ好ましいのは、特別なものとして上記で記載されている意味の組合せを含んでいる、式（I）の化合物（好ましい範囲（4））である。

【0126】

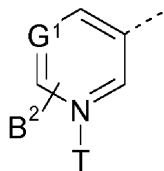
30

本発明によれば、とりわけ好ましいのは、特別なものとして上記で記載されている意味の組合せを含んでいる、式（I）の化合物（好ましい範囲（5））である。

【0127】

本発明の好ましい実施形態は、Aが式（A-a）

【化 9 7】



(A-a)

40

【0128】

の基を表す式（I）の化合物に関する。

【0129】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、Aがピリジン-3-イルを表す式（I）の化合物に関する。

【0130】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、Aが5-フルオロピリジン-3-イルを表す式（I）の化合物に関する。

50

【0131】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、Aがピリミジン-5-イルを表す式(I)の化合物に関する。

【0132】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、Aがピリダジン-4-イルを表す式(I)の化合物に関する。

【0133】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がa)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

【0134】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がb)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

【0135】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がc)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

【0136】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がd)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

【0137】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がe)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

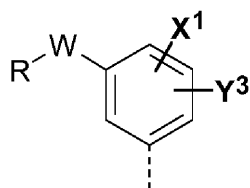
【0138】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 がf)において与えられている意味を有する式(I)の化合物に関する。

【0139】

本発明のさらなる好ましい実施形態は、 R^2 が基(D-2)：

【化98】



(D-2)

【0140】

を表す式(I)の化合物に関する。

【0141】

概括的にまたは好ましい範囲内において上記で与えられている基の定義または説明は、対応するように、最終生成物（これは、以下において示されている式(I-A)から式(I-N)の化合物を包含する）に当てはまり、ならびに、出発物質および中間体に当てはまる。基についてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0142】

好ましい実施形態において、本発明は、式(I-A)

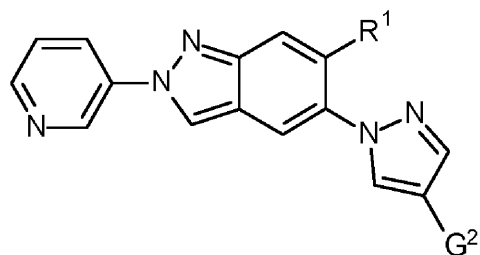
10

20

30

40

【化 9 9】



【0143】

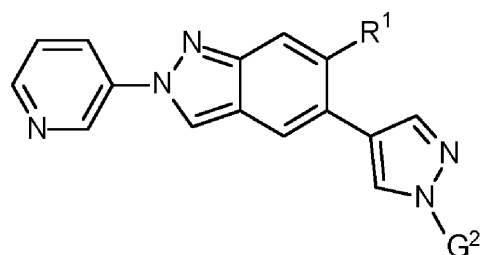
の化合物に関する。

10

【0144】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-B）

【化100】



20

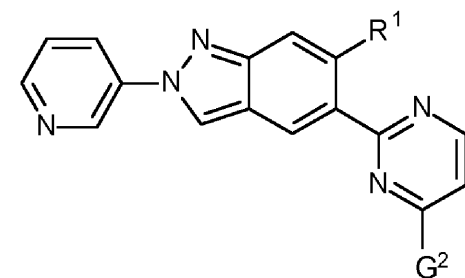
【0145】

の化合物に関する。

【0146】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-C）

【化101】



30

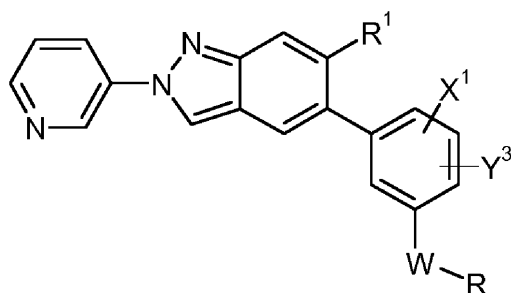
【0147】

の化合物に関する。

【0148】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-D）

【化102】



40

【0149】

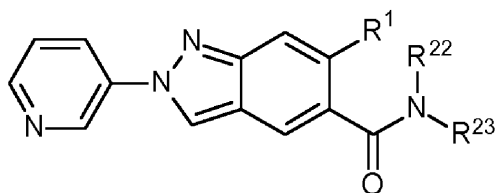
の化合物に関する。

【0150】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-E）

50

【化 1 0 3】



【0 1 5 1】

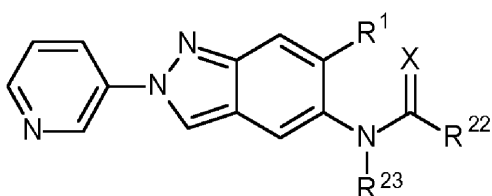
の化合物に関する。

【0 1 5 2】

10

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - F）

【化 1 0 4】



【0 1 5 3】

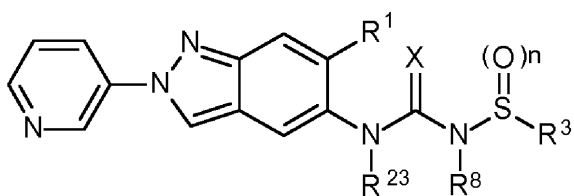
の化合物に関する。

20

【0 1 5 4】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - G）

【化 1 0 5】



【0 1 5 5】

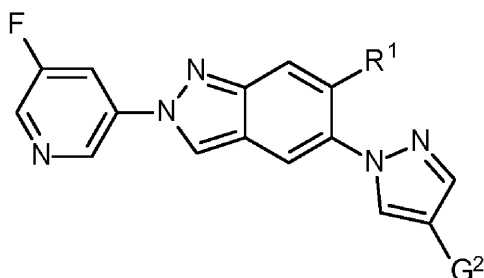
の化合物に関する。

30

【0 1 5 6】

好ましい実施形態において、本発明は、式（I - H）

【化 1 0 6】



40

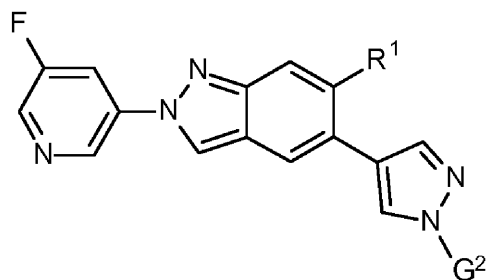
【0 1 5 7】

の化合物に関する。

【0 1 5 8】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - I）

【化 1 0 7】



【0 1 5 9】

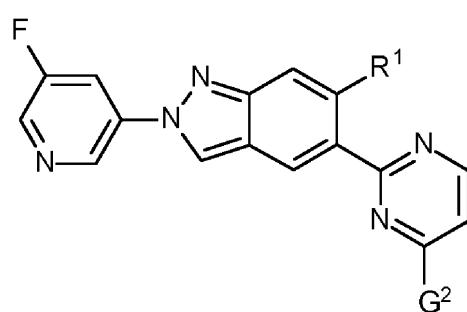
の化合物に関する。

10

【0 1 6 0】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - J）

【化 1 0 8】



20

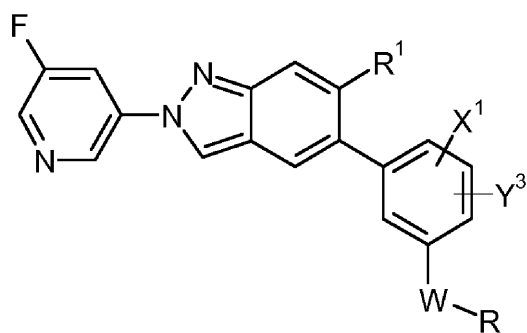
【0 1 6 1】

の化合物に関する。

【0 1 6 2】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - K）

【化 1 0 9】



30

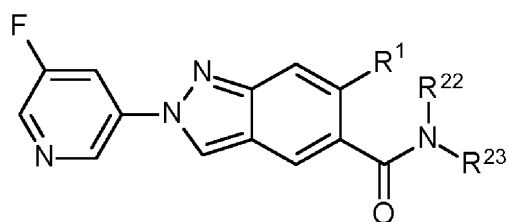
【0 1 6 3】

の化合物に関する。

【0 1 6 4】

さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I - L）

【化 1 1 0】



40

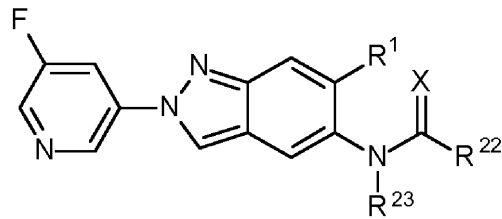
【0 1 6 5】

の化合物に関する。

【0 1 6 6】

50

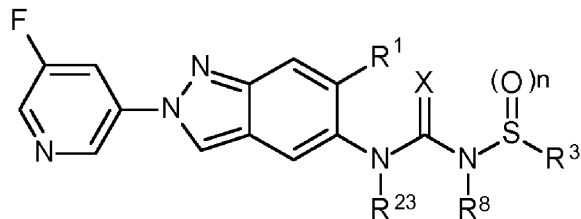
さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-M）
【化111】



【0167】
の化合物に関する。

10

【0168】
さらなる好ましい実施形態において、本発明は、式（I-N）
【化112】



【0169】
の化合物に関する。

20

【0170】
式（I-A）から式（I-N）において、可変部分は、さらに上記で与えられている意味を有する。

【0171】
本発明による式（I）の化合物ならびにそれらの酸付加塩および金属塩錯体は、高い活性を有しており、特に、害虫（これは、節足動物を包含し、特に、昆虫類を包含する）の防除において、高い活性を有している。

【0172】
式（I）の化合物は、場合により、その置換基の種類に応じて、立体異性体の形態でも、即ち、幾何異性体および／もしくは光学異性体の形態または種々の組成の異性体混合物の形態でも、存在し得る。本発明は、たとえ本明細書中で論じられているのが概して式（I）の化合物のみであったとしても、純粋な立体異性体とそれらの異性体の任意の望ましい混合物の両方を提供する。

30

【0173】
従って、本発明は、害虫（これは、節足動物を包含し、特に、昆虫類を包含する）を防除するための純粋なエナンチオマーおよびジアステレオマーならびにそれらの混合物の両方に関する。

【0174】
しかしながら、本発明によれば、式（I）の化合物の光学的に活性な立体異性体形態およびそれらの塩を使用するのが好ましい。

40

【0175】
挙げることができる式（I）の化合物の適切な塩には、慣習的な無毒性の塩、即ち、適切な塩基との塩および付加酸との塩がある。好ましいのは、無機塩基との塩、例えば、アルカリ金属塩、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩またはセシウム塩、アルカリ土類金属塩、例えば、カルシウム塩またはマグネシウム塩、アンモニウム塩、有機塩基との塩および無機アミンとの塩、例えば、トリエチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩、N, N'-ジベンジルエチレンジアンモニウム塩、ピリジニウム塩、ピコリニウム塩またはエタノールアンモニウム塩、無機酸との塩、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ジヒドロ硫酸塩（d i h y d r o s u l p h a t e）、トリヒドロ硫酸塩（t r i h y d r

50

o sulphate) またはリン酸塩、有機カルボン酸もしくは有機スルホン酸との塩、例えば、ギ酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩またはパラートルエンスルホン酸塩、塩基性アミノ酸との塩、例えば、アルギン酸塩、アスパラギン酸塩またはグルタミン酸塩などである。

【0176】

さらに、式 (I) の化合物および式 (I) に含まれない表 1 中の化合物は、以下に記載されている製造方法によって製造することが可能であることが分かった。

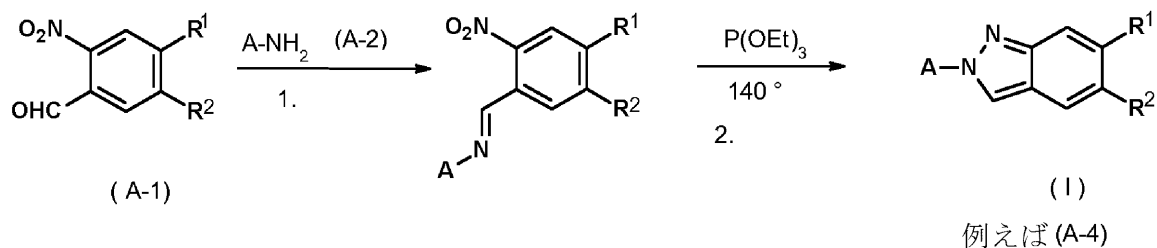
【0177】

式 (I) [式中、ヘテロ環 A は、B² で置換されていてもよいピリミジン-5-イル (A-a; G¹=N)、ピリジン-3-イル (A-a; G¹=C-B¹)、ピラジン-2-イル (A-b)、ピリダジン-3-イル (A-c)、チアゾール-5-イル (A-d)、イソチアゾール-4-イル (A-e) およびピラゾール-4-イル (A-f) を表す] の化合物は、例えば、反応図式 I に従って 2 段階で製造することができる。

【0178】

反応図式 I

【化113】



【0179】

反応図式 I において、A、R¹ および R² は、別段の断りがない限り、上記で記載されている意味を有する。

【0180】

例えば、第 1 反応段階において、式 (A-1) の置換された 2-ニトロベンズアルデヒドを、酸性反応助剤の存在下で、式 (A-2) の対応する 3-アミノ置換ヘテロ環と反応させて、式 (A-3) の化合物を生成させることができる。これらを、次いで、第 2 反応段階において、適切なリン (III) 試薬 (例えば、亜リン酸トリエチル) の存在下で、還元的環化に付して、化合物 (A-4) を形成させる。

【0181】

式 (I) の化合物を製造するための本発明による製造方法において、使用する式 (A-1) の化合物が 2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド (R¹=H、R²=CF₃) であり、使用する式 (A-2) の化合物が 3-ピリジンアミン (A=ピリジン-3-イル) である場合、最初に、N-[(2-ニトロ-5-トリフルオロメチルフェニル)メチレン]-3-ピリジンアミン (A=ピリジン-3-イル、R¹=H、R²=CF³) が生成する。次いで、その後の還元および環化によって、5-トリフルオロメチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール (A-4、A=ピリジン-3-イル、R¹=H、R²=CF³) が生成される。これは、式 (I) の化合物のための出発物質として使用することができる (製造例 6 および 16 参照)。

【0182】

アミノ置換ヘテロ環のアゾメチン誘導体または所謂「シフ塩基」は、さまざまな用途があり (それらは、例えば、金属錯体を形成するか、または、生物学的に活性を示す)、そして、慣習的な製造方法によって得ることができる ("V. Shama, et al., Intern. J. Univ. Pharm. Bio Science 2013, 2, 241-57" およびそこで引用の参考文献も参照)。

【0183】

式 (A-1) の化合物の一部は公知であって、市販されており、および/または、それ

らは、基本的に公知の製造方法によって製造することができる ($R^1 = H$ 、 $R^2 = Br$ の場合、5-ブロモ-2-ニトロベンズアルデヒド (WO 2014/121416 A1) ; $R^1 = OCH_3$ 、 $R^2 = Br$ の場合、5-ブロモ-4-メトキシ-2-ニトロベンズアルデヒド (WO 2008/079988 A2) ; $R^1 = H$ 、 $R^2 = COOCH_3$ の場合、3-ホルミル-4-ニトロ安息香酸メチル (WO 2007/087129 A2) ; $R^1 = OCH_3$ 、 $R^2 = NH_2$ の場合 ; 5-アミノ-4-メトキシ-2-ニトロベンズアルデヒド (X. Han et al., Chem. Eur. J. 2007, 13 (28), 7957-7964))。

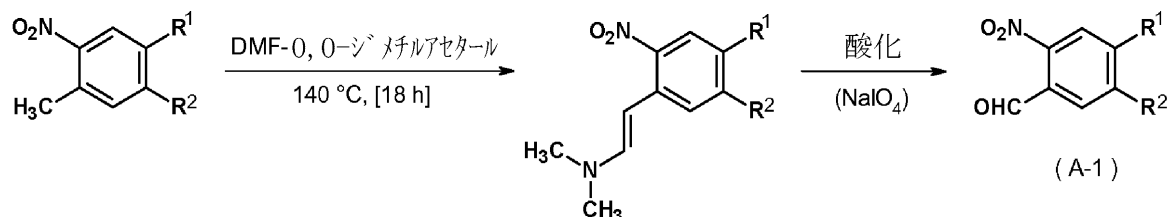
【0184】

例えば、2-ニトロ-5-トリフルオロメチルベンズアルデヒド ($R^1 = H$ 、 $R^2 = CF_3$) は、反応図式 I I に従って、2-メチル-1-ニトロ-4-トリフルオロメチルベンゼンから、N、N-ジメチルホルムアミド O、O-ジメチルアセタールとの反応およびそれに続く過ヨウ素酸ナトリウム酸化を介して合成することができる (製造例参照)。

【0185】

反応図式 I I

【化114】



【0186】

式 (A-2) の化合物の一部は公知であり、そして市販されており、および/または、それらは、原則として知られている製造方法によって製造することができる：例えば、A = 5-フルオロピリジン-3-イル (A-a ; $B^2 = H$ 、 $G^1 = C-F$; T = 電子対) (WO 2011/123751 A2) ; ピラジン-2-イル (A-b ; $B^2 = H$) (WO 2012/151567 A1) ; ピリダジン-4-イル (A-c ; $B^2 = H$) (WO 2011/038572 A1) ; チアゾール-5-イル (A-d ; $B^2 = H$) (JP 46006049 B4) ; イソチアゾール-4-イル (A-e ; $B^2 = H$) (US 2839529)、または、1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル (A-f ; $B^2 = H$ 、 $R^3 = CH_3$) 参照。

【0187】

式 (A-3) の化合物は、記載されている製造方法の段階1によって得ることができるか、または、基本的に公知の合成方法によって得ることができ、例えば、A = ピリジン-3-イル (A-a ; $B^2 = H$ 、 $G^1 = CH$; T = 電子対 ; R^1 、 $R^2 = H$) の場合、(S. Ostrowski, A. M. Wolniewicz, Chem. Het. Compd. (New York) (Transl. Khim. Geterotsikl. Soedin.) 2000, 36 (6), 705-713) を参照、または A = ピリミジン-2-イル (A-b ; B^2 、 R^1 、 $R^2 = H$) の場合、(A. L. El-Ansary et al., Egypt. J. Chem. 1991, 33 (2), 129-145) 参照。

【0188】

最後に、式 (I) の化合物は、記載されている製造方法の段階2によって、一般式 (A-3) のオルト-イミノニトロベンゼン類の還元的環化によって、例えば、亜リン酸トリエチルの存在下における Candogan インダゾール合成によって得ることができる (J. I. G. Candogan et al., J. Chem. Soc. 1965, 4831 参照)。

【0189】

あるいは、改変された Candogan らの還元的環化反応条件を利用することも可能

10

20

30

40

50

であるか、別途反応条件、例えば、イミノニトロ芳香族化合物の遷移金属触媒還元的環化および2-アジドイミン類の熱遷移金属触媒環化などを使用することも可能である（N.

E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117およびそこで引用の文献参照）。

【0190】

さらに、例えば、オルト-ニトロベンジルアミンの還元的環化（F. Sun et al. Tetrahedron 2012, 68k 3851）、分子内アミノ化反応（J. J. Song, N. K. Yee, Org. Lett. 2000, 2, 519）またはアシル化アゾベンゼン環化（H. Li, et al., Chem. Commun. 2013, 49, 9170）などの多くの他の方法も知られるようになった。しかしながら、これらの方法は、幅、遷移金属触媒および中間体（高エネルギーのものがある）の使用に関して高温ではあまり役に立たない。

10

【0191】

リン（III）試薬の存在下で、最初に、基質（A-3）のニトロ基を還元してニトロ基を形成させ、それが次にニトレンまたはニトレン様中間体を形成し、それが次に分子内環化を引き起こす（N. E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117）。さらなる研究によって、亜リン酸トリエチルの他に、代替的なリン（III）試薬として、トリシクロヘキシルホスフィン、トリ-（*n*-ブチル）ホスフィンまたはトリ-（*tert*-ブチル）ホスフィンを使用することも可能であることが確認された（M. A. Armour et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2 1975, 1185-1189; N. E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117）。

20

【0192】

A、 R^1 が上記でさらに言及された意味を有し、 R^2 が（B-1）から（B-34）からなる群からの基を表す式（I）の化合物は、例えば、 R^2 が好ましくは臭素およびヨウ素からなる群から選択されるハロゲンを表す式（I）の化合物から、公知の方法によって製造することができる（方法A：J. C. Antilla et al., J. Org. Chem., 2004, 69, 5578-5587参照、および方法B：H. Dong et al., Org. Lett., 2011, 13, 2726-2729; Ch. O. Ndubaku et al., J. Med. Chem., 2013, 56, 4597-4610; T. Furuya et al., J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807参照）。

30

【0193】

R^2 が臭素およびヨウ素からなる群から選択されるハロゲンを表す式（I）の化合物は、反応図式Iに従って、相応にハロゲン化された2-ニトロベンズアルデヒド（A-1）から得ることができる。

【0194】

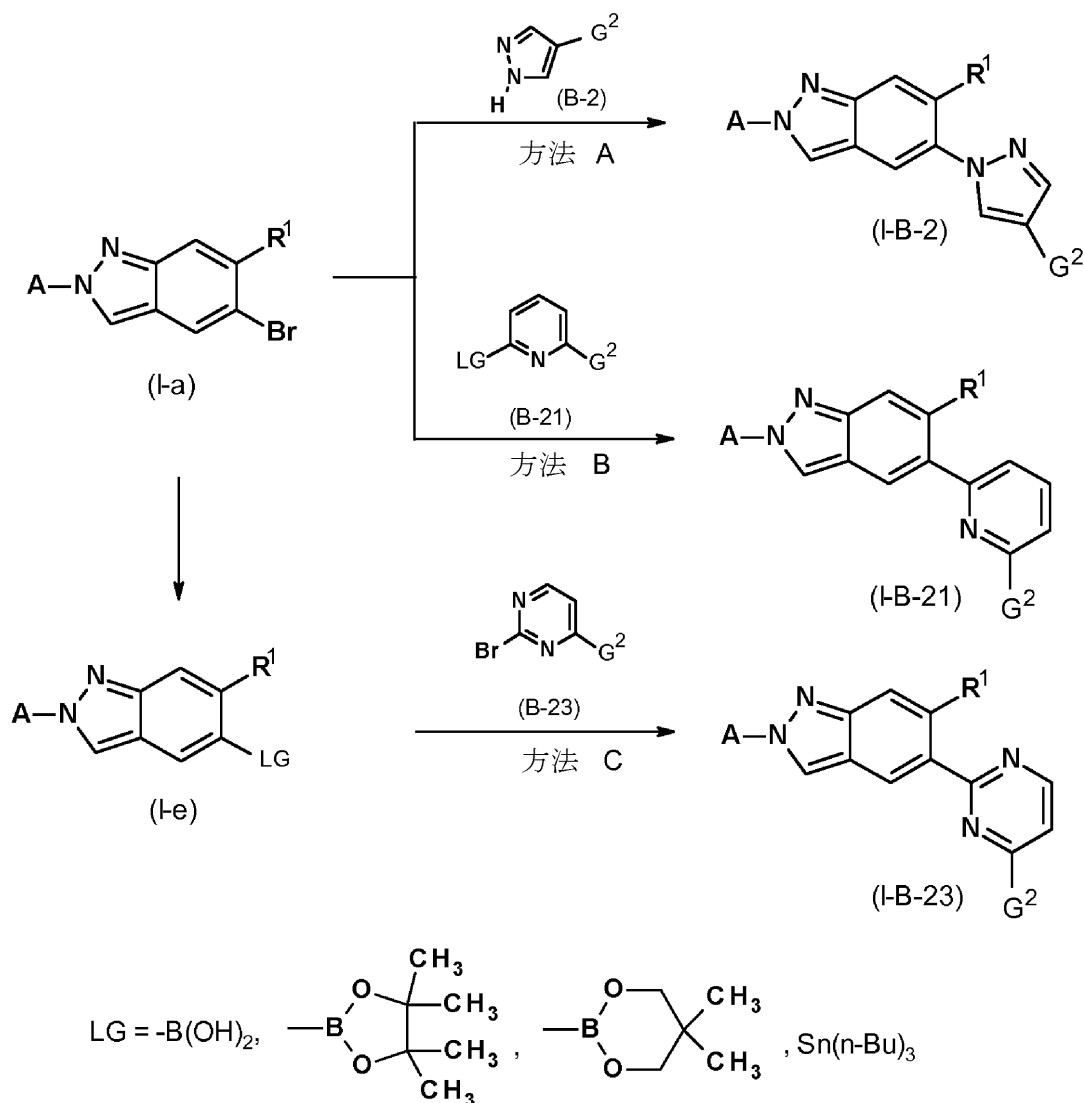
例えば、 R^2 が基（B-2）、（B-21）または（B-23）を表す式（I）の化合物は、反応図式IIIに従って得ることができる（（I-B-2）についての製造例／方法A：A=ピリジン-3-イル； R^1 =H、 G^2 =CF₃、実施例55および（I-B-21）／方法B：A=ピリジン-3-イル； R^1 、 G^2 =H；実施例59も参照）。

40

【0195】

反応図式III

【化 1 1 5】



【0 1 9 6】

反応図式 I I I において、化合物 (I-e) および (B-21) [G² は、上記で記載されている意味を有する] は、離核性脱離基 LG を有しており、この離核性脱離基 LG は、場合によりその場で生成させる。

【0 1 9 7】

R² が基 (B-1)、(B-2)、(B-10)、(B-29) または (B-30) を表す式 (I) の化合物の製造は、文献から知られている方法 A と同様にして、好ましくは、ヨウ化銅 (I) および塩基性反応助剤 (例えば、トランス-N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミンおよび炭酸カリウム) の存在下、適切な溶媒または希釈剤の中で行うことができる。有用な溶媒または希釈剤には、全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素類または芳香族炭化水素類) が包含される。

【0 1 9 8】

芳香族炭化水素類 (例えば、トルエン) を使用するのが好ましい。

【0 1 9 9】

R² が基 (B-3) から (B-9)、(B-11) から (B-28) および (B-31) から (B-33) を表す式 (I) の化合物の製造は、反応図式 I I I において示されている方法 B および方法 C と同様にして実施する。

【0 2 0 0】

例えば、適切な脱離基 (LG = B(OH)₂、または、(ヘテロ)アリールボロン酸エステル: LG = B(OR)₂) を有している化合物 (B-3) から (B-9)、(B-1

1) から (B-28) および (B-31) から (B-33) は、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、公知の方法 (Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004 参照) に従って、式 (I-a) の適切な化合物と反応させて、式 (I-B-3) から (I-B-9)、(I-B-11) から (I-B-28) および (I-B-31) から (I-B-33) の化合物を生成させることができる。

【0201】

適切な脱離基 ($LG=B(OH)_2$ 、または、(ヘテロ) アリールボロン酸エステル: $LG=B(OR)_2$) を有している化合物 (B-3) から (B-9)、(B-11) から (B-13) および (B-21) から (B-33) の一部は、公知であるか、および／または、それらは、公知の方法で製造することができる: 例えば、1-(メチル-1H-ピラゾール-4-イル) ボロン酸 [(B-3)、 $LG=B(OH)_2$ 、 $G^2=$ 水素、WO 2009/155527]、2-フェニル-4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル) オキサゾール [(B-6)、 $LG=B(OCMe_2)_2$ 、 $G^2=$ フェニル、WO 2010/094755] ; チアゾール-2-イルボロン酸 [(B-7)、 $LG=B(OH)_2$ 、 $G^2=$ 水素、US 6310095 B1] ; 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イルボロン酸 [(B-13)、 $LG=B(OH)_2$ 、 $G^2=$ フェニル、DE 19710614 A1]、ピリジン-3-イルボロン酸 [(B-21) vs (B-22)、 $LG=B(OH)_2$ 、 $G^2=$ 水素、WO 2013/186089] ; 1, 3, 5-トリアジン-2-イルボロン酸 [(B-28)、 $LG=B(OH)_2$ 、 $G^2=$ 水素、Korean Kongkae Kongbo (2011)、KR 2011/079401]。

【0202】

あるいは、式 (I-a) の化合物を、最初に、文献から知られている方法によって、式 (I-e) の化合物に変換させることが可能であり、その式 (I-e) の化合物を、次いで、反応図式 I I I に従い、方法 C によって、ハロゲンで活性化されたヘテロ環とさらに反応させる (T. Ishiyama et al., J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510; WO 2010/151601 参照) ; (I-B-23) についての製造例/方法 C: $A=$ ピリジン-3-イル; $R^2=$ ピリミジン-2-イル; R^1 、 $G^2=H$; 実施例 60 参照)。

【0203】

一部のハロゲン活性化化合物 (B-3) から (B-9)、(B-11) から (B-13) および (B-21) から (B-33) は、公知であるか、および／または、一般的に知られている方法によって製造することができる: 例えば、3-ブロモ-4, 5-ジヒドロ-1-フェニル-1H-ピラゾール [(B-18)、 $LG=Br$ 、 $G^2=$ フェニル、「J. Elguero et al., Bull. Soc. Chim. France 1996, 5, 1683-1686」]。

【0204】

R^2 が基 (B-21) または (B-23) を表す式 (I) の化合物の製造は、文献から公知であり、反応図式 I I I に示されている方法 B および方法 C と同様にして、好ましくは、適切なカップリング触媒および塩基性反応助剤の存在下、適切な溶媒または希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒または希釈剤には、全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素類または芳香族炭化水素類) が包含される。

【0205】

芳香族炭化水素類 (例えば、トルエン) を使用するのが好ましい。

【0206】

R^2 が基 (B-3) から (B-9)、(B-11) から (B-28) および (B-31

10

20

30

40

50

）から（B-33）を表す式（I）の化合物の製造は、反応図式 I I I において示されている方法 B および方法 C と同様にして、好ましくは、適切なカップリング触媒および塩基性反応助剤の存在下、適切な溶媒または希釈剤の中で、実施することができる。

【0207】

好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン] ジクロロパラジウム（II）またはテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムなどを挙げることができる。

【0208】

反応図式 I I I による製造方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウムまたはカリウムの炭酸塩である。

10

【0209】

好ましくは、使用される希釈剤は、ニトリル類、例えば、アセトニトリル、ベンゾニトリル（特に、アセトニトリル）、または、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、特に水と組み合わせた 1, 2-ジメトキシエタンである。

【0210】

R^2 が（C-1）から（C-9）からなる群からの基を表すか、 $C(X)NR^{22}R^{23}$ を表す式（I）の化合物は、例えば、 R^2 がカルボキシル基を表す式（I）の化合物から、公知の方法で、適切な活性化（すなわち、LG は、イン・サイツで発生させてもよい離核性脱離基を表す）に付した後、製造することができる。

20

【0211】

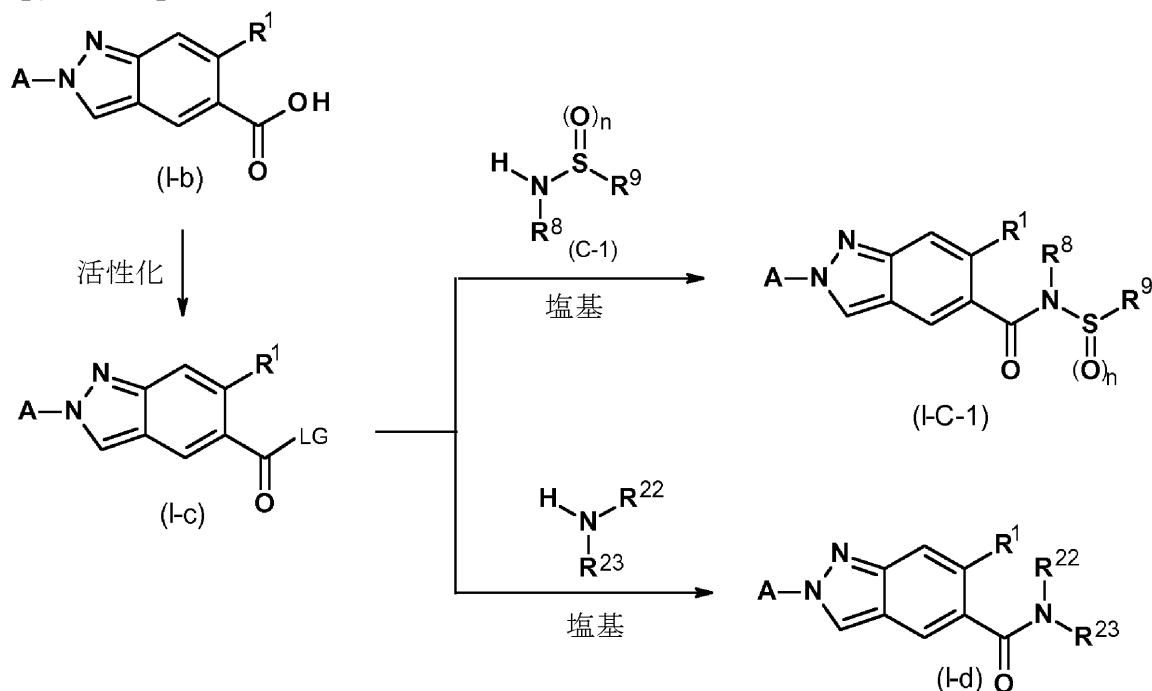
例えば、 R^2 が基（C-1）を表すか、 $C(X)NR^{22}R^{23}$ を表す式（I）の化合物は、反応図式 I V に従って得ることができる（（I-C-1）に関する製造例：A = ピリジン-3-イルまたは N-メチルピラゾール-4-イル； R^1 、 R^8 = H、 R^9 = N(CH₃)₂、n = 2；実施例 5 および 42；（Id）：A = ピリジン-3-イルまたはピリミジン-5-イル； R^1 = H、 R^{22} 、 R^{23} = CH₃、実施例 1 および 27 も参照）。

【0212】

反応図式 I V

【化 116】

30



40

【0213】

50

R^2 がカルボキシルを表す式 (I) の化合物は、反応図式 I に従って、対応する 3-ホルミル-4-ニトロ安息香酸アルキル (A-1; $R^2 = COOR$) から得ることができる。次いで、その後の一般的な方法によるエステル加水分解によって、式 (I-b) の化合物が得られる。

【0214】

式 (I-b) のカルボン酸を活性化させるための好適な縮合剤は、そのようなアミド化反応に関して一般に使用される全ての縮合剤である。例としては、以下のものを挙げることができる：酸ハロゲン化物形成剤、例えば、ホスゲン、ホスゲン誘導体、例えば、カルボニルジイミダゾール (CDI)、三塩化リン、塩化オキサリルまたは塩化チオニル；カルボジイミド、例えば、N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC) および 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド (EDCI)、または、別の一般的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、N, N'-カルボニルジイミダゾール、2-クロロピリジン 1-メトヨージド (2-chloropyridine 1-methiodide) (ムカイヤマ試薬)、2-エトキシ-N-エトキシカルボニル-1, 2-ジヒドロキノリン (EEDQ)、トリフェニルホスフィン／四塩化炭素、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート (BROP)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ) トリス (ジメチルアミノ) ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート (BOP)、ビス (2-オキソ-3-オキサゾリジニル) ホスフィン酸クロリド (BOP-Cl)、N, N, N', N'-ビス (テトラメチレン) クロロウロニウムテトラフルオロボレート、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HBTU)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-ビス (テトラメチレン) ウロニウムヘキサフルオロホスフェート、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU)、O-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-ビス (テトラメチレン) ウロニウムテトラフルオロボレート、O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HATU)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt)、および、4-(4, 6-ジメトキシ-1, 3, 5-トリアジン-2-イル)-4-メチルモルホリニウム塩 (DMTMM) (通常は、塩化物として入手可能) などがある。これらの試薬は、別個に使用し得るか、適切な場合には、組合せて使用することができる。

【0215】

しかしながら、式 (I-b) の化合物の目標とする活性化のために、混合無水物 ($LG = COOR$) を使用することも可能であり、それによって、式 (I-c-1) および式 (I-d) の化合物が製造される (cf. G. W. Anderson et al. J. Am. Chem. Soc. 1967, 89, 5012-5017)。このプロセスにおいて、さまざまなクロロギ酸エステル (例えば、例えば、クロロギ酸イソブチル ($LG = COOR$; ここで、 $R =$ イソブチル) およびクロロギ酸イソプロピル ($LG = COOR$; ここで、 $R =$ イソプロピル)) を使用することができる。同様に、これに関しては、ジエチルアセチルクロリド、トリメチルアセチルクロリドを使用することができる。

【0216】

式 (I-c) の活性化された化合物とそれぞれのアミン成分の反応図式 IV に従うその後の反応は、場合により、適切な反応助剤の存在下で、および、適切な溶媒または希釈剤の存在下で、実施する。

【0217】

反応図式 IV に従う製造方法を実施するための適切な反応助剤は、塩基性反応助剤である。

【0218】

挙げることができる例は、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウ

10

20

30

40

50

ムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩、さらに、さらなる塩基性化合物、例えば、アミジン塩基またはグアニジン塩基、例えば、7-メチル-1, 5, 7-トリアザビシクロ[4. 4. 0]デカ-5-エン(MTBD)、ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン(DBN)、ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン(DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン(DBU)、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン(CyTBG)、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン(CyTMG)、N, N, N, N-テトラメチル-1, 8-ナフタレンジアミン、ペンタメチルピペリジン、第3級アミン類、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジメチルトルイジン、N, N-ジメチル-p-アミノピリジン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルイミダゾール、N-メチルピラゾール、N-メチルモルホリン、N-メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、 α -ピコリン、 β -ピコリン、イソキノリン、ピリミジン、アクリジン、N, N, N', N'-テトラメチレンジアミン、N, N', N'-テトラエチレンジアミン、キノキサリン、N-プロピルジイソプロピルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン(ヒューニッヒ塩基)、N, N'-ジメチルシクロヘキシルアミン、2, 6-ールチジン、2, 4-ールチジンまたはトリエチレンジアミンなどである。

10

【0219】

反応図式IVに従う製造方法を実施するための塩基性反応助剤として適しているものは、全ての適切な酸結合剤、例えば、アミン類(特に、第3級アミン類)、ならびに、アルカリ金属化合物およびアルカリ土類金属化合物である。

20

【0220】

式(I-C-1)または式(I-d)の化合物を製造するために、好ましくは、第3級アミン類、例えば、N-プロピルジイソプロピルアミンまたはN-エチルジイソプロピルアミン(DIEA; ヒューニッヒ塩基)を使用する。

【0221】

適切な溶媒または希釈剤としては、全ての不活性有機溶媒、例えば脂肪族または芳香族の炭化水素類(例えば、石油エーテル、トルエン)、ハロゲン化炭化水素類(例えば、クロロトルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン)、エーテル類(例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン)、エステル類(例えば、酢酸エチル、または、酢酸メチル)、ニトロ炭化水素類(例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロベンゼン)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル、ベンゾニトリル)、アミド類(例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミド)、および、さらに、ジメチルスルホキシド、または、水、または、上記溶媒の混合物などがある。

30

【0222】

好ましくは、溶媒として、アミド類、例えば、N, N-ジメチルホルムアミドを使用する。

40

【0223】

R^2 が(D-1)から(D-3)からなる群からの基を表す式(I)の化合物は、例えば、 R^2 が臭素およびヨウ素からなる群から選択されるハロゲンを表す式(I)の化合物から、公知の方法で製造することができる。

【0224】

例えば、 R^2 が(D-1)から(D-3)からなる群からの基を表す式(I)の化合物は、反応図式Vに従い、文献から知られている方法によって得ることができる(US2013/0267493; T. Furuya et al., J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807参照)((I-D-2)についての製造例: A=ピリジン-3-イル; $R=CH_2CF_3$, $R^1=H$, W=S, X

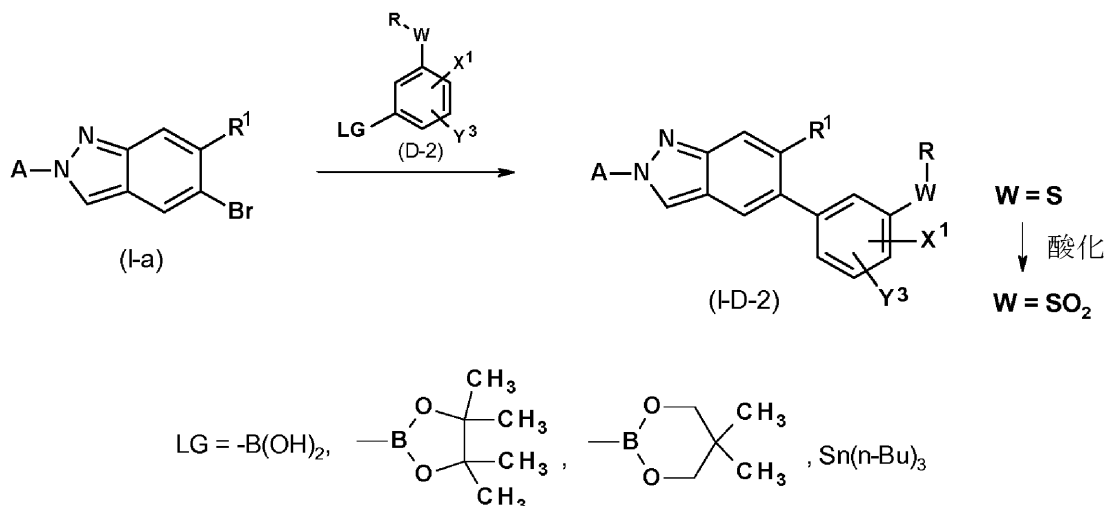
50

¹ = 2 - F、Y³ = 4 - CH₃ も参照)。

【0225】

反応図式V

【化117】



10

【0226】

反応図式Vにおいて、R、X¹、Y³が上記で言及の意味を有し、WがS、SOまたはSO₂を表す化合物(D-2)は、イン・サイツで発生させてもよい離核性脱離基LGを有している。

20

【0227】

例えば、適切な脱離基(LG = B(OH)₂、または、(ヘテロ)アリールボロン酸エステル: LG = B(OR)₂)を有している化合物(D-1)～(D-3)は、公知の方法(Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004参照)に従い、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、式(I-a)の適切な化合物と反応させて、式(I-D-1)から(I-D-3)の化合物を生成させることができる。

30

【0228】

R²が基(D-1)から(D-3)を表す式(I)の化合物の製造は、反応図式Vと同様にして、好ましくは、適切なカップリング触媒および塩基性反応助剤の存在下、適切な溶媒または希釈剤の中で、実施することができる。

【0229】

好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)またはテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどを挙げることができる。

40

【0230】

反応図式IIIによる製造方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウムまたはカリウムの炭酸塩である。

【0231】

好ましくは、ニトリル類、例えば、アセトニトリル、ベンゾニトリル(特に、アセトニトリル)、または、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン(特に、水と組み合わせられた1, 2-ジメトキシエタン)を使用する。

【0232】

次の行う、A、R、R¹、X¹、Y³が上記で言及の意味を有し、Wが硫黄を表す式(

50

I-D-2)の化合物における硫黄の酸化によって、A、R、 R^1 、 X^1 、 Y^3 が上記で言及の意味を有し、WがSOまたはSO₂を表す式(I-D-2)の化合物が得られる(反応図式V参照；(I-D-2)についての製造例：A=ピリジン-3-イル；R=CH₂CF₃、 R^1 =H、W=SO、 X^1 =2-F、 Y^3 =4-CH₃参照；実施例52またはA=ピリジン-3-イル；R=CH₂CF₃、 R^1 、 X^1 =H、W=SO、 Y^3 =4-CH₃参照；実施例53参照)。

【0233】

WがSO(スルホキシド)を表すか、WがSO₂(スルホン)を表す式(I)の化合物は、WがS(チオエーテル)を表す式(I)の化合物から、文献から公知の方法による酸化によって、例えば、適切な溶媒または希釈剤の中で酸化剤によって製造することができる。適切な酸化剤は、例えば、希硝酸、過酸化水素、Oxone(登録商標)およびペルオキシカルボン酸(例えば、メタクロロ過安息香酸)である。適切な溶媒または希釈剤は、不活性有機溶媒であり、代表的には、アセトニトリル、および、ハロゲン化溶媒(例えば、ジクロロメタン、クロロホルムまたはジクロロエタン)であり、ならびに、Oxone(登録商標)との反応に関しては、水、および、アルコール(例えば、メタノール)である。

10

【0234】

G. E. O'Mahony et al., ARKIVOC (Gainesville, FL, United states), 2011, 1, 1-110に記載の方法に従って、エナンチオマー豊富化スルホキシド類を製造するのに各種方法が適している。例えば、キラルリガンドおよび酸化剤[例えば、tert-ブチルヒドロペルオキシド(TBHP)、2-フェニルプロパン-2-イルヒドロペルオキシド(CHP)または過酸化水素水素]と一緒に、もっとも頻繁に使用される触媒源としてTi(OⁱPr)₄またはVO(acac)₂の形態にあるチタンまたはバナジウムを用いた、チオエーテルの金属触媒不斉酸化；キラル酸化剤またはキラル触媒を使用する、非金属触媒不斉酸化；電気化学的または生物学的な不斉酸化、さらには、スルホキシド類の速度論的分割、および、求核性シフト(アンダーソンの方法による)。

20

【0235】

A、 R^1 が上記で言及の意味を有し、 R^2 が-NR^{2 3}-C(X)-R^{2 2}を表す式(I)の化合物は、例えば、 R^2 が-NHR^{2 3}を表す式(I)の化合物から、式LG-CX-R^{2 2}(LGは、イン・サイツで発生させてもよい離核性脱離基を表す。)の活性化化合物を用いるN-アシル化反応によって得ることができる。

30

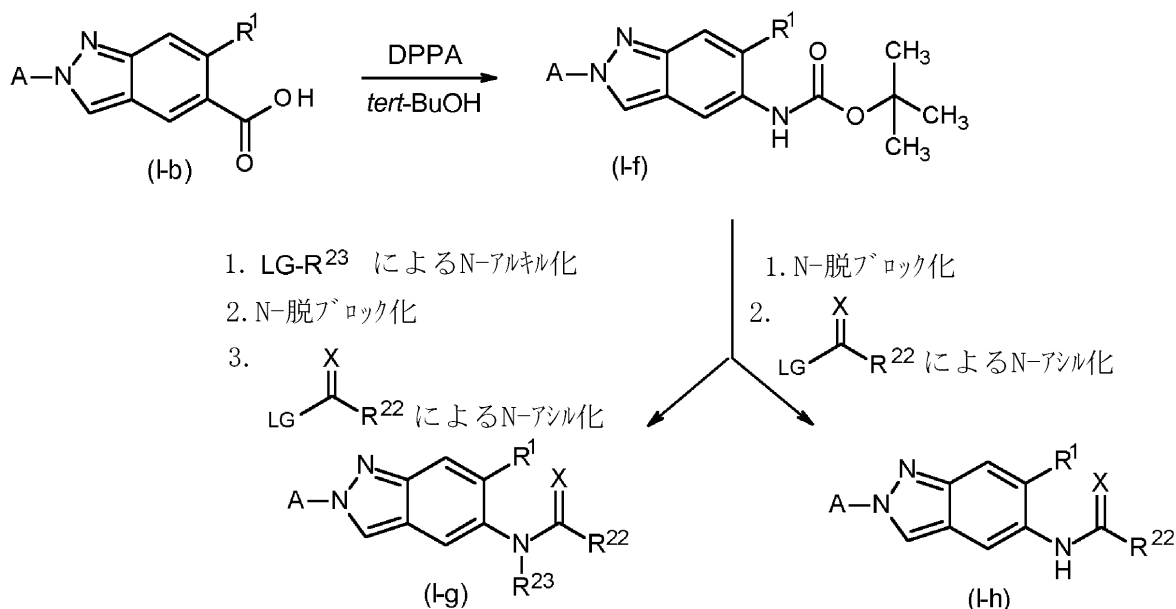
【0236】

R^2 が-NHR^{2 3}を表すこれら式(I)の化合物は、反応図式VIに従い、公知の方法によって、 R^2 がカルボキシル基を表す式(I)の化合物から製造することができる。

【0237】

反応図式VI

【化 1 1 8】



LG = 脱離基、例えばハロゲン
DPPA = ジフェニルホスホリルアジド

【0 2 3 8】

例えば、式 (I-f) の化合物は、例えば、Houben-Weyl, Method en der Organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Volume XI/1 (Georg Thieme Verlag Stuttgart), p. 865 に記載の方法に従って、クルチウス分解によって得ることができる。

【0 2 3 9】

ここで、式 (I-b) の化合物を、tert-ブタノールの存在下で、例えば、ジフェニルホスホリルアジド (DPPA) と直接反応させて、式 (I-f) の化合物を得ることができる。

【0 2 4 0】

式 (I-f) の化合物から、第1反応段階でN-アルキル化を行い、第2反応段階でN-脱ブロック化 (すなわち、Boc基の開裂) を行い、次いで第3反応段階でN-アシル化を行うことで、式 (I-g) の化合物を得ることが可能である。

【0 2 4 1】

式 (I-h) の化合物は、第1反応段階でN-脱ブロック化 (すなわち、Boc基の開裂) を行い、次いで第2反応段階でN-アシル化を行うことで製造することができる (実施例 105 から 130 参照)。

【0 2 4 2】

一般に、保護基を除去するために、文献から公知の手順に従って、酸性または塩基性の反応助剤を使用することができる。カーバメート型の保護基が使用されている場合、酸性反応助剤を使用するのが好ましい。tert-ブチルカーバメート保護基 (Boc基) が使用されている場合、例えば、適切な希釈剤 (例えば、水、および/または、有機溶媒 (例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル、エタノールまたはメタノール)) 中の鉱酸 (例えば、塩酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸) の混合物または有機酸 (例えば、安息香酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸またはトルエンスルホン酸) の混合物を使用する。塩酸または酢酸と水および/もしくは有機溶媒 (例えば、酢酸エチル) の混合物を使用するのが好ましい。

【0 2 4 3】

以降において式（I）の化合物について言及する場合、それは、式（I）によって含まれない表1中の化合物も含むものである。

【0244】

異性体

式（I）の化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、および／または、光学活性異性体の形態でも、または、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体または幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の混合物の両方を包含する。

【0245】

方法および使用

本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式（I）の化合物を害虫および／またはそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業および林業において、ならびに、材料の保護において、実施される。好ましくは、ヒトまたは動物の身体の外科的なまたは治療的な処置方法およびヒトまたは動物の身体に対して実施される診断方法は、上記方法から除外される。

【0246】

本発明は、さらに、有害生物防除剤としての、特に、作物保護剤としての、式（I）の化合物の使用にも関する。

【0247】

本出願に関連して、「有害生物防除剤（*pesticide*）」という用語は、常に、「作物保護剤」という用語も包含する。

【0248】

式（I）の化合物は、植物が良好な耐性を示し、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり、および、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子および非生物的ストレス因子に対して植物および植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、および、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類および軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、有害生物防除剤として使用することができる。それらは、通常的感受性種および抵抗性種に対して有効であり、ならびに、さらに、全ての発育段階または特定の発育段階に対して活性を示す。上記有害生物としては、以下のものを挙げることができる：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱（*Arachnida*）の、例えば、アカルス属種（*Acarus* spp.）、例えば、アカルス・シロ（*Acarus siro*）、アケリア・クコ（*Aceria kuko*）、アケリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、アクロプス属種（*Aculops* spp.）、アクルス属種（*Aculus* spp.）、例えば、アクルス・フォクケウイ（*Aculus fockeui*）、アクルス・シュレクテンダリ（*Aculus schlechtendali*）、アンブリオンマ属種（*Amblyomma* spp.）、アムフィテトラニクス・ビエネンシス（*Amphitetranychus viennensis*）、アルガス属種（*Argas* spp.）、ボオフィルス属種（*Boophilus* spp.）、ブレビパルプス属種（*Brevipalpus* spp.）、例えば、ブレビパルプス・ホエニシス（*Brevipalpus phoenicis*）、ブリオビア・グラミナム（*Bryobia graminum*）、ブリオビア・プラエチオサ（*Bryobia praetiosa*）、セントルロイデス属種（*Centruroides* spp.）、コリオプテス属種（*Chorionptes* spp.）、デルマニスス・ガリナエ（*Dermanyssus gallinae*）、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス（*Dermatophagoides pteronyssinus*）、デルマトファゴイデス・ファリナエ（*Dermatophagoides farinae*）、デルマセントル属種（

10

20

30

40

50

Dermacentor spp.)、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ (*Eotetranychus hicoriae*)、エピトリメルス・ピリ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種 (*Eutetranychus* spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ (*Eutetranychus banksi*)、エリオフィエス属種 (*Eriophyes* spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ (*Eriophyes pyri*)、グリシファグス・ドメスティクス (*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタロソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス (*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イキシデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケルス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コフェアエ (*Oligonychus coffeae*)、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yotherersi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコペルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus* spp.)、スクチゲラ属種 (*Scutigera* spp.) ;

トビムシ目 (*Collembola*) またはトビムシ綱の、例えば、例えば、オニキウ

10

20

30

40

50

ルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*) ; スミンツルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*) ;

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) ;

昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta* spp.)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta* spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スベラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレッツス属種 (*Adoretus* spp.)、アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulea*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例

10

20

30

40

50

えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリア
 トリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*C*
urculio obtusus)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*
)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugin*
eus)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*
)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、ク
 リプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangifera*
e)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus spp.*)、シ
 リンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspe*
rsus)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus f*
urnissi)、デルメステス属種 (*Dermestes spp.*)、ジアブロチカ
 属種 (*Diabrotica spp.*)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Dia*
brotica balteata)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica*
barberi)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrot*
ica undecimpunctata howardi)、ジアブロチカ・ウンデシ
 ムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunc*
tata undecimpunctata)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフ
 エラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチ
 カ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zaeae*)、
 ジコクロシス属種 (*Dichocrocis spp.*)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*20*
Dicladispa armigera)、ジロボデルス属種 (*Diloboderu*
s spp.)、エピカエルス属種 (*Epicaerus spp.*)、エピラクナ属種
 (*Epilachna spp.*)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilach*
na borealis)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna vari*
vestis)、エピトリキス属種 (*Epitrix spp.*)、例えば、エピトリキ
 ス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリキス・フスクラ (*E*
pitrix fuscula)、エピトリキス・ヒルチペンニス (*Epitrix h*
irtipennnis)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcri*
nita)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチ
 ヌス属種 (*Faustinus spp.*)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium 30*
psylloides)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus co*
rnutus)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニク
 ス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニキス属種 (*Het*
eronyx spp.)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha ele*
gans)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒ
 ペラ・ポストカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hyp*
omeces squamosus)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus*
spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampe*
i)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、
 ヒポテネムス・プベセン (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノ
 ステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosterna consanguinea*)
 、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチ
 クス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lath*
ridius spp.)、レマ属種 (*Lema spp.*)、レプチノタルサ・デセム
 リネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種
 (*Leucoptera spp.*)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leuco*
ptera coffeella)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissor*
hoptrus oryzophilus)、リストロノツス属種 (*Listronot*
us spp.) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes spp.*)、リキス属種
 (*Lixus spp.*)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha 40*
 50

xanthodera)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、リクツ
 ス属種 (*Lycetus* spp.)、メガセリス属種 (*Megascelis* spp.
)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラノツス・ロングル
 ス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、
 メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種
 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolo
 ntha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、
 モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス
 (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrob
 ia* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella* spp.)、
 ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセ
 ロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (
Oryzaephilus surinamensis)、オリザファグス・オリザエ (
Oryzaphagus oryzae)、オチオリンクス属種 (*Otiorhynch
 us* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorhynch
 us cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorhynch
 us ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorhynchus
 ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorhynchus r
 ugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorhynch
 us sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema* spp.)、例えば、オウレマ
 ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oule
 ma oryzae*)、オキシセトニア・ジュンクンダ (*Oxycetonia jucu
 nda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、
 フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Ph
 yllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta*
 spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta arm
 oraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)
 、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ス
 トリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (
Popillia japonica)、プレムノトリペス属種 (*Premnotryp
 es* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus tr
 uncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes* spp.)、例えば、プ
 シリオデス・アフィニス (*Psylliodes affinis*)、プシリオデス・ク
 リソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・
 プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属種 (*Pti
 nus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventral
 is*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、リンコ
 ホルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギネウス
 (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム
 (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス (
Sinoxylon perforans)、シトフィルス属種 (*Sitophilus
 spp.*)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus grana
 rius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、
 シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼア
 マイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Spheno
 p
 horus* spp.)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium panic
 eum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネク
 ス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (
Symphyletes spp.)、タニメクス属種 (*Tanymecus* spp.

10

20

30

40

50

)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymericus dilaticolis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymericus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymericus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma spp.*)、チキウス属種 (*Tychius spp.*)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus spp.*)、ザブルス属種 (*Zabrus spp.*)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrio ides*) ;

10

ハサミムシ目 (*Dermaptera*) の、例えば、アニソラビス・マリチメ (*Anisolabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)、ラビズラ・リパリア (*Labidura riparia*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes spp.*)、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza spp.*)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia spp.*)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera spp.*)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus spp.*)、クリソミア属種 (*Chrysomya spp.*)、クリソプス属種 (*Chrysops spp.*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya spp.*)、コンタリニア属種 (*Contarinia spp.*)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロピア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex spp.*)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides spp.*)、クリセタ属種 (*Culiseta spp.*)、クテレブラ属種 (*Cuterebra spp.*)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura spp.*)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デ

20

30

40

50

リア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロ
 リレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス
 (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、
 ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila sukuzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、エウレイア・ヘラク
 レイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (10
Glossina spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒ
 ッポドスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオ
 ミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブ
 レンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、
 例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミイア属種 (20
Lutzomyia spp.)、マンソニア属種 (*Mansonina* spp.)、ム
 スカ属種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vi
 cina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus*
 spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミイア属種 (*Pegomya* spp.)、例え
 ば、ペゴミイア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミイア・ヒオシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミイア・ルビボラ (*Pegomya rubi
 vora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (30
Phorbia spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ
 ・カセイ (*Piophilica casei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplos
 is* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis
 cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレ
 チス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチ
 ス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga*
 spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メ 40
 リジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種
 (*Tetanops* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チ
 プラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チプラ・シムプレキス (*Tipu
 la simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;
 カメムシ目 (Hemiptera) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ
 (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia
 uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシル 50

トシボン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシボン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrix floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフィス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストブシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコブシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperid*

dum)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカスム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセルス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種 (*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフエアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodiscas coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・プルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*) (=パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macrosteles facifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium*

dirhodum)、モネリア・コスタリス(Monellia costalis)、モネリオプシス・ペカニス(Monelliopsis pecanisis)、ミズス属種(Myzus spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス(Myzus ascalonicus)、ミズス・セラシ(Myzus cerasi)、ミズス・リグストリ(Myzus ligustri)、ミズス・オルナツス(Myzus ornatus)、ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae)、ミズス・ニコチアナエ(Myzus nicotianae)、ナソノビア・リビスニグリ(Nasonovia ribisnigri)、ネオマスケリア属種(Neomaskellia spp.)、ネホテッチキス属種(Nephotettix spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス(Nephotettix cincticeps)、ネホテッチキス・ニグロピクツス(Nephotettix nigropictus)、ネチゴニセラ・スペクトラ(Nettigoniclla spectra)、ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)、オンコメトピア属種(Oncometopia spp.)、オルテジア・プラエロンガ(Orthezia praelonga)、オキシヤ・キネンシス(Oxya chinensis)、パキプシラ属種(Pachypsylla spp.)、パラベミシア・ミリカエ(Parabemisia myricae)、パラトリオザ属種(Paratrionza spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ(Paratrionza cockerelli)、パルラトリア属種(Parlatoria spp.)、ペムフィグス属種(Pemphigus spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス(Pemphigus bursarius)、ペムフィグス・ポプリベナエ(Pemphigus populivenae)、ペレグリヌス・マイジス(Peregrinus maidis)、ペルキンシエラ属種(Perkinsiella spp.)、フェナコックス属種(Phenacoccus spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス(Phenacoccus

10

20

madeirensis)、プロエオミズス・パッセリニイ(Phloeomyzus passerinii)、ホロドン・フムリ(Phorodon humuli)、フィロキセラ属種(Phylloxera spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス(Phylloxera devastatrix)、フィロキセラ・ノタビリス(Phylloxera notabilis)、ピンナスピス・アスピジストラエ(Pinnaspis aspidistrae)、プラノコックス属種(Planococcus spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ(Planococcus citri)、プロソピドプシラ・フラバ(Prosopidopsylla flava)、プロトプルビナリア・ピリホルミス(Protopulvinaria pyriiformis)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ(Pseudaulacaspis pentagona)、プセウドコックス属種(Pseudococcus spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ(Pseudococcus calceolariae)、プセウドコックス・コムストックイ(Pseudococcus comstocki)、プセウドコックス・ロングスピヌス(Pseudococcus longispinus)、プセウドコックス・マリチムス(Pseudococcus maritimus)、プセウドコックス・ビブルニ(Pseudococcus viburni)、プシロプシス属種(Psyllopsis spp.)、プシラ属種(Psylla spp.)、例えば、プシラ・ブキシ(Psylla buxi)、プシラ・マリ(Psylla mali)、プシラ・ピリ(Psylla pyri)、プテロマルス属種(Pteromalus spp.)、プルビナリア属種(Pulvinaria spp.)、ピリラ属種(Pyrrilla spp.)、クアドラスピジオツス属種(Quadrastpidiotus spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランズレギアエ(Quadrastpidiotus juglansregiae)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス(Quadrastpidiotus ostreaeformis)、クアドラスピジオツス・ペルニシオスス(Quadr

30

40

50

aspidiotus perniciosus)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシウム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシウム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシウム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシウム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクトア (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミヌム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspis articulatus*)、シファ・フラバ (*Sipha flava*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictoccephala festina*)、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetragonoccephala* spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスпис属種 (*Tomaspis* spp.)、トキシソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキシソプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシソプテラ・シトリシズス (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バポラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Trioza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスпис属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ;

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アエリア属種 (*Aelia* spp.)、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp.)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (*Euschistus hero*)、エウスキスツス・セルブス (*Euschistus servus*)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属種 (*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horci*

10

20

30

40

50

as nobilellus)、レプトコリス属種 (Leptocoris a spp.)、レプトコリス・バリコルニス (Leptocoris a varicornis)、レプトグロスス・オッシデンタリス (Leptoglossus occidentalis)、レプトグロスス・フィロプス (Leptoglossus phyllopus)、リゴコリス属種 (Lygocoris spp.)、例えば、リゴコリス・パブリス (Lygocoris pabulinus)、リグス属種 (Lygus spp.)、例えば、リグス・エリス (Lygus elisus)、リグス・ヘスペルス (Lygus hesperus)、リグス・リネオラリス (Lygus lineolaris)、マクロペス・エキスカバツス (Macropes excavatus)、メガコプタ・クリブラリア (Megacopta cribraria)、ミリダエ (Miri 10 dae)、モノロニオン・アトラツム (Monalonion atratum)、ネザラ属種 (Nezara spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (Nezara viridula)、ニシウス属種 (Nysius spp.)、オエバルス属種 (Oebalus spp.)、ペントミダエ (Pentomidae)、ピエスマ・クアドラタ (Piesma quadrata)、ピエゾドルス属種 (Piezodorus spp.)、例えば、ピエゾドルス・グイルジニイ (Piezodorus guildinii)、プサルス属種 (Psallus spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (Pseudacysta perseae)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (Sahlbergella singularis)、スカプトコリス・カスタネア (Scaptocoris castanea)、スコチノホ 20 ラ属種 (Scotinophora spp.)、ステファニチス・ナシ (Stephanitis nashi)、チブラカ属種 (Tibraca spp.)、トリアトマ属種 (Triatoma spp.) ;

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、アクロミルメキス属種 (Acromyrmex spp.)、アタリア属種 (Athalia spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (Athalia rosae)、アッタ属種 (Atta spp.)、カムボノツス属種 (Camponotus spp.)、ドリコベスプラ属種 (Dolichovespula spp.)、ジプリオン属種 (Diprion spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (Diprion similis)、ホプロカムパ属種 (Hoplocampa spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (Hoplocampa 30 cookei)、ホプロカムパ・テスツジネア (Hoplocampa testudinea)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、リネピテマ (イリジオミルメキス)・フミレ (Linepithema (Iridiomyrmex) humile)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、パラトレキナ属種 (Paratrechina spp.)、パラベスプラ属種 (Paravespula spp.)、プラギオレピス属種 (Plagiolepis spp.)、シレキス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta)、タピノマ属種 (Tapinoma spp.)、テクノミルメキス・アルビペス (Technomyrmex albipes)、ウロセルス属種 (Urocerus spp.)、ベスパ属種 (Vespa spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (Vespa crabro)、ワスマンニア・アウロプンクタタ (Wasmannia auropunctata)、キセリス属種 (Xeris spp.) ; 40

ワラジムシ目 (Isopoda) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (Armadillidium vulgare)、オニスクス・アセルス (Oniscus asellus)、ポルセリオ・スカベル (Porcellio scaber) ;

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、コプトテルメス属種 (Coptotermes spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (Coptotermes formosanus)、コルニテルメス・クムランス (Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属種 (Cryptotermes spp.)、インシシテルメス属種 (Incisitermes spp.)、カロテルメス属種 (Ka 50

lotermes spp.)、ミクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes* spp.)、オドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp.)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroploce* spp.)、アウトグラファ属種 (*Autographa* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus pinarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルボカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルボシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura* spp.)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia* spp.)、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種 (*Copitarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuoides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.)、ジパロプシス属種 (*Diparopsis* spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア属種 (*Epinotia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana*)、エランニス属種 (*Erannis* spp.)、エルス

10

20

30

40

50

コビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属種 (*Etiella* spp.)、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp.)、エウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguelia*)、エウプロクチス属種 (*Euproctis* spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、エウキシオア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Grapholita* spp.)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholita molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholita prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homo eosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides* spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレスタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテンナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*amestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketis* spp.)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operophtera* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter b*

10

20

30

40

50

lancardella)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (Phyllonorycter crataegella)、ピエリス属種 (Pieris spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (Pieris rapae)、プラチノタ・スツルタナ (Platynota stultana)、プロジア・インテルプンクテラ (Plodia interpunctella)、プルシア属種 (Plusia spp.)、プルテラ・キシロステラ (Plutella xylostella) (=プルテラ・マクリペンニス (Plutella maculipennis))、プライス属種 (Prays spp.)、プロデニア属種 (Prodenia spp.)、プロトパルセ属種 (Protoparce spp.)、プセウダレチア属種 (Pseudaletia spp.)、例えば、プセウダレチア・ウニプンクタ (Pseudaletia unipuncta)、プセウドプルシア・インクルデンス (Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ヌビラリス (Pyrausta nubilalis)、ラキブルシア・ヌ (Rachiplusia nu)、スコエノビウス属種 (Schoenobius spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (Schoenobius bipunctifer)、シルポファガ属種 (Scirpophaga spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ (Scirpophaga innotata)、スコチア・セゲツム (Scotia segetum)、セサミア属種 (Sesamia spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (Sesamia inferens)、スパルガノチス属種 (Sparganothis spp.)、スポドプテラ属種 (Spodoptera spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (Spodoptera eradiana)、スポドプテラ・エキシグア (Spodoptera exigua)、スポドプテラ・フルギペルダ (Spodoptera frugiperda)、スポドプテラ・プラエフィカ (Spodoptera praefica)、スタトモポダ属種 (Stathmopoda spp.)、ステノマ属種 (Stenomoma spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (Stomopteryx subselvella)、シナンテドン属種 (Synanthedon spp.)、テシア・ソラニボラ (Tecia solanivora)、タウメトポエア属種 (Thaumetopoea spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (Thermesia gemmatalis)、チネア・クロアセラ (Tinea cloacella)、チネア・ペリオネラ (Tinea pellionella)、チネオラ・ビッセリエラ (Tineola bisselliella)、トルトリキス属種 (Tortrix spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (Trichophaga tapetzella)、トリコプルシア属種 (Trichoplusia spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ (Trichoplusia ni)、トリポリザ・インセルツラス (Tryporyza incertulas)、ツタ・アブソルタ (Tuta absoluta)、ビラコラ属種 (Virachola spp.) ;

バッタ目 (Orthoptera) または (Saltatoria) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (Acheta domesticus)、ジクロプルス属種 (Dichroplus spp.)、グリロタルパ属種 (Gryllotalpa spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (Gryllotalpa gryllotalpa)、ヒエログリフス属種 (Hieroglyphus spp.)、ロクスタ属種 (Locusta spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (Locusta migratoria)、メラノプルス属種 (Melanoplus spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル (Melanoplus devastator)、パラトランチクス・ウスリエンシス (Paratlanticus ussuriensis)、スキストセルカ・グレガリア (Schistocerca gregaria) ;

シラミ目 (Phthiraptera) の、例えば、ダマリニア属種 (Damalinia spp.)、ハエマトピヌス属種 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属種 (Linognathus spp.)、ペジクルス属種 (Pedicul

10

20

30

40

50

us spp.)、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス。プビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.) ;

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus* spp.)、リボセリス属種 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレクス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ;

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (*Chaetanaphothrips leeuweni*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ (*Frankliniella vaccinii*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリプス属種 (*Haplothrips* spp.)、ヘリオトリプス属種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、カコトリプス属種 (*Kakothrips* spp.)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニノトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.)、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、トリプスタバシ (*Thrips tabaci*) ;

シミ目 (*Zygentoma* (= *Thysanura*)) の、例えば、クテノレピスマ属種 (*Ctenolepisma* spp.)、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、レスピモデス・インクイリヌス (*Lepismodes inquilinus*)、テルモビア・ドメスチカ (*Thermobia domestica*) ;

コムカデ綱 (*Symphyla*) の、例えば、スクチゲレラ属種 (*Scutigerebella* spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigerebella immaculata*) ;

軟体動物門 (*Mollusca*) の害虫、特に、ニマイガイ綱 (*Bivalvia*) の、例えば、ドレイセナ属種 (*Dreissena* spp.) ; および、さらに、

マキガイ綱 (*Gastropoda*) の、例えば、アリオン属種 (*Arion* spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス (*Arion ater rufus*)、ビオムファラリア属種 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属種 (*Bulinus* spp.)、デロセラス属種 (*Deroceras* spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ (*Deroceras laeve*)、ガルバ属種 (*Galba* spp.)、リムナエア属種 (*Lymnaea* spp.)、オンコメラニア属種 (*Oncomelania* spp.)、ポマセア属種 (*Pomacea* spp.)、スクシネア属種 (*Succinea* spp.) ;

10

20

30

40

50

扁形動物門 (Platyhelminthes) および線形動物門 (Nematoda) の、動物およびヒトの寄生生物、例えば、アエルストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、例えば、アンシロストマ・ズオデナレ (Ancylostoma duodenale)、アンシロストマ・セイラニクム (Ancylostoma ceylanicum)、アンシロストマ・ブラジリエンシス (Ancylostoma braziliensis)、アングリオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、アニサキス属種 (Anisakis spp.)、アノプロセファラ属種 (Anoplocephala spp.)、アスカリス属種 (Ascaris spp.)、アスカリジア属種 (Ascaridia spp.)、バイリサスカリス属種 (Baylisascaris spp.)、ブルギア属種 (Brugia spp.)、例えば、ブルギア・マライイ (Brugia malayi)、ブルギア・チモリ (Brugia timori)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、カピラリア属種 (Capillaria spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、クロノルキス属種 (Clonorchis spp.)、コオペリア属種 (Cooperia spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、シアトストマ属種 (Cyathostoma spp.)、ジクロコエリウム属種 (Dicrocoelium spp.)、ジクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.)、例えば、ジクチオカウルス・フィラリア (Dictyocaulus filaria)、ジフィロボトリウム属種 (Diphylllobothrium spp.)、例えば、ジフィロボトリウム・ラツム (Diphylllobothrium latum)、ジピリジウム属種 (Dipylidium spp.)、ジロフィラリア (Dirofilaria spp.)、ドラクンクルス属種 (Dracunculus spp.)、例えば、ドラクンクルス・メジネンシス (Dracunculus medinensis)、エキノコックス属種 (Echinococcus spp.)、例えば、エキノコックス・グラヌロソス (Echinococcus granulosus)、エキノコックス・ムルチロクラリス (Echinococcus multilocularis)、エキノストマ属種 (Echinostoma spp.)、エンテロビウス属種 (Enterobius spp.)、例えば、エンテロビウス・ベルミクラリス (Enterobius vermicularis)、エウコレウス属種 (Eucoleus spp.)、ファシオラ属種 (Fasciola spp.)、ファシオロイデス属種 (Fascioloides spp.)、ファシオロプシス属種 (Fasciolopsis spp.)、フィロロイデス属種 (Filaroides spp.)、ゴンギロネマ属種 (Gongylonema spp.)、ギロダクチルス属種 (Gyrodactylus spp.)、ハブロンエマ属種 (Habronema spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)、ヒメノレピス属種 (Hymenolepis spp.)、例えば、ヒメノレピス・ナナ (Hymenolepis nana)、ヒオストロンギルス属種 (Hyoststrongylus spp.)、リトモソイデス属種 (Litomosoides spp.)、ロア属種 (Loa spp.)、例えば、ロア・ロア (Loa Loa)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、メソセストイデス属種 (Mesocestoides spp.)、モニエジア属種 (Moniezia spp.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、ネカトル属種 (Necator spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ニッポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、オエソファゴストムム属種 (Oesophagostomum spp.)、オルラス属種 (Ollulanus spp.)、オンコセルカ属種 (Onchocerca spp.)、例えば、オンコセルカ・ボルブルス (Onchocerca volvulus)

10

20

30

40

50

s、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パッサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、例えば、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、例えば、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、例えば、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセウドプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、例えば、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、例えば、ウケレリア・バンクロフト (*Wuchereria bancrofti*) ;

線形動物門 (*Nematoda*) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウザツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortonii*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・スキシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、

クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコ
 ネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウ
 ム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Cr
 iconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Me
 socriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Cricon
 emoides spp.*)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Cricon
 emoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconem
 oides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoi
 des ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus spp.*)、
 10 例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコ
 ドルス属種 (*Dolichodorus spp.*)、グロボデラ属種 (*Globode
 ra spp.*)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)
 、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)
 、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、例えば、ヘ
 リコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihyssera*)
 、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoides spp.*)、ヘミ
 シクリオホラ属種 (*Hemicycliophora spp.*)、ヘテロデラ属種 (*H
 eterodera spp.*)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heteroder
 a avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycine
 s*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルス
 20 クマニエラ属種 (*Hirschmaniella spp.*)、ホプロライムス属種 (*H
 oplolaimus spp.*)、ロンギドルス属種 (*Longidorus spp
 .*)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanu
 s*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne spp.*)、例えば、メロイドギネ
 ・キトウオオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファ
 ラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloi
 dogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne
 incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema spp.*)、ナコップス
 30 属種 (*Nacobbus spp.*)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus
 spp.*)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus spp.*)、パ
 ラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus spp.*)、パラトリコドルス属
 種 (*Paratrichodorus spp.*)、例えば、パラトリコドルス・ミノル
 (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paraty
 lenchus spp.*)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp
 .*)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penet
 rans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus spp.*)、
 プシレンクス属種 (*Psilenchus spp.*)、プンクトデラ属種 (*Punct
 odera spp.*)、クイニスルシウス属種 (*Quinisolcius spp.
 .*)、ラドホルス属種 (*Radopholus spp.*)、例えば、ラドホルス・シトロ
 40 フィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*R
 adopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchu
 lus spp.*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、スクテ
 ロネマ属種 (*Scutellonema spp.*)、スバングイナ属種 (*Subang
 uina spp.*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、例え
 ば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコド
 ルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリン
 クス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、例えば、チレンコリンクス
 ・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンク
 ルス属種 (*Tylenchulus spp.*)、例えば、チレンクルス・セミペネトラ
 50 ンス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*X*

iphinema spp.）、例えば、キシフィネマ・インデキス (Xiphinema index)。

【0249】

さらにまた、原生動物亜界 (Protozoa) の、コクシジウム目 (Coccidia)、例えば、エイメリア属種 (Eimeria spp.) なども防除することができる。

【0250】

式 (I) の化合物は、場合により、特定の濃度または特定の施用量において、除草剤、葉害軽減剤、成長調節剤もしくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、または、殺微生物剤 (microbicide) もしくは除雄剤 (gametocide) 10
として、例えば、殺菌剤 (fungicide)、抗真菌剤 (antimycotic)、殺細菌剤もしくは殺ウイルス剤 (これは、ウィロイドに対する作用薬も包含する) としても使用し得るか、または、MLO (マイコプラズマ様生物) および RLO (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。それらは、場合により、別の活性化化合物を合成するための中間体または前駆物質としても使用することができる。

【0251】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) の少なくとも1種類の化合物を含んでいる、有害生物防除剤としての製剤およびその製剤から調製される使用形態 [例えば、灌注液、滴下液および散布液] にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる有害生物防除剤、および/または、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、ナタネ油メチルエステルまたはダイズ油メチルエステル)、または、アルカノールアルコキシレート類、および/または、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類および/または塩、例えば、有機または無機のアンモニウム塩またはホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウムまたはリン酸水素二アンモニウム)、および/または、保持促進剤 (retention promoter) (例えば、スルホコハク酸ジオクチルまたはヒドロキシプロピルグアーポリマー)、および/または、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、および/または、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料またはリン含有肥料) を含有する。 20 30

【0252】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、カプセル製剤 (capsule concentrates) (CS)； これらの製剤型および別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers -173 (作製元：the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式 (I) の1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性化化合物を含有する。 40

【0253】

好ましいのは、補助剤 [例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤 (spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (frost protection agent)、殺生物剤、増粘剤および/または他の補助剤 (例えば、アジュバント) など] を含有している製剤または使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体が生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張 (spreadin 50

g)、付着を促進する作用物質または浸透を促進する作用物質である。

【0254】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式(I)の化合物を補助剤(例えば、増量剤、溶媒および／もしくは固体担体、ならびに／または、別の補助剤、例えば、界面活性剤)と混合させることにより調製する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、または、施用前もしくは施用中に製造する。

【0255】

使用する補助剤は、式(I)の化合物の製剤またはそのよう製剤から調製された使用形態(例えば、即時使用可能な(ready-to-use)有害生物防除剤、例えば、散布液または種子粉衣製品)に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性および／又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

10

【0256】

適切な増量剤は、例えば、水、ならびに、極性および非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである： 芳香族および非芳香族の炭化水素類(例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類)、アルコール類およびポリオール類(これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、および／または、エステル化されていてもよい)、ケトン類(例えば、アセトン、シクロヘキサノン)、エステル類(これは、脂肪類および油類を包含する)および(ポリ)エーテル類、単純アミン類および置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類(例えば、N-アルキルピロリドン類)、および、ラクトン類、スルホン類およびスルホキシド類(例えば、ジメチルスルホキシド)。

20

【0257】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に以下のものである： 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキササンまたはパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油および植物油、アルコール類、例えば、ブタノールまたはグリコールとそれらのエーテルおよびエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド、および、水。

30

【0258】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素または塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキササン、パラフィン類、鉱油留分、鉱油および植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールまたはグリコールとそれらのエーテルおよびエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、および、さらに、水である。

40

【0259】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、および、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたはケイ藻土、および、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、および、天然シリケートまたは合成シリケート、樹脂、蠟、および／または、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、ならびに、無機および有機の粉末からなる合成顆粒、ならびに、さらに、有機材料(例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、

50

トウモロコシ穂軸およびタバコの葉柄など）からなる顆粒。

【0260】

液化ガスの増量剤または溶媒を使用することも可能である。特に適しているのは、標準温度および大気圧下では気体である増量剤または担体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、および、さらに、ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素などである。

【0261】

イオン特性もしくは非イオン特性を有する乳化剤および／もしくは泡形成剤、分散剤または湿潤剤の例、または、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである：

ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸もしくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物もしくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物もしくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノールまたはアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステルもしくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、ならびに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオンおよびリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、および、メチルセルロース。式（I）の化合物のうちの1種類および／または該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

【0262】

該製剤およびその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤は、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー（Prussian Blue）、ならびに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料、ならびに、栄養素および微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガニン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩および亜鉛塩などである。

【0263】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、または、化学的および／もしくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤または消泡剤も存在させることができる。

【0264】

さらにまた、該製剤およびその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、ならびに、粉末または顆粒またはラテックスの形態にある天然ポリマーおよび合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニル、または、天然リン脂質、例えば、セファリンおよびレシチン、および、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油および植物油であり得る。

【0265】

適切な場合には、該製剤およびその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）の化合物は、製剤を目的として通常使用される固体または液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0266】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質（例えば、スルホコハク酸ジオクチル）または粘弾性を増大させる全ての物質（例えば、ヒドロキシプロピルグラーポリマー）が包含される。

【0267】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬有効成分の浸透を向上させるために一般的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、および／または、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性化合物のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナッツ脂肪エトキシレート（coconut fatty ethoxylate）（10）もしくはイソトリデシルエトキシレート（12）、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステルもしくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート（15）、または、アンモニウム塩および／もしくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

10

【0268】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%～98重量%の式（I）の化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%～95重量%の式（I）の化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%～90重量%の式（I）の化合物を含んでいる。

【0269】

該製剤（特に、有害生物防除剤）から調製された使用形態の中の式（I）の化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式（I）の化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%～95重量%の式（I）の化合物、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の式（I）の化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

20

【0270】

混合物

式（I）の化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、または、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤（microbiological agent）、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤（phytonic）、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質および／または植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、および／または、非生物的要因（例えば、高温または低温）に対する耐性、渇水に対する耐性または水中もしくは土壌中の塩分の含有量の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能および結果性能を改善することも可能であり、発芽能力および根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫高を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質および／もしくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、ならびに／または、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

30

40

【0271】

さらに、式（I）の化合物は、別の活性化合物または情報化学物質（例えば、誘引剤、および／または、鳥忌避剤、および／または、植物活性化剤、および／または、成長調節剤、および／または、肥料）との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式（I）の化合物は、植物の特性（例えば、生長、収穫量および収穫物の品質）を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

【0272】

本発明による特定の実施形態では、式（I）の化合物は、製剤の中に、または、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物（好ましくは、以下に記載され

50

ている化合物)と混合された状態で存在している。

【0273】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、各場合で、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。

【0274】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている有効成分は、既知であり、そして、例えば、「“The Pesticide Manual”, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、または、インターネット上で検索することができる(例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」)。

【0275】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、および、キシリルカルブ；または、

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスーエチル、アジンホスーメチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス (chloropyrifos)、クロルピリホスーメチル (chloropyrifos-methyl)、クマホス、シアノホス、ジメトン-Sーメチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、Oー(メトキシアミノチオホスホリル)サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン-Sーメチル、パラチオン、パラチオン-Sーメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-Sーメチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、および、バミドチオン。

【0276】

(2) GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

シクロジェン-有機塩素系、例えば、クロルダン、および、エンドスルファン；または、フェニルピラゾール系(フィプロール系)、例えば、エチプロール、および、フィプロニル。

【0277】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター／電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d-シスートランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン-S-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シベルメトリン、アルファーシベルメトリン、ベーターシベルメトリン、シーターシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シフェノトリン[(1R)-トランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン[(E)-Z)-(1R)異性体]、エスフェンバレレート、エトフ

10

20

30

40

50

エンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウフルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)ートランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類(除虫菊(*pyrethrum*))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロメトリン、および、トランスフルトリン；または、

DDT；または、メトキシクロル。

【0278】

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)作動薬、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、および、チアメトキサム；または、ニコチン；または、スルホキサフロル、または、フルピラジフロル。

10

【0279】

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)のアロステリック活性化薬、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、および、スピノサド。

【0280】

(6) 塩化物チャンネル活性化薬、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、および、ミルベメクチン。

20

【0281】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレレン、キノプレレン、および、メトプレレン；または、フェノキシカルブ；または、ピリプロキシフェン。

【0282】

(8) 作用機序が知られていないかまたは特定されていない活性化合物、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、および、別のハロゲン化アルキル；または、クロロピクリン；または、フッ化スルフリル；または、ホウ砂；または、吐酒石。

30

【0283】

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、ピメトロジン；または、フロニカミド。

【0284】

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、および、ジフロビダジン；または、エトキサゾール。

【0285】

(11) 昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・イスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス(*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・アイザワイ(*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・クルスタキ(*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・テネブリオニス(*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、および、BT植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34／35Ab1。

40

50

【0286】

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン；または、有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、および、酸化フェンブタズ；または、プロパルギット；または、テトラジホン。

【0287】

(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化デカップラー、例えば、クロルフェナピル、DNOC、および、スルフラミド。

【0288】

(14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、および、チオスルタップーナトリウム。

10

【0289】

(15) キチン生合成の阻害薬（タイプ0）、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、および、トリフルムロン。

【0290】

(16) キチン生合成の阻害薬（タイプ1）、例えば、ブプロフェジン。

20

【0291】

(17) 脱皮阻害薬（特に、双翅目（即ち、双翅類）に関する）、例えば、シロマジン。

【0292】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、および、テブフェノジド。

【0293】

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ。

30

【0294】

(20) 複合体III電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；または、アセキノシル；または、フルアクリピリム。

【0295】

(21) 複合体I電子伝達阻害薬、例えば、METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、および、トルフェンピラド；または、ロテノン（Derri s）。

【0296】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；または、メタフルミゾン。

40

【0297】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロ酸誘導体およびテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、および、スピロテトラマト。

【0298】

(24) 複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、および、リン化亜鉛；または、シアン化物。

50

【0299】

(25) 複合体 I I 電子伝達阻害薬、例えば、
シエノピラフェン、および、シフルメトフェン。

【0300】

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、および、
フルベンジアミド。

【0301】

作用機序が知られていないかまたは不明瞭であるさらなる活性化化合物、例えば、アフィ
ドピロベン、アフォキシレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート
、ピフェナゼート、ブロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石 (cryolite)
、シクラニリプロール、シクロキサプリド (cycloxaprid)、シアロジアミ
ド (cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジコホル、ジフロビダジン、フロメトキン、フルエンズルホン、フルフェネリム
、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン (fluhexafon)
、フルオピラム、フルララネル、フフェノジド (fufenozide)、グアジピ
ル (guadipyr)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、メベルフ
ルトリン、パイコングディング (paichongding)、ピフルブミド、ピリダリ
ル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロ
ール (tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (tetra
chlorantraniliprole)、チオキサザフェン、トリフルメゾピリム、
および、ヨードメタン；ならびに、さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus
firmus) に基づく調製物 (I-1582, BioNeem, Votivo)、
および、以下の活性化化合物： 1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-
トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-
1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (WO2006/043635 から既知)、{1
'- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル] -5-フル
オロスピロ [インドール-3, 4'-ピペリジン] -1 (2H)-イル} (2-クロロピ
リジン-4-イル) メタノン (WO2003/106457 から既知)、2-クロロ-N
- [2- {1- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル]
ピペリジン-4-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO2006/003494 から既知)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -4-ヒド
ロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカー-3-エン-2-オン (WO2009/049851 から既知)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -8-メトキ
シ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカー-3-エン-4-イルエチルカル
ボネート (WO2009/049851 から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオ
キシ) -6- (3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル) -5-フルオロピリミジン (WO2004/099160 から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) -6-
(3-クロロフェニル) ピリミジン (WO2003/076415 から既知)、PF13
64 (CAS Reg. No. 1204776-60-2)、2- [2- ({ [3-プロ
モ-1- (3-クロロピリジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル
} アミノ) -5-クロロ-3-メチルベンゾイル] -2-メチルヒドラジンカルボン酸メ
チル (WO2005/085216 から既知)、2- [2- ({ [3-プロモ-1- (3-
クロロピリジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミノ) -
5-シアノ-3-メチルベンゾイル] -2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO2
005/085216 から既知)、2- [2- ({ [3-プロモ-1- (3-クロロピリ
ジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミノ) -5-シアノ-
3-メチルベンゾイル] -2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO2005/08
5216 から既知)、2- [3, 5-ジブromo-2- ({ [3-プロモ-1- (3-クロ
ロピリジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミノ) ベンゾイ

10

20

30

40

50

ル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 1 0 2 0 5 7 9 2 5 から既知)、8 - クロロ - N - [(2 - クロロ - 5 - メトキシフェニル) スルホニル] - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2 0 1 0 / 1 2 9 5 0 0 から既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル) ベンズアミド (WO 2 0 0 9 / 0 8 0 2 5 0 から既知)、N - [(2 E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1 H) - イリデン] - 2, 2, - 3 - トリフルオロアセトアミド (WO 2 0 1 2 / 0 2 9 6 7 2 から既知)、1 - [(2 - クロロ - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2 0 0 9 / 0 9 9 9 2 9 から既知)、1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2 0 0 9 / 0 9 9 9 2 9 から既知)、4 - (3 - {2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] フェノキシ} プロポキシ) - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリミジン (CN 1 0 1 3 3 7 9 4 0 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2 0 0 8 / 1 3 4 9 6 9 から既知)、3 - [ベンゾイル (メチル) アミノ] - N - [2 - ブロモ - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] - 6 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2 - フルオロベンズアミド (WO 2 0 1 0 0 1 8 7 1 4 から既知)、[2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 3 - オキソ - 4 - オキサスピロ [4. 5] デカー - 1 - エン - 1 - イル] 炭酸ブチル (CN 1 0 2 0 6 0 8 1 8 から既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソオキサゾール - 3 - イル] - N - [(Z) - メトキシイミノメチル] - 2 - メチルベンズアミド (WO 2 0 0 7 / 0 2 6 9 6 5 から既知)、(3 E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO 2 0 1 3 / 1 4 4 2 1 3 から既知)、N - (メチルスルホニル) - 6 - [2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2 0 1 2 / 0 0 0 8 9 6 から既知)、N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2 0 1 0 / 0 5 1 9 2 6 から既知)。

【0302】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、または、インターネット上に記載されている（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。

【0303】

クラス (1) ~ (15) に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、適切な官能基が存在している場合には、対応する塩基または酸と塩を形成し得る。さらに、クラス (1) ~ (15) に記載されている殺菌剤混合成分は、互変異性が可能である場合には、互変異性体形態も包含する。

【0304】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1. 01) アルジモルフ、(1. 02) アザコナゾール、(1. 03) ビテルタノール、(1. 04) ブロムコナゾール、(1. 05) シプロコナゾール、(1. 06) ジクロブトラゾール、(1. 07) ジフ

10

20

30

40

50

エノコナゾール、(1. 08) ジニコナゾール、(1. 09) ジニコナゾール-M、(1. 10) ドデモルフ、(1. 11) 酢酸ドデモルフ、(1. 12) エポキシコナゾール、
 (1. 13) エタコナゾール、(1. 14) フェナリモール、(1. 15) フェンブコナ
 ザール、(1. 16) フェンヘキサミド、(1. 17) フェンプロピジン、(1. 18)
 フェンプロピモルフ、(1. 19) フルキンコナゾール、(1. 20) フルルプリミドール、
 (1. 21) フルシラゾール、(1. 22) フルトリアホール、(1. 23) フルコ
 ナゾール、(1. 24) フルコナゾール-シス、(1. 25) ヘキサコナゾール、(1.
 26) イマザリル、(1. 27) 硫酸イマザリル、(1. 28) イミベンコナゾール、(
 1. 29) イブコナゾール、(1. 30) メトコナゾール、(1. 31) ミクロブタニル
 、(1. 32) ナフチフィン、(1. 33) ヌアリモール、(1. 34) オキシポコナゾール、
 (1. 35) パクロブトラゾール、(1. 36) ペフラゾエート、(1. 37) ペ
 ンコナゾール、(1. 38) ピペラリン、(1. 39) プロクロラズ、(1. 40) プロ
 ピコナゾール、(1. 41) プロチオコナゾール、(1. 42) ピリブチカルブ、(1.
 43) ピリフェノックス、(1. 44) キンコナゾール、(1. 45) シメコナゾール、
 (1. 46) スピロキサミン、(1. 47) テブコナゾール、(1. 48) テルビナフィ
 ン、(1. 49) テトラコナゾール、(1. 50) トリアジメホン、(1. 51) トリア
 ジメノール、(1. 52) トリデモルフ、(1. 53) トリフルミゾール、(1. 54)
 トリホリン、(1. 55) トリチコナゾール、(1. 56) ウニコナゾール、(1. 57)
 ウニコナゾール-p、(1. 58) ビニコナゾール、(1. 59) ポリコナゾール、(
 1. 60) 1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-
 イル)シクロヘプタノール、(1. 61) 1-(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ
 1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、(
 1. 62) N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリ
 ル)プロポキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1. 6
 3) N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-
 [3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミド、(1. 64)
 O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イル] 1H-
 イミダゾール-1-カルボチオエート、(1. 65) ピリソキサゾール、(1. 66) 2
 -{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-
 2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン
 、(1. 67) 1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)
 オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオ
 シアネート、(1. 68) 5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェ
 ニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-
 1, 2, 4-トリアゾール、(1. 69) 2-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5
 -ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H
 -1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 70) 2-{[rel(2R, 3S)
 -3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-
 イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(
 1. 71) 2-{[rel(2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-
 ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1
 , 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 72) 1-{[rel(2R, 3S)-3
 -(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル
]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 73)
 1-{[rel(2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオ
 ロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-
 イルチオシアネート、(1. 74) 5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R
 , 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラ
 ン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1. 75) 5-(アリル
 スルファニル)-1-{[rel(2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(

10

20

30

40

50

2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1. 76) 2-[(2S, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 77) 2-[(2R, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 78) 2-[(2R, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 79) 2-[(2S, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 80) 2-[(2S, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 81) 2-[(2R, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 82) 2-[(2R, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 83) 2-[(2S, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 84) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1. 85) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 86) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール、(1. 87) 2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 88) 2-[2-クロロ-4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1. 89) (2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 90) (2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 91) (2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 92) (2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1. 93) (1S, 2R, 5R)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1. 94) (1R, 2S, 5S)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1. 95) 5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール。

【0305】

(2) 複合体 I または複合体 II における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2. 01) ビキサフェン、(2. 02) ボスカリド、(2. 03) カルボキシシ、(2. 04) ジフルメトリム、(2. 05) フェンフラム、(2. 06) フルオピラム、(2. 07) フルトラニル、(2. 08) フルキサピロキサド、(2. 09) フラメトピル、(2. 10) フ

10

20

30

40

50

ルメシクロックス、(2. 11) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 (1 R S, 4 S R, 9 R S) とアンチ-エピマー性ラセミ化合物 (1 R S, 4 S R, 9 S R) の混合物)、(2. 12) イソピラザム (アンチ-エピマー性ラセミ化合物 1 R S、4 S R、9 S R)、(2. 13) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1 R, 4 S, 9 S)、(2. 14) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1 S, 4 R, 9 R)、(2. 15) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 1 R S, 4 S R, 9 R S)、(2. 16) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1 R, 4 S, 9 R)、(2. 17) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1 S, 4 R, 9 S)、(2. 18) メプロニル、(2. 19) オキシカルボキシ、(2. 20) ペンフルフェン、(2. 21) ペンチオピラド、(2. 22) セダキサン、(2. 23) チフルザミド、(2. 24) 1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 25) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 26) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4-フルオロ-2-(1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロポキシ)フェニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 27) N-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 28) 5, 8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2. 29) ベンゾビンジフルピル、(2. 30) N-[(1 S, 4 R)-9-(ジクロロメチレン)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタリン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 31) N-[(1 R, 4 S)-9-(ジクロロメチレン)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタリン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 32) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 33) 1, 3, 5-トリメチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 34) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 35) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3 R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 36) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3 S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 37) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3 S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 38) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3 R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 39) 1, 3, 5-トリメチル-N-[(3 R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 40) 1, 3, 5-トリメチル-N-[(3 S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 41) ベノダニル、(2. 42) 2-クロロ-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(2. 43) イソフエタミド、(2. 44) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 45) N-(4'-クロロビフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4

10

20

30

40

50

ーカルボキサミド、(2. 46) N-(2', 4'-ジクロロビフェニル-2-イル)-
 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.
 47) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)
 ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 48) N-(
 2', 5'-ジフルオロビフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 49) 3-(ジフルオロメチル)-
 1-メチル-N-[4'-(プロパー-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 50) 5-フルオロ-1, 3-ジメチル
 -N-[4'-(プロパー-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(2. 51) 2-クロロ-N-[4'-(プロパー-1-イン
 -1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(2. 52) 3-(ジフルオロメ
 チル)-N-[4'-(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イ
 ル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 53) N-[4'
 -(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-5-フルオ
 ロ-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 54) 3-(ジ
 フルオロメチル)-N-(4'-エチニルビフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 55) N-(4'-エチニルビフェニル-2-
 イル)-5-フルオロ-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(
 2. 56) 2-クロロ-N-(4'-エチニルビフェニル-2-イル)ニコチンアミド、
 (2. 57) 2-クロロ-N-[4'-(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル) 20
 ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(2. 58) 4-(ジフルオロメチル)-2-
 メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1, 3-チアゾ
 ール-5-カルボキサミド、(2. 59) 5-フルオロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ
 -3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 60) 2-クロロ-N-[4'-(3-
 ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンア
 ミド、(2. 61) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチ
 ルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール
 -4-カルボキサミド、(2. 62) 5-フルオロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-
 メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-1H- 30
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 63) 2-クロロ-N-[4'-(3-メトキシ
 -3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(
 2. 64) 1, 3-ジメチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-
 インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 65) 1, 3-
 ジメチル-N-[(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-イン
 デン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 66) 1, 3-ジメ
 チル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-
 4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 67) 3-(ジフルオロメ
 チル)-N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)プロ
 パン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 68) 3-(ジフ 40
 ルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1
 H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.
 69) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1, 1, 3-トリ
 メチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(2. 70) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-
 フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]
 -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド。

【0306】

(3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3. 01) アメトクトラジ
 ン、(3. 02) アミスルブロム、(3. 03) アゾキシストロビン、(3. 04) シア 50

ゾファミド、(3.05) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.06) クモキシストロビン、(3.07) ジモキシストロビン、(3.08) エノキサストロビン、(3.09) ファモキサドン、(3.10) フェンアミドン、(3.11) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3.12) フルオキサストロビン、(3.13) クレソキシムーメチル、(3.14) メトミノストロビン、(3.15) オリサストロビン、(3.16) ピコキシストロビン、(3.17) ピラクロストロビン、(3.18) ピラメストロビン、(3.19) ピラオキシストロビン、(3.20) ピリベンカルブ、(3.21) トリクロピリカルブ、(3.22) トリフロキシストロビン、(3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル] オキシ} フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.24) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)アセトアミド、(3.25) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル}フェニル}アセトアミド、(3.26) (2E)-2-{2-[({ [(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル] オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ} オキシ)メチル}フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.27) フェナミノストロビン (fenaminostrobin)、(3.28) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.29) (2E)-2-{2-[({シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル}フェニル}-3-メトキシアクリル酸メチルエステル、(3.30) N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.31) 2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル}フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.32) 2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル}フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.33) (2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンター-3-エンアミド。

【0307】

(4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.01) ベノミル、(4.02) カルベンダジム、(4.03) クロルフエナゾール、(4.04) ジエトフェンカルブ、(4.05) エタボキサム、(4.06) フルオピコリド、(4.07) フベリダゾール、(4.08) ペンシクロン、(4.09) チアベンダゾール、(4.10) チオファネート-メチル、(4.11) チオファネート、(4.12) ゾキサミド、(4.13) 5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、(4.14) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン。

【0308】

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.01) ボルドー液、(5.02) カプタホール、(5.03) キャプタン、(5.04) クロロタロニル、(5.05) 水酸化銅、(5.06) ナフテン酸銅、(5.07) 酸化銅、(5.08) 塩基性塩化銅、(5.09) 硫酸銅(2+)、(5.10) ジクロフルアニド、(5.11) ジチアノン、(5.12) ドジン、(5.13) ドジン遊離塩基、(5.14) ファーバム、(5.15) フルオロホルベット、(5.16) ホルベット、(5.17) グアザチン、(5.18) 酢酸グアザチン、(5.19) イミノクタジン、(5.20) イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21) イミノクタジン三酢酸塩、(5.22) マンカップパー、(5.23) マンゼブ、(5.24) マンネブ、(5.25) メチラム、(5.26) メチラム

10

20

30

40

50

亜鉛 (metiram zinc)、(5.27) オキシ銅、(5.28) プロパミジン (propamidine)、(5.29) プロピネブ、(5.30) 硫黄および硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.31) チウラム、(5.32) トリルフルアニド、(5.33) ジネブ、(5.34) ジラム、(5.35) アニラジン。

【0309】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.01) アシベンゾラルーS-メチル、(6.02) イソチアニル、(6.03) プロベナゾール、(6.04) チアジニル、(6.05) ラミナリン (laminarin)。

【0310】

(7) アミノ酸および／またはタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.01) アンドプリム (andoprim)、(7.02) プラストサイジン-S、(7.03) シプロジニル、(7.04) カスガマイシン、(7.05) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.06) メパニピリム、(7.07) ピリメタニル、(7.08) 3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、(7.09) オキシテトラサイクリン、(7.10) ストレプトマイシン。

【0311】

(8) ATP 産生の阻害薬、例えば、(8.01) 酢酸トリフェニルスズ、(8.02) 塩化トリフェニルスズ、(8.03) 水酸化トリフェニルスズ、(8.04) シルチオフアム。

【0312】

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.01) ベンチアバリカルブ、(9.02) ジメトモルフ、(9.03) フルモルフ、(9.04) イプロバリカルブ、(9.05) マンジプロパミド、(9.06) ポリオキシソリム、(9.07) ポリオキシソリム、(9.08) バリダマイシン、(9.09) バリフェナレート、(9.10) ポリオキシソリムB、(9.11) (2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロパー-2-エン-1-オン、(9.12) (2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロパー-2-エン-1-オン。

【0313】

(10) 脂質および膜の合成の阻害薬、例えば、(10.01) ビフェニル、(10.02) クロロネブ、(10.03) ジクロラン、(10.04) エジフェンホス、(10.05) エトリジアゾール、(10.06) ヨードカルブ (iodocarb)、(10.07) イプロベンホス、(10.08) イソプロチオラン、(10.09) プロパモカルブ、(10.10) プロパモカルブ塩酸塩、(10.11) プロチオカルブ、(10.12) ピラゾホス、(10.13) キントゼン、(10.14) テクナゼン、(10.15) トルクロホス-メチル。

【0314】

(11) メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.01) カルプロパミド、(11.02) ジクロシメット、(11.03) フェノキサニル、(11.04) フタリド、(11.05) ピロキロン、(11.06) トリシクラゾール、(11.07) {3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル) アミノ] ブタン-2-イル} カルバミン酸 2, 2, 2-トリフルオロエチル。

【0315】

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.01) ベナラキシル、(12.02) ベナラキシルーM (キララキシル (kiralaxy l))、(12.03) ブピリメート、(12.04) クロジラコン、(12.05) ジメチリモール、(12.06) エチリモール、(12.07) フララキシル、(12.08) ヒメキサゾール、(12.09) メタラキシル、(12.10) メタラキシルーM (メフェノキサム)、(12.11) オフラセ、(12.12) オキサジキシル、(12.13) オキソリン酸、(12.14) オクチリノン。

10

20

30

40

50

【0316】

(13) シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.01) クロゾリネート、(13.02) フェンピクロニル、(13.03) フルジオキソニル、(13.04) イプロジオン、(13.05) プロシミドン、(13.06) キノキシフェン、(13.07) ビンクロゾリン、(13.08) プロキナジド。

【0317】

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.01) ビナパクリル、(14.02) ジノカップ、(14.03) フェリムゾン、(14.04) フルアジナム、(14.05) メプチルジノカップ。

【0318】

(15) さらなる化合物、例えば、(15.001) ベンチアゾール、(15.002) ベトキサジン、(15.003) カプシマイシン (capsimycin)、(15.004) カルボン、(15.005) キノメチオネート、(15.006) ピリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15.007) クフラネブ、(15.008) シフルフェナミド、(15.009) シモキサニル、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) ダゾメット、(15.012) デバカルブ、(15.013) ジクロロフェン、(15.014) ジクロメジン、(15.015) ジフェンゾコート、(15.016) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15.017) ジフェニルアミン、(15.018) エコメイト、(15.019) フェンピラザミン、(15.020) フルメトベル、(15.021) フルオルイミド、(15.022) フルスルファミド、(15.023) フルチアニル、(15.024) ホセチルーアルミニウム、(15.025) ホセチルーカルシウム、(15.026) ホセチルーナトリウム、(15.027) ヘキサクロロベンゼン、(15.028) イルママイシン、(15.029) メタスルホカルブ、(15.030) イソチオシアン酸メチル、(15.031) メトラフェノン、(15.032) ミルディオマイシン、(15.033) ナタマイシン、(15.034) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.035) ニトロタルーイソプロピル、(15.036) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15.037) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15.038) ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.039) フェノトリン、(15.040) 亜リン酸およびその塩、(15.041) プロパモカルブーホセチレート (propamocarb-fosetate)、(15.042) プロパノシンーナトリウム (propanosin-sodium)、(15.043) ピリモルフ、(15.044) ピロールニトリン、(15.045) テブフロキン、(15.046) テクロフタラム、(15.047) トルニファニド、(15.048) トリアゾキシド、(15.049) トリクラミド、(15.050) ザリラミド、(15.051) 2-メチルプロパン酸 (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル)カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イルエステル、(15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.054) オキサチアピプロリン、(15.055) 1H-イミダゾール-1-カルボン酸 1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イルエステル、(15.056) 2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.057) 2,3-ジブチル-6-クロロチエノ[2,3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15.058) 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6

10

20

30

40

50

H) -テトロン、(15.059) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1
H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5R)-5-フェニル-4, 5-ジ
ヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジ
ン-1-イル) エタノン、(15.060) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチ
ル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5S)-5-フェニル-4
, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}
ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.061) 2-[5-メチル-3-(トリフル
オロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-{4-[4-(5-フェニル-4,
5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル)-1, 3-チアゾール-2-イル] ピ
ペリジン-1-イル} エタノン、(15.062) 2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロ
ピル-4H-クロメン-4-オン、(15.063) 2-クロロ-5-[2-クロロ-1
-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H-イミダゾール-
5-イル] ピリジン、(15.064) 2-フェニルフェノールおよび塩、(15.06
5) 3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリ
ン-1-イル) キノリン、(15.066) 3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-
ジカルボン酸ニトリル、(15.067) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4
-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(15.068) 4-(4
-クロロフェニル)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3, 6-ジメチルピリダジ
ン、(15.069) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15
.070) 5-クロロ-N'-フェニル-N'- (プロパー-2-イン-1-イル) チオフ
ェン-2-スルホノヒドラジド、(15.071) 5-フルオロ-2-[(4-フルオロ
ベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15.072) 5-フルオロ-2-[(4
-メチルベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15.073) 5-メチル-
6-オクチル [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-アミン、(15
.074) (2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチルエステル
、(15.075) N'-(4-{ [3-(4-クロロベンジル)-1, 2, 4-チアジ
アゾール-5-イル] オキシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチル
イミドホルムアミド、(15.076) N-(4-クロロベンジル)-3-[3-メトキシ
-4-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.0
77) N-[(4-クロロフェニル) (シアノ) メチル]-3-[3-メトキシ-4-(
プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.078) N-
[(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル) メチル]-2, 4-ジクロロニコチン
アミド、(15.079) N-[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル) エ
チル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15.080) N-[1-(5-ブロモ-
3-クロロピリジン-2-イル) エチル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、
(15.081) N-{ (E)-[(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフル
オロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル] メチル}-2-フェニルアセトアミド、
(15.082) N-{ (Z)-[(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフル
オロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル] メチル}-2-フェニルアセトアミド、
(15.083) N'-{4-[(3-tert-ブチル-4-シアノ-1, 2-チアゾ
ール-5-イル) オキシ]-2-クロロ-5-メチルフェニル}-N-エチル-N-メチ
ルイミドホルムアミド、(15.084) N-メチル-2-(1-{ [5-メチル-3-
(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イ
ル)-N-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-イル)-1, 3-チアゾ
ール-4-カルボキサミド、(15.085) N-メチル-2-(1-{ [5-メチル-3-
(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-
イル)-N-[(1R)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-イル]-1,
3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15.086) N-メチル-2-(1-{ [5
-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペ
リジン-4-イル)-N-[(1S)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-

10

20

30

40

50

イル] - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15.087) {6-[({[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸ベンチルエステル、(15.088) フェナジン-1-カルボン酸、(15.089) キノリン-8-オール、(15.090) キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15.091) {6-[({[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステル、(15.092) (5-ブロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン、(15.093) N-[2-(4-{[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メトキシフェニル)エチル]-N2-(メチルスルホニル)バリンアミド、(15.094) 4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.095) {6-[({[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸ブタ-3-イン-1-イルエステル、(15.096) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性体形態: 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15.097) 3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸プロピルエステル、(15.098) [3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.099) (S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.100) (R)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15.101) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(15.102) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15.103) 2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15.104) 3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.105) アブシジン酸、(15.106) N'-[5-ブロモ-6-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.107) N'-{5-ブロモ-6-[1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.108) N'-{5-ブロモ-6-[(1R)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.109) N'-{5-ブロモ-6-[(1S)-1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.110) N'-{5-ブロモ-6-[(シス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.111) N'-{5-ブロモ-6-[(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.112) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.113) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.114) N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.115) N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-

10

20

30

40

50

カルボキサミド、(15. 116) N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 117) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-フルオロベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 118) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(5-フルオロ-2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 119) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-フルオロベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 120) N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 121) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 122) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-メチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 123) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 124) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-メチルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 125) N-(2-tert-butyl-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 126) N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 127) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 128) N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 129) N-[3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 130) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-4, 5-ジメチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 131) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド、(15. 132) N'-(2, 5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 133) N'-{4-[(4, 5-ジクロロ-1, 3-チアゾール-2-イル)オキシ]-2, 5-ジメチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 134) N-(4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 135) 9-フルオロ-2, 2-ジメチル-5-(キノリン-3-イル)-2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾオキサアゼピン、(15. 136) 2-{2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]フェニル}プロパン-2-オール、(15. 137) 2-{2-[(7, 8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]-6-フルオロフェニル}プロパン-2-オール、(15. 138) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 139) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 140) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェ

10

20

30

40

50

ニル) - 1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 141) 4-(2-
 ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,
 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 142) N-(2-ブロモ-6-
 フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル
 -1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 143) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェ
 ニル)-N-(2-ブロモフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-ア
 ミン、(15. 144) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモ
 -6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15
 . 145) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-
 1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 146) N-(2-ブロモ
 フェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピ
 ラゾール-5-アミン、(15. 147) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-
 N-(2-クロロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(1
 5. 148) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェ
 ニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 149) 4-(
 2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチ
 ル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15. 150) N'-(4-{3-[(ジフルオ
 ロメチル) スルファニル] フェノキシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N
 -メチルイミドホルミアミド、(15. 151) N'-(2, 5-ジメチル-4-{3-
 [(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ} フェニル)-
 N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 152) N'-(2, 5-ジメチ
 ル-4-{3-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ} フェ
 ニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 153) N'-(2, 5-
 ジメチル-4-{3-[(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピル) スルファニル]
 フェノキシ} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 154
) N'-(2, 5-ジメチル-4-{3-[(ペンタフルオロエチル) スルファニル] フ
 ェノキシ} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 155)
 N'-(4-{ [3-(ジフルオロメトキシ) フェニル] スルファニル}-2, 5-ジメ
 チルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15. 156) N'-(
 2, 5-ジメチル-4-{ [3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニ
 ル] スルファニル} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.
 157) N'-(2, 5-ジメチル-4-{ [3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)
) フェニル] スルファニル} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、
 (15. 158) N'-(2, 5-ジメチル-4-{ [3-(2, 2, 3, 3-テトラフル
 オロプロポキシ) フェニル] スルファニル} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミ
 ドホルミアミド、(15. 159) N'-(2, 5-ジメチル-4-{ [3-(ペンタフル
 オロエトキシ) フェニル] スルファニル} フェニル)-N-エチル-N-メチルイミド
 ホルミアミド、(15. 160) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラ
 ザール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)
 フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チア
 ザール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 161) 2-[3, 5-
 ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[
 2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル]-4, 5-ジヒド
 ロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-
 1-イル] エタノン、(15. 162) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-
 ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパー-2-
 イン-1-イルオキシ) フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イ
 ル}-1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 16
 3) 2-{3-[2-(1-{ [3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール
 -1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル)-1, 3-チアゾール-4-イル]-4

, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 164) 2- {3- [2- (1- { [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) -1, 3-チアゾール-4-イル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} -3-クロロフェニルメタ
 ンスルホネート、(15. 165) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5S) -5- [2- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 166) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5R) -5- [2- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 167) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5S) -5- [2-フルオロ-6- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エ
 タノン、(15. 168) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5R) -5- [2-フルオロ-6- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エ
 タノン、(15. 169) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5S) -5- [2-クロロ-6- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 170) 2- [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] -1- [4- (4- { (5R) -5- [2-クロロ-6- (プロパー-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} -1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 171) 2- { (5S) -3- [2- (1- { [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) -1, 3-チアゾール-4-イル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 172) 2- { (5R) -3- [2- (1- { [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) -1, 3-チアゾール-4-イル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 173) 2- { (5S) -3- [2- (1- { [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) -1, 3-チアゾール-4-イル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} -3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15. 174) 2- { (5R) -3- [2- (1- { [3, 5-ビス (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) -1, 3-チアゾール-4-イル] -4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} -3-クロロフェニルメタンスルホネート。

【0319】

混合成分としての生物学的有害生物防除剤

式 (I) の化合物は、生物学的有害生物防除剤と組み合わせることができる。

【0320】

生物学的有害生物防除剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物および微生物によって形成される生成物 (例えば、タンパク質または二次代謝産物) などがある。

【0321】

生物学的有害生物防除剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌および生物学的殺虫剤、殺菌剤または殺線虫剤として作用する細菌などがあ

10

20

30

40

50

る。

【0322】

生物学的有害生物防除剤として使用されているかまたは使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンシス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 株 FZB42 (DSM 231179)、または、バシルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス (*B. cereus*) 株 C NCM I-1562、または、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I-1582 (受託番号 CNCM I-1582)、または、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 GB34 (受託番号 ATCC 700814) および株 QST2808 (受託番号 NRRL B-30087)、または、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に、株 GB03 (受託番号 ATCC SD-1397)、または、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) 株 QST713 (受託番号 NRRL B-21661)、または、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) 株 OST 30002 (受託番号 NRRL B-50421)、バシルス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 イスラエレンシス (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (抗原型 H-14) 株 AM65-52 (受託番号 ATCC 1276)、または、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 アイザワイ (*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株 ABTS-1857 (SD-1372)、または、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 クルスタキ (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 株 HD-1、または、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 テネブリオニス (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 株 NB 176 (SD-5428)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria spp.*) (ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (= QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232)。

【0323】

生物学的有害生物防除剤として使用されているかまたは使用することが可能な菌類および酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (新：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 または株 Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550)、タラロミセ

ス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株V117b、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*T. harzianum rifai*) T39 (受託番号 CNCM I-952)。

【0324】

生物学的有害生物防除剤として使用されているかまたは使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリガ (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0325】

植物または植物の部分または植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定に特性によって植物の成長および植物の健康を増進する細菌類および菌類も、同様に包含される。例としては、以下のものを挙げることができる：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) またはギガスポラ・モノスポルム (*Gigaspora monosporum*)、グロムス属種 (*Glomus* spp.)、ラッカリア属種 (*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ (*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種 (*Paraglomus* spp.)、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、プセウドモナス属種 (*Pseudomonas* spp.)、リゾビウム属種 (*Rhizobium* spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ (*Rhizobium trifolii*)、リゾポゴン属種 (*Rhizopogon* spp.)、スクレロデルマ属種 (*Scleroderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)、ストレプトミセス (*Streptomyces* spp.)。

【0326】

生物学的有害生物防除剤として使用されているかまたは使用することが可能な、植物抽出物および微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質および二次代謝産物を包含する) の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (azadirachtin)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サボニン抽出物)、除虫菊 (*Pyrethrum*/Pyrethrins)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Rega

10

20

30

40

50

lia、「RequiemTM Insecticide」、ロテノン、リアニア／リアノジン、ヒレハリソウ (Symphytum officinale)、ヨモギギク (Tanacetum vulgare)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (Tropaeolum majus)、セイヨウイラクサ (Urtica dioica)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (Viscum album)、アブラナ科 (Brassicaceae) 抽出物、特に、ナタネ粉末またはカラシナ粉末。

【0327】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) の化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット (ーメキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (ーエチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (ーエチル)、メフェンピル (ージエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2ーメトキシーNー ({ 4ー [(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4ー (ジクロロアセチル)ー1ーオキサー4ーアザスピロ [4. 5] デカン (CAS 71526-07-3)、2, 2, 5ートリメチルー3ー (ジクロロアセチル)ー1, 3ーオキサゾリジン (CAS 52836-31-4) などと組み合わせることができる。

【0328】

植物および植物の部分

本発明に従って、全ての植物および植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物 (天然に発生している作物植物を包含する) のような全ての植物および植物個体群、例えば、穀類 (コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、ピーマンおよびトウガラシ、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ハウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物 (Brassica oleracea) (例えば、キャベツ)、エンドウマメおよび他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、ならびに、さらに、果実植物 (果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実を有するものおよびブドウの木) などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、または、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、または、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種または保護され得ない植物品種も包含される。植物は、植物の全ての成育段階、例えば、種子、挿穂 (cutting)、および、幼植物 (未成熟植物) から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花および根などの、植物の地上部および地下部の全ての部分および器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、ならびに、さらに、根、塊茎および根茎などである。収穫物 (収穫された植物または植物の部分)、ならびに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) および生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) および種子なども、植物の部分に包含される。

【0329】

式 (I) の化合物を用いた植物および植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧 (fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、または、該化合物を植物および植物の部分の周囲、生息環境もしくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

【0330】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物およびそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種および植物品種、または、交雑もしくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種および植物品種、ならびに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的的方法により得られたトランスジェニック植物および植物品種（遺伝子組換え生物）およびそれらの部分を処理する。「部分（parts）」または「植物の部分（parts of plants）」または「植物の部分（plant parts）」という用語については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種または使用されている慣習的な植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種または突然変異誘発または組換えDNA技術によって栽培された、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型または遺伝子型であることができる。

10

【0331】

トランスジェニック植物、種子処理、および、統合イベント（integration events）

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物または植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温または低温に対する向上した耐性、渇水または水中もしくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質および／または向上した栄養価、収穫された生産物の向上した貯蔵性および／または改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫および有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類およびカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する遺伝物質〔例えば、遺伝子CryIA（a）、CryIA（b）、CryIA（c）、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIFならびにそれらの組合せ〕によって植物体内で形成された毒素による、害虫および有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類およびカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類および／またはウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子ならびに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質および毒素による、植物病原性の菌類、細菌類および／またはウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、および、さらに、特定の除草活性化化合物（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート類またはホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメおよび他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、ならびに、さらに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実およびブドウを有するもの）などを挙げることができる。トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコおよびナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類ならびにナメクジ類およびカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

20

30

40

【0332】

作物保護－処理の種類

50

植物および植物の部分は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（spreading-on）、注入、灌水（灌注（drenching））、点滴灌漑などによって、式（I）の化合物で直接的に処理するか、または、該化合物を植物および植物の部分の周囲、生息環境もしくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官（propagation material）の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理によっても処理し、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式（I）の化合物を微量散布法（ultra-low volume method）によって施用することも可能であり、または、該施用形態もしくは式（I）の化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

10

【0333】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式（I）の化合物を茎葉部に施用し、その際、処理頻度および施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

【0334】

浸透移行性活性化合物の場合、式（I）の化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式（I）の化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注（drenching）によって、または、土壌もしくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所（例えば、土壌、または、水耕系）に式（I）の化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、または、土壌施用〔即ち、式（I）の化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の成育場所に導入する〕ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）の化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

20

【0335】

種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理においては、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が生じる。かくして、植物の貯蔵中、播種後または出芽後に有害生物防除剤を追加で施用することを不要とするかまたは少なくとも著しく低減させるような、種子および発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性成分によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子および発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性成分の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、有害生物防除剤に対する最小限の費用で、種子および発芽中の植物の最適な保護を達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物または害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性または殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

30

【0336】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子および発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式（I）の化合物のうちの1種類で処理することによる。種子および発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式（I）の化合物と混合成分によって、1回の操作で同時にまたは順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）の化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

40

【0337】

本発明は、さらに、種子およびその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式（I）の化合物の使用にも関する。

【0338】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、式（I）の化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）の化合物と混合成分によって同時に処理され

50

た種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）の化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（I）の化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）の化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（I）の化合物と混合成分が被膜の一部としてまたは被膜に加えられたさらなる1つの層もしくは複数の層として施用されている種子にも関する。

【0339】

本発明は、さらに、式（I）の化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

10

【0340】

式（I）の浸透移行的に作用する化合物における有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時または播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0341】

別の有利な点は、式（I）の化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽および出芽が増進され得るということである。

【0342】

式（I）の化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

20

【0343】

さらに、式（I）の化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、それによって、共生生物（例えば、根粒菌、菌根菌および／または内部寄生性の細菌もしくは菌類）によるコロニー形成が良好になり、および／または、窒素固定が最適化される。

【0344】

式（I）の化合物は、農業において、温室内で、森林でまたは園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワおよびエンバク）、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート（例えば、テンサイおよび飼料用ビート）、ラッカセイ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギおよびレタス）、果実植物、芝生および観賞植物の種子を包含する。穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギおよびエンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネおよびイネの種子を処理することは、特に重要である。

30

【0345】

既に上記で記載したように、式（I）の化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド（特に、殺虫特性および／または殺線虫特性を有するポリペプチド）の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、この場合、バシルス（*Bacillus*）種、リゾビウム（*Rhizobium*）種、プセウドモナス（*Pseudomonas*）種、セラチア（*Serratia*）種、トリコデルマ（*Trichoderma*）種、クラビバクテル（*Clavibacter*）種、グロムス（*Glomus*）種またはグリオクラジウム（*Gliocladium*）種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種（*Bacillus* sp.）に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する。

40

【0346】

本発明に関連して、式（I）の化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましく

50

は、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛または果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、および、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階（鳩胸段階）に達するまで水中で予め膨潤させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が改善され、および、出芽がより均一になる。

【0347】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、または、種子から生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式（I）の化合物の量および／またはさらなる添加剤の量を選択することに、概して注意しなければならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合に、確実に実施しなければならない。

【0348】

一般に、式（I）の化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤およびプロセスは、当業者には知られている。

【0349】

式（I）の化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤または種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、および、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0350】

これらの製剤は、既知方法で、式（I）の化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、および、さらに、溶媒または希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、および、さらに、水と混合させることによって、調製する。

【0351】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料または水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C. I. Pigment Red 112」および「C. I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げることができる。

【0352】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネートまたはジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用することができる。

【0353】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる適切な分散剤および／または乳化剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性およびカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性もしくはアニオン性の分散剤または非イオン性もしくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することができる。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類およびトリスチルフェノールポリグリコールエーテル類、ならびに、それらのリン酸化誘導体または硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類およびアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0354】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリ

10

20

30

40

50

コーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0355】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

【0356】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレーおよび微粉化シリカなどを挙げることができる。

10

【0357】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースなどを挙げることができる。

【0358】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3(=ジベレリン酸)、ジベレリンA4およびジベレリンA7である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている(c f. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

20

【0359】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、または、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤(concentrate)または水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバクおよびライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、ならびに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズおよびビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、または、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤またはそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

30

【0360】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤またはその種子粉衣製剤から調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機(これは、バッチ式または連続的に作動される)の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのまま添加するかまたは予め水で希釈したあとで添加すること、および、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

40

【0361】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の式(I)の化合物の特定の含有量および当該種子に左右される。式(I)の化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

【0362】

動物衛生

50

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式（I）の化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物または内部寄生生物に対して、活性を示す。「内部寄生生物」という用語は、特に、蠕虫類および原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、典型的には、および、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類およびダニ類である。

【0363】

獣医学の分野において、内温動物に対する毒性が好ましい程度である式（I）の化合物は、動物育種および畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物および家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。それらは、該寄生生物の全ての発育段階または特定の発育段階に対して有効である。

10

【0364】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、ならびに、特に、ウシおよびブタ；家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、および、特に、ニワトリ；魚類および甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類および甲殻類の動物；および、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0365】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テングネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、および、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、または、水槽の魚。

20

【0366】

好ましい実施形態では、式（I）の化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0367】

好ましい別の実施形態では、式（I）の化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、および、特に、家禽類に対して、投与される。

【0368】

動物寄生生物を防除するために式（I）の化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減または予防すること、および、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減または予防することが意図され、その結果、より経済で且つより容易な畜産業が可能となり、および、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

30

【0369】

動物衛生の分野に関連して、「防除する（control）」または「防除する（controlling）」という用語は、式（I）の化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式（I）の化合物が、個々の寄生生物を殺すことが可能であること、その成長を阻害することが可能であること、または、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0370】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

40

アノプルリダ目（Anoplurida）の、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、プチルス属種（Phtirus spp.）、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；マロファギダ目（Mallophagida）ならびにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）およびイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）の、例えば、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケント

50

ロン属種 (*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属種 (*Damalina* spp.)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.)、フェリコラ属種 (*Felicola* spp.)； 双翅目 (*Diptera*) ならびにネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) およびブラキセリナ亜目 (*Brachycerina*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、エウシムリウム属種 (*Eusimulium* spp.)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、オダグミア属種 (*Odagmia* spp.)、ウィルヘルミア属種 (*Wilhelmia* spp.)、ヒボミトラ属種 (*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種 (*Atylotus* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、フィリポミイア属種 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属種 (*Braula* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア属種 (*Haematobia* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、グロシナ属種 (*Glossina* spp.)、カリホラ属種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、クリソミイア属種 (*Chrysomyia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)； ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、プレキス属種 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属種 (*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)；

ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロングイルス属種 (*Panstrongylus* spp.)； ならびに、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫および衛生害虫。

【0371】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げることができる：

ダニ亜綱 (*Acar* (*Acarina*)) およびメタスチグマタ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、イクソデス属種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属)； メソスチグマタ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニسس属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニسس属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニسس属種 (*Pn*

eumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、プネウモニスス属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)、アカラピス属種 (Acarapis spp.)；アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデキス属種 (Demodex spp.)、trombicula 属種 (Trombicula spp.)、ネオtrombicula 属種 (Neotrombicula spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)；および、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカルス属種 (Acarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)。

【0372】

寄生性原生動物としては、以下のものを挙げる事ができる：

鞭毛虫亜門 (Mastigophora) (鞭毛虫類 (Flagellata))、例えば、トリパノソーマ科 (Trypanosomatidae)、例えば、トリパノソーマ・b.・ブルセイ (Trypanosoma b. brucei)、トリパノソーマ・b.・ガムビエンセ (T. b. gambiense)、トリパノソーマ・b.・ロデシエンセ (T. b. rhodesiense)、トリパノソーマ・コンゴレンセ (T. congolense)、トリパノソーマ・クルジ (T. cruzi)、トリパノソーマ・エバンシ (T. evansi)、トリパノソーマ・エクイヌム (T. equinum)、トリパノソーマ・レウィシ (T. lewisi)、トリパノソーマ・ペルカエ (T. percae)、トリパノソーマ・シミアエ (T. simiae)、トリパノソーマ・ビバキス (T. vivax)、レイスマニア・ブラシリエンシス (Leishmania brasiliensis)、レイスマニア・ドノバニ (L. donovani)、レイスマニア・トロピカ (L. tropica)；例えば、トリコモナス科 (Trichomonadidae)、例えば、ギアルジア・ラムブリア (Giardia lamblia)、ギアルジア・カニス (G. canis)；

有毛根足虫亜門 (Sarcomastigophora) (根足虫類 (Rhizopoda))；例えば、エンタメーバ科 (Entamoebidae)、例えば、エンタメーバ・ヒストリチカ (Entamoeba histolytica)；ハルトマネリダエ科 (Hartmannellidae)、例えば、アカンタモエバ属種 (Acanthamoeba sp.)、ハルマレラ属種 (Harmanella sp.)；

アピコンプレックス門 (Apicomplexa) (孢子虫類 (Sporozoa))、例えば、エイメリア科 (Eimeriidae)、例えば、エイメリア・アセルブリナ (Eimeria acervulina)、エイメリア・アデノイデス (E. adenoides)、エイメリア・アラバメンシス (E. alabamensis)、エイメリア・アナチス (E. anatis)、エイメリア・アンセリナ (E. anserina)、エイメリア・アルロインギ (E. arloingi)、エイメリア・アシャタ (E. ashata)、エイメリア・アウブルネンシス (E. auburnensis)、エイメリア・ボビス (E. bovis)、エイメリア・ブルネッチ (E. brunetti)、エイメリア・カニス (E. canis)、エイメリア・キンキラエ (

E. chinchillae)、エイメリア・クルペアルム (*E. clupearum*)、エイメリア・コルumbae (*E. columbae*)、エイメリア・コントルタ (*E. contorta*)、エイメリア・克蘭ダリス (*E. crandalis*)、エイメリア・デブリエクキ (*E. debliccki*)、エイメリア・ジスペルサ (*E. dispersa*)、エイメリア・エリプソイダレス (*E. ellipsooidales*)、エイメリア・ファルシホルミス (*E. falciformis*)、エイメリア・ファウレイ (*E. faurei*)、エイメリア・フラベセンス (*E. flavescens*)、エイメリア・ガロパボニス (*E. gallopavonis*)、エイメリア・ハガニ (*E. haggani*)、エイメリア・インテスチナリス (*E. intestinalis*)、エイメリア・イロクオイナ (*E. iroquoiana*)、エイメリア・イレシズア (*E. irresidua*)、エイメリア・ラベアナ (*E. labbeana*)、エイメリア・レウカルチ (*E. leucarti*)、エイメリア・マグナ (*E. magna*)、エイメリア・マキシマ (*E. maxima*)、エイメリア・メジア (*E. media*)、エイメリア・メレアグリジス (*E. meleagridis*)、エイメリア・メレアグリミチス (*E. meleagrimitis*)、エイメリア・ミチス (*E. mitis*)、エイメリア・ネカトリキス (*E. necatrix*)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ (*E. ninakohlyakimovae*)、エイメリア・オビス (*E. ovis*)、エイメリア・パルバ (*E. parva*)、エイメリア・パボニス (*E. pavonis*)、エイメリア・ペルホルانس (*E. perforans*)、エイメリア・ファサニ (*E. phasani*)、エイメリア・ピリホルミス (*E. piriformis*)、エイメリア・プラエコキス (*E. praecox*)、エイメリア・レシズア (*E. residua*)、エイメリア・スカブラ (*E. scabra*)、エイメリア属種 (*E. spec.*)、エイメリア・ステダ (*E. stiedai*)、エイメリア・スイス (*E. suis*)、エイメリア・テネラ (*E. tenella*)、エイメリア・ツルンカタ (*E. truncata*)、エイメリア・ツルッタエ (*E. truttae*)、エイメリア・ズエルニイ (*E. zuernii*)、グロビジウム属種 (*Globidium spec.*)、イソスポラ・ベリ (*Isospora belli*)、イソスポラ・カニス (*I. canis*)、イソスポラ・フェリス (*I. felis*)、イソスポラ・オヒオエンシス (*I. ohioensis*)、イソスポラ・リボルタ (*I. rivolta*)、イソスポラ属種 (*I. spec.*)、イソスポラ・スイス (*I. suis*)、シスチスポラ属種 (*Cystispora spec.*)、クリプトスポリジウム属種 (*Cryptosporidium spec.*)、特に、クリプトスポリジウム・パルブム (*C. parvum*)；例えば、トキソプラズマ科 (*Toxoplasmodidae*)、例えば、トキソプラズマ・ゴンジイ (*Toxoplasma gondii*)、ハモンジア・ヘイドルニイ (*Hammondia heydornii*)、ネオスポラ・カニヌム (*Neospora caninum*)、ベスノイチア・ベスノイチイ (*Besnoitia besnoitii*)；例えば、肉胞子虫科 (*Sarcocystidae*)、例えば、サルコシスチス・ボビカニス (*Sarcocystis bovicanis*)、サルコシスチス・ボビホルミス (*S. bovi hominis*)、サルコシスチス・オビカニス (*S. ovicanis*)、サルコシスチス・オビフェリス (*S. ovifelis*)、サルコシスチス・ネウロナ (*S. neurona*)、サルコシスチス属種 (*S. spec.*)、サルコシスチス・スイホミニス (*S. sui hominis*)；例えば、レウコゾイダエ科 (*Leucozooidae*)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (*Leucozytozoon simondi*)；例えば、プラスモディウム科 (*Plasmodiidae*)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium berghei*)、プラスモジウム・ファルシパルム (*P. falciparum*)、プラスモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラスモジウム・オバレ (*P. ovale*)、プラスモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラスモジウム属種 (*P. spec.*)；例えば、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasma*)、例えば、

バベシア・アルゲンチナ (*Babesia argentina*)、バベシア・ボビス (*B. bovis*)、バベシア・カニス (*B. canis*)、バベシア属種 (*B. spec.*)、テイレリア・パルバ (*Theileria parva*)、テイレリア属種 (*Theileria spec.*)；例えば、アデレア亜目 (*Adeleina*)、例えば、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種 (*H. spec.*)。

【0373】

病原性内部寄生生物（これは、蠕虫類である）としては、扁形動物門 (*Platyhelmintha*) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) および吸虫類 (*trematodes*)]、線虫類、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) および舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げることができる：

単生綱 (*Monogenea*)：例えば：ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus spp.*)、ダクチログルス属種 (*Dactylogyrus spp.*)、ポリストマ属種 (*Polystoma spp.*)；

条虫類 (*Cestodes*)：ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例えば：ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium spp.*)、スピロメトラ属種 (*Spirometra spp.*)、シストセファルス属種 (*Schistocephalus spp.*)、リグラ属種 (*Ligula spp.*)、ボトリジウム属種 (*Bothridium spp.*)、ジフロゴノポルス属種 (*Diphlogonoporus spp.*)；

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllide*) の、例えば：メソセストイデス属種 (*Mesocestoides spp.*)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala spp.*)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala spp.*)、モニエジア属種 (*Moniezia spp.*)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma spp.*)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia spp.*)、アビテリナ属種 (*Avitellina spp.*)、スチレシア属種 (*Stilesia spp.*)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia spp.*)、アンジラ属種 (*Andyra spp.*)、ベルチエラ属種 (*Bertiella spp.*)、タエニア属種 (*Taenia spp.*)、エキノコックス属種 (*Echinococcus spp.*)、ヒダチゲラ属種 (*Hydatigera spp.*)、ダバインア属種 (*Davainea spp.*)、ライリエチナ属種 (*Raillietina spp.*)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis spp.*)、エキノレピス属種 (*Echinolepis spp.*)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle spp.*)、ジオルキス属種 (*Diorchis spp.*)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium spp.*)、ジョイエウキシエラ属種 (*Joyeuxiella spp.*)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium spp.*)；

吸虫類 (*Trematodes*)：二生亜綱 (*Digenea*) の、例えば：ジプロストムム属種 (*Diplostomum spp.*)、ポストジプロストムム属種 (*Posthodiplostomum spp.*)、シストソマ属種 (*Schistosoma spp.*)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia spp.*)、オルニトビルハルジア属種 (*Ornithobilharzia spp.*)、アウストロビルハルジア属種 (*Austrobilharzia spp.*)、ギガントビルハルジア属種 (*Gigantobilharzia spp.*)、レウコクロリジウム属種 (*Leucochloridium spp.*)、ブラキライマ属種 (*Brachylaema spp.*)、エキノストマ属種 (*Echinostoma spp.*)、エキノパリフィウム属種 (*Echinoparyphium spp.*)、エキノカスムス属種 (*Echinochasmus spp.*)、ヒポデラエウム属種 (*Hypoderaeum spp.*)、ファシオラ属種 (*Fasciola spp.*)、ファシオロイデス

10

20

30

40

50

属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、シクロコエルム属種 (*Cyclocoelum* spp.)、チフロコエルム属種 (*Typhlocoelum* spp.)、パラムフィストム属種 (*Paramphistomum* spp.)、カリコホロン属種 (*Calicophoron* spp.)、コチロホロン属種 (*Cotylolphoron* spp.)、ギガントコチレ属種 (*Gigantocotyle* spp.)、フィスコエドリウス属種 (*Fischöderius* spp.)、ガストロチラクス属種 (*Gastrothylacus* spp.)、ノトコチルス属種 (*Notocotylus* spp.)、カタトロピス属種 (*Catatropis* spp.)、プラギオルキス属種 (*Plagiorchis* spp.)、プロストゴニムス属種 (*Prosthogonimus* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、エウリトレマ属種 (*Eurytrema* spp.)、トログロトレマ属種 (*Trogлотrema* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、コリリクルム属種 (*Collyriclum* spp.)、ナノフィエツス属種 (*Nanophyetus* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、ヘテロフィエス属種 (*Heterophyes* spp.)、メタゴニムス属種 (*Metagonimus* spp.) ;

線虫類：ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば：トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.) ;

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.) ;

カンセンチュウ目 (*Rhabditiida*) の、例えば：ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyallocephalus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、ポテリオストム属種 (*Poteriostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclococercus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、オエソファゴストム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストム属種 (*Bunostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ムエリウス属種 (*Muellerius* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neoststrongylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneumoststrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphoststrongylus* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Paraelaphoststrongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オス

10

20

30

40

50

ルス属種 (*Oslerus* spp.)、アングオストロンギルス属種 (*Angiostromylylus* spp.)、アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostromylylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostromylylus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostromylylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscooides* spp.)、アミドストムム属種 (*Amidostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)；

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスアルルス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキソカラ属種 (*Toxocara* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種、(*Ascaridia* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロンマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロンマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロンマ属種 (*Parabronema* spp.)、ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)；

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*)：ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.)； ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.)； サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.)；

コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば：アカントセファルス属種 (*Acanthocephalus* spp.)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus* spp.)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides* spp.)；

舌形動物門 (*Pentastoma*)：ポロケファルス目 (*Porocephalida*) の、例えば：リングアツラ属種 (*Linguatula* spp.)。

【0374】

獣医学の分野において、および、畜産業において、式 (I) の化合物は、当技術分野に

10

20

30

40

50

において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口的経路、経皮的経路または経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的または治療的であり得る。

【0375】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式 (I) の化合物の使用である。

【0376】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (helminth ic i d a l a g e n t) または抗原生動物剤 (a n t i p r o t o z o i c a g e n t) としての、式 (I) の化合物の使用である。式 (I) の化合物は、例えば、動物育種において、畜産業において、動物舎の中で、および、衛生学の分野において、抗内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤または抗原生動物剤として使用するのに、適している。

10

【0377】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤または殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) の化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、動物舎の中における、または、衛生学の分野における、抗外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤または殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) の化合物の使用に関する。

【0378】

媒介動物の防除

20

式 (I) の化合物は、媒介動物 (v e c t o r) の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (w o r m s)、単細胞生物および細菌類) を病原体保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) から宿主まで運ぶことが可能な節足動物 (特に、昆虫またはクモ形類動物) である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る (例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、または、宿主体内への注入後に運ばれ得る (例えば、蚊によるマラリア原虫)。

【0379】

媒介動物の例および媒介動物によって運ばれる疾患または病原体は、以下のとおりである：

(1) 蚊類

30

- ・ ハマダラカ (A n o p h e l e s) : マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ (C u l e x) : 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、蠕虫類の運搬；
- ・ ヤブカ (A e d e s) : 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患；

- ・ ブユ (S i m u l i i d a e) : 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (O n c h o c e r c a v o l v u l u s)) の運搬；

(2) シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類： 伝染病、発疹熱；

(4) ハエ類： 睡眠病 (トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

40

(5) ダニ類： ダニ症 (a c a r i o s i s)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (T B E)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (b o r r e l i o s i s)；

(6) マダニ類： ボレリア症 (b o r e l l i o s e s)、例えば、ダットン回帰熱ボレリア (B o r r e l i a d u t t o n i)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (C o x i e l l a b u r n e t i i)、バベシア症 (B a b e s i a c a n i s c a n i s)。

【0380】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類またはアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類および線虫類である

50

。

【0381】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物および／またはヒトに運ぶことが可能な昆虫類およびクモ形類動物、例えば、蚊類〔特に、ヤブカ属 (*Aedes*) の蚊、ハマダラカ属 (*Anopheles*) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (*A. gambiæ*)、アノフェレス・アラビエンシス (*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネストゥス (*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス (*A. dirus*) (マラリア)、および、アカイエカ属 (*Culex*) の蚊〕、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類およびマダニ類である。

【0382】

10

式 (I) の化合物が抵抗性を打破する (*resistance-breaking*) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0383】

式 (I) の化合物は、疾患の予防および／または媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、森林において、庭園やレジャー施設において、および、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式 (I) の化合物の使用である。

【0384】

工業材料の保護

20

式 (I) の化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目 (*Coleoptera*)、ハチ目 (*Hymenoptera*)、シロアリ目 (*Isoptera*)、チョウ目 (*Lepidoptera*)、チャタテムシ目 (*Psocoptera*) およびシミ目 (*Zygentoma*) の昆虫類〕による攻撃または破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0385】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙および厚紙、皮革、木材、加工木材製品および塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0386】

30

さらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、少なくとも 1 種類のさらなる殺虫剤および／または少なくとも 1 種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0387】

さらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、即時使用可能な (*ready-to-use*) 有害生物防除剤として存在している。即ち、それは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能である。適切なさらなる殺虫剤または殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。

【0388】

驚くべきことに、式 (I) の化合物は、海水または淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備および信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式 (I) の化合物は、単独で、または、別の活性化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

40

【0389】

衛生分野における害虫の防除

式 (I) の化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、および、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間 (例えば、住居、工場の通路、オフィスおよび車両の客室) において遭遇する昆虫類、クモ形類動物およびダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式 (I) の化合物は、単独で使用するか、または、別の活性化合物および／または補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭

50

用殺虫剤製品に含ませて使用する。式（I）の化合物は、感受性種および抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

【0390】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱（Arachnida）のサソリ目（Scorpiones）、クモ目（Araneae）およびザトウムシ目（Opiliones）の害虫、ムカデ綱（Chilopoda）およびヤスデ綱（Diplopoda）の害虫、昆虫綱（Insecta）のゴキブリ目（Blattodea）、コウチュウ目（Coleoptera）、ハサミムシ目（Dermaptera）、ハエ目（Diptera）、カメムシ亜目（Heteroptera）、ハチ目（Hymenoptera）、シロアリ目（Isoptera）、チョウ目（Lepidoptera）、シラミ目（Phthiraptera）、チャタテムシ目（Psocoptera）、バッタ目（Saltatoria または Orthoptera）、ノミ目（Siphonaptera）およびシミ目（Zygentoma）の害虫、ならびに、軟甲綱（Malacostraca）のワラジムシ目（Isopoda）の害虫などをあげることができる。

【0391】

施用は、例えば、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレーおよび噴霧スプレー、自動霧化システム（automatic fogging system）、噴霧器（fogger）、泡、ゲル、セルロース製またはプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲルおよび膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システムまたは受動型蒸発システム、防虫紙（moth papers）、防虫バッグ（moth bags）および防虫ゲル（moth gels）において実施するか、または、粒剤もしくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、または、ベイトステーションで実施する。

【0392】

製造方法および中間体の説明

以下の製造例および使用実施例によって本発明について例証するが、それらの実施例は、本発明を限定するものではない。生成物は、 ^1H NMR分光法および／またはLC-MS（液体クロマトグラフィー質量分析法）によって特性決定した。

【0393】

$\log P$ 値は、「OECD Guideline 117（EC Directive 92/69/EEC）」に従い、下記方法によって、逆相（RP）カラム（C18）を用いるHPLC（高速液体クロマトグラフィー）によって求めた：

〔a〕酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.1%水性ギ酸およびアセトニトリル（0.1%ギ酸含有）を使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 2.7で実施する。

【0394】

〔b〕中性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液およびアセトニトリルを使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 7.8で実施する。

【0395】

較正は、 $\log P$ 値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン（3個から16個の炭素原子を有している）を用いて実施する（ $\log P$ 値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて測定する）。

【0396】

NMRスペクトルは、フロープローブヘッドを備えた「Bruker II Avance 400」（体積60 μL ）を用いて測定した。個々の場合において、NMRスペクトルは、「Bruker Avance II 600」を用いて測定した。

【0397】

選択された実施例のNMRデータは、 ^1H -NMRピークリストの形態で示される。各シグナルピークについて、 δ 値（ppm単位）と次に小括弧内のシグナル強度が列記され

10

20

30

40

50

ている。異なるシグナルピークについての δ 値—シグナル強度数は、セミコロンによって互いに区切られて列記されている。

【0398】

従って、一つの実施例についてのピークリストは次の形態を有する。

【0399】

δ_1 (強度1) ; δ_2 (強度2) . . . δ_i (強度i) ; . . . ; δ_n (強度n)。

【0400】

鋭いシグナルの強度は、cm単位でのNMRスペクトラムの印刷例におけるシグナルの高さと相関しており、シグナル強度の真の比率を示すものである。広いシグナルの場合、いくつかのピークもしくはそのシグナルの中央およびその相対強度を、そのスペクトラム中の最も強いシグナルと比較して示すことができる。

10

【0401】

^1H NMRスペクトラムの化学シフトの校正を、特にDMSO中で測定されるスペクトラムの場合に、テトラメチルシランおよび／または溶媒の化学シフトを用いて行う。従って、NMRピークリストにおいては、テトラメチルシランピークが示されている可能性があるが、それが必要なわけではない。

【0402】

^1H —NMRピークのリストは、従来の ^1H —NMR印刷と同様であることから、通常は、従来のNMR解釈で列記される全てのピークを含む。

【0403】

20

さらに、従来の ^1H —NMR印刷のように、それらは、溶媒シグナル、標的化合物の立体異性体（やはり、本発明によって提供される）および／または不純物のピークのシグナルを示すことができる。

【0404】

溶媒および／または水の δ 範囲で化合物シグナルを報告するにおいては、本発明者らの ^1H —NMRピークリストは、標準的な溶媒ピーク、例えば通常は概して高強度を有するDMSO- D_6 中のDMSOのピークおよび水のピークを示す。

【0405】

標的化合物の立体異性体のピークおよび／または不純物のピークは、通常は概して、標的化合物のピークより低い強度を有する（例えば、純度>90%）。

30

【0406】

そのような立体異性体および／または不純物は、特定の製造方法に代表的なものであり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副生成物フィンガープリント」を参照して本発明者らの製造方法の再現性を確認する上で役立ち得る。

【0407】

公知の方法（MestReC、ACDシミュレーションで、さらに経験的に評価される期待値で）によって標的化合物のピークを計算する専門家であれば、必要な場合は、適宜に別の強度フィルターを用いて標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、従来の ^1H NMR解釈での対象のピーク選択と同様であると考えられる。

【0408】

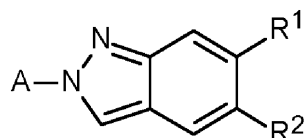
40

^1H NMRピークリストについてのさらなる詳細は、研究開示データベース番号（the Research Disclosure Database Number）564025にある。

【0409】

式（I）の4，5—ジ置換2—（ヘタリール）インダゾール類の一般合成；実施例1から52：

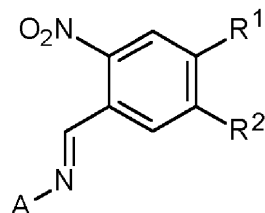
【化 1 1 9】



【0 4 1 0】

段階 1：式 (A-3) の化合物の合成

【化 1 2 0】



10

【0 4 1 1】

複素環アミノ化合物 (A-2) 19.6 mmol、パラートルエンスルホン酸 (PTSA) 1.0 mmol、4 Å モレキュラーシーブス 5.9 mmol および硫酸マグネシウムを式 (A-1) のオルト-ニトロベンズアルデヒド 119.6 mmol のトルエン (75 mmol) 中溶液に加えた。そして、その反応混合物を環流温度で 18 時間攪拌した。薄層クロマトグラム (移動相：酢酸エチル) は、反応が完結したことを示していた。反応混合物を濾過し、濾液から、濃縮後に、粗製生成物 (A-3) を得て、それをそれ以上精製せずにさらに反応させた。

20

【0 4 1 2】

段階 2：式 (I) の 4, 5-ジ置換 2-(ヘタリール) インダゾール類の合成

室温で、亜リン酸トリエチル 58.8 mmol を式 (A-3) の化合物 19.6 mmol に加えた。そして、反応混合物を 140 °C で約 18 時間攪拌した。薄層クロマトグラム (移動相：石油エーテル：酢酸エチル = 1 : 1) は、反応が完結したことを示していた。反応混合物を減圧下に濃縮した後、残った残留物を、Combiflash クロマトグラフィー (移動相勾配：100 % 石油エーテルから 70 % 酢酸エチル / 石油エーテル) によって精製した。

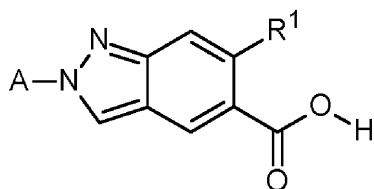
30

【0 4 1 3】

式 (I、 $R^2 = \text{COOH}$) の 4-置換された 2-(ヘタリール) インダゾール-5-カルボン酸類の一般合成

方法 A：

【化 1 2 1】



40

【0 4 1 4】

室温で、水酸化ナトリウム水溶液 21.1 mmol を、テトラヒドロフラン 10 mL および水 10 mL の混合物中の式 (I ; $R^2 = \text{COOCH}_3$) の化合物 7.03 mmol に加えた。次に、反応混合物を 70 °C で約 18 時間攪拌した。薄層クロマトグラム (移動相：石油エーテル：酢酸エチル = 1 : 1) は、反応が完結したことを示していた。反応混合物を減圧下に濃縮した後、残った残留物を、1.2 N 塩酸で pH = 3 に調節した。その後、沈殿固体を濾過し、水で洗浄し、乾燥させた。

【0 4 1 5】

方法 B：

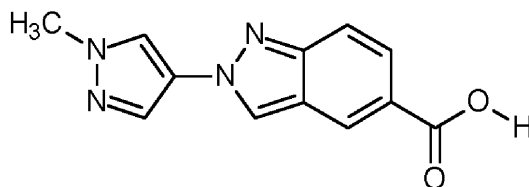
50

1 当量の式 (I ; $R^2 = COOCH_3$) の化合物をメタノール (3 mL/mm ol) に溶かし、1.5 当量の 1 M 水酸化リチウム溶液を室温に加えた。次に、反応混合物を 50 °C で 2 時間攪拌した。次いで、1 M 塩酸を加えることで、反応混合物を pH = 3 に調節した。固体が生成していたら、それを濾過し、乾燥させた。それ以外の場合は、反応溶液をジクロロメタンで抽出した (3 mL/mm ol で 3 回)。その有機相を合わせ、硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下で濃縮した。

【0416】

2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 H - インダゾール - 5 - カルボン酸 (I、A = 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ; $R^1 = H$ 、 $R^2 = COOH$)

【化122】



【0417】

言及した一般合成に従って、メチル 2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 H - インダゾール - 5 - カルボキシレート 3.46 g (13.5 mm ol) からこの化合物を製造した。これによって、標題化合物 2.87 g (収率 88%) を得た。

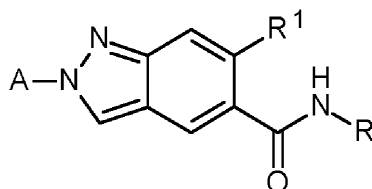
【0418】

APCI MS、 $m/z = 243 [M+H]^+$ 。

【0419】

式 (I、 $R^2 = CONHR$) の 4 - 置換された 2 - (ヘタリール) インダゾール - 5 - カルボキサミド類の一般合成

【化123】



【0420】

a) カルボニルジイミダゾール (CDI) 法：

第 1 の反応段階において、室温で、カルボニルジイミダゾール (CDI) 134 mg (0.84 mm ol) を、2 - (ヘタリール) インダゾール - 5 - カルボン酸 0.84 mm ol の N, N - ジメチルホルムアミド (8 mL) 中溶液に加え、反応混合物を 2 時間攪拌した。第 2 の反応段階において、60% 純度の水素化ナトリウム 1.04 mm ol を、N, N - ジメチルホルムアミド 8 mL 中のこのように製造した反応性成分 1.04 mm ol に室温に加えた。1 時間後、個々のアミン 0.84 mm ol を加え、その混合物を室温でさらに 18 時間攪拌した。後処理のため、水を加え、反応液を減圧下に濃縮し、残った残留物を、シリカゲルでのカラムクロマトグラフィー (移動相勾配：ジクロロメタン：メタノール = 50 : 1 から 5 : 1) によって精製した。

【0421】

b) ホスゲン法：

第 1 の反応段階において、0 °C で、N, N - ジメチルホルムアミド 5 滴およびホスゲン 3 mm ol を、2 - (ヘタリール) インダゾール - 5 - カルボン酸 1.0 mm ol のジクロロメタン (12 mL) 中溶液に加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を減圧下に濃縮することで、2 - (ヘタリール) インダゾール - 5 - カルボニルクロライドを得た。

【0422】

10

20

30

40

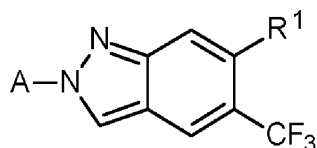
50

第2の反応段階において、ジクロロメタン15mL中の2-(ヘタリール)インダゾール-5-カルボニルクロライド1.0mmolを室温で攪拌し、個々のアミン3.0mmolおよびN,N-ジイソプロピルエチルアミン(DIPEA)4mmolを加えた。反応混合物を室温で18時間攪拌した。後処理のため、反応混合物を減圧下に濃縮し、残った残留物を、Combiflash(移動相勾配:ジクロロメタンから4%メタノール/ジクロロメタン)によって精製した。

【0423】

式(I、 $R^2 = CF_3$)の4-置換された2-(ヘタリール)-5-トリフルオロメチルインダゾール類の一般合成

【化124】



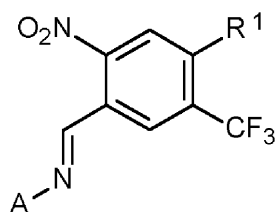
【0424】

段階1: 2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド(A-1)の合成
室温で、N,N-ジメチルホルムアミドO, O-ジメチルアセタール63.7mmolを、2-メチル-1-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン4.9mmolのN,N-ジメチルホルムアミド(15mL)中溶液に滴下した。反応混合物を140℃で18時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、テトラヒドロフラン15mLおよび水15mLを残った残留物に加えた。過要素酸ナトリウム($NaIO_4$)147mmolを加え、反応混合物を室温でさらに18時間攪拌した。反応混合物をジクロロメタンで抽出し、有機相を減圧下に濃縮した。残った残留物を、ISCO(移動相勾配:100%石油エーテルから10%酢酸エチル/石油エーテル)によってクロマトグラフィー精製した。

【0425】

段階2: 式(A-3; $R^1 = H$; $R^2 = CF_3$)の化合物の合成

【化125】



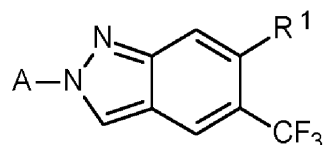
【0426】

複素環アミノ化合物(A-2)1.095mmol、PTSA 0.046mmol、4Åモレキュラーシーブス0.27mmolおよび硫酸マグネシウムを、2-ニトロ-5-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(A-1、 $R^1 = H$)0.913mmolのトルエン(75mL)中溶液に加えた。反応混合物を環流温度で18時間攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液から、濃縮後に、粗生成物(A-3)を得て、それをそれ以上精製せずにさらに反応させた。

【0427】

段階3: 式(I; $R^1 = H$; $R^2 = CF_3$)の4-置換された2-(ヘタリール)-5-トリフルオロメチルインダゾール類の合成

【化126】



【0428】

室温で、亜リン酸トリエチル2.739mmolを式(A-3)の化合物0.913m

10

20

30

40

50

molに加えた。反応混合物を140℃で約18時間攪拌した。薄層クロマトグラム（移動相：石油エーテル：酢酸エチル＝1：1）は、反応が完結したことを示していた。反応混合物を減圧下に濃縮した後、残った残留物を、ISCO（移動相勾配：100%石油エーテルから20%酢酸エチル／石油エーテル）によってクロマトグラフィー精製した。

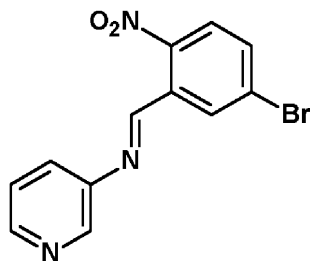
【0429】

実施例49：5-〔2-フルオロ-4-メチル-5-（2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル）フェニル〕-2-（3-ピリジル）インダゾール

段階1：

（E/Z）-N-〔（5-ブロモ-2-ニトロフェニル）メチリデン〕ピリジン-3-アミンの合成

【化127】



【0430】

5-ブロモ-2-ニトロベンズアルデヒド35.75g（155.42mmol）、ピリジン-3-アミン15.04g（159.81mmol）およびエタノール200mLを500mL丸底フラスコに加えた。次に、反応混合物を80℃の油浴で約18時間攪拌した。反応経過をLCMSによってモニタリングした。その後、反応混合物を減圧下に濃縮した。これによって、粗（Z/E）-N-〔（5-ブロモ-2-ニトロフェニル）メチリデン〕ピリジン-3-アミン45gを褐色固体としての得た。

【0431】

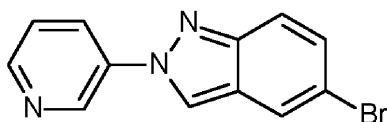
LC-MS（ES、m/z）：305.9 [M+H]。

【0432】

段階2：

5-ブロモ-2-（3-ピリジル）-2H-インダゾールの合成

【化128】



【0433】

500mL丸底フラスコ中、（Z/E）-N-〔（5-ブロモ-2-ニトロフェニル）メチリデン〕ピリジン-3-アミン45g（147.00mmol）および垂リン酸トリエチル75g（451.38mmol）を攪拌した。次に、溶液を90℃の油浴で約18時間攪拌した。反応経過をLCMSによってモニタリングした。その反応混合物を水酸化ナトリウムで洗浄した。形成された溶液を50mLの酢酸エチルで3回抽出し、有機相を合わせた。有機相を水50mLで3回洗浄し、乾燥後、減圧下で濃縮した。残った残留物を、勾配酢酸エチル：石油エーテル＝（25：75）を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製した。これによって、5-ブロモ-2-（3-ピリジル）-2H-インダゾール12.3g（収率：理論値の30%）を黄色固体として得た。

【0434】

LC-MS（ES、m/z）：274.0 [M+H] および276.0 [M+H]；

¹H-NMR（400.0MHz、CDCl₃）：δ＝9.21（s、1H）、8.71（d、J＝4.0Hz、1H）、8.44（s、1H）、8.32（d、J＝7.2Hz、1H）、7.92（s、1H）、7.70（d、J＝9.2Hz、1H）、7.54

10

20

30

40

50

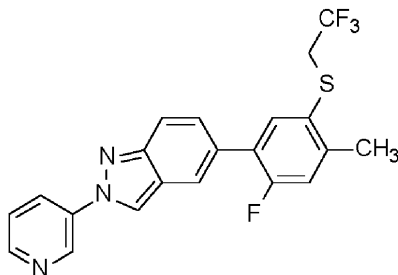
− 7. 57 (m、1 H)、7. 43 (d、J = 9. 2 Hz、1 H) ppm。

【0435】

段階3：

5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール

【化129】



10

【0436】

US2013/0267493からの反応手順と同様にして、炭酸ナトリウム77mg (0.73mmol)の水(375μL)および1,4-ジオキサン(1.5mL)中溶液を、5-ブromo-2-(3-ピリジル)インダゾール(実施例49、段階2参照)100mg (365μmol)および[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]ボロン酸105mg (392μmol)の混合物に加えた。その反応混合物にアルゴン気流を繰り返し流し、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)15mg (19μmol)を加え、容器を閉じた。その混合物をCEM Discoverマイクロ波リアクター中、90℃で40分間加熱し、冷却して室温とした後、デプスフィルターで濾過し、それを酢酸エチルで洗った。その反応を合計で3回行い、バッチを合わせてから精製に供した。溶媒を減圧下で除去した後、その残留物を、シリカゲルMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン0:100→50:50)によってクロマトグラフィー分離する。これによって、5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール392mg(純度93%、収率86%)を得た。

20

30

【0437】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO): δ = 9.374(3.5); 9.367(3.5); 9.306(5.9); 9.305(5.9); 8.686(2.4); 8.682(2.6); 8.674(2.5); 8.671(2.6); 8.541(1.3); 8.537(1.5); 8.534(1.5); 8.531(1.3); 8.520(1.5); 8.516(1.5); 8.513(1.7); 8.510(1.4); 8.228(0.3); 7.975(3.7); 7.860(2.7); 7.837(3.1); 7.774(3.1); 7.754(3.2); 7.687(1.9); 7.675(1.9); 7.666(1.9); 7.655(1.9); 7.558(1.3); 7.553(2.2); 7.549(1.3); 7.535(1.1); 7.531(2.0); 7.527(1.1); 7.338(2.8); 7.309(2.7); 4.066(1.3); 4.040(4.2); 4.014(4.4); 3.988(1.5); 3.335(28.4); 2.893(0.4); 2.528(0.5); 2.514(12.2); 2.510(24.6); 2.505(32.5); 2.501(24.0); 2.496(11.9); 2.453(16.0); 2.406(0.4); 1.397(1.7)。

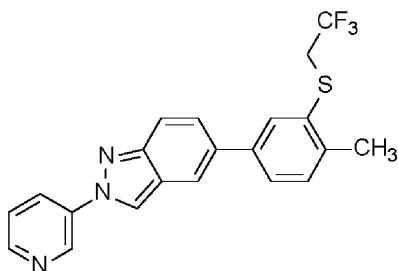
40

【0438】

実施例50: 5-[4-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール

50

【化 1 3 0】



【0 4 3 9】

10

5-[4-メチル-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾールの製造を、5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾールの合成と同様に行った。ここで、5-ブロモ-2-(3-ピリジル)インダゾール(実施例49、段階2参照)100mg(365 μ mol)のおよび[4-メチル-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]ボロン酸98mg(0.39mmol)を用いた。その反応を2回行い、バッチを合わせて精製に供した。これによって、5-[4-メチル-3-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール(純度97%、収率50%)149mgを得た。

20

【0 4 4 0】

$^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.377(3.4); 9.371(3.5); 9.274(5.9); 9.272(6.2); 8.678(2.3); 8.675(2.6); 8.666(2.5); 8.663(2.7); 8.542(1.4); 8.539(1.6); 8.536(1.6); 8.532(1.4); 8.522(1.5); 8.518(1.6); 8.515(1.7); 8.511(1.5); 8.072(4.1); 7.858(2.7); 7.855(2.3); 7.851(3.7); 7.847(3.9); 7.835(3.6); 7.731(2.9); 7.727(2.9); 7.708(2.1); 7.704(2.1); 7.681(1.9); 7.669(1.9); 7.660(1.9); 7.648(1.9); 7.587(1.9); 7.583(1.9); 7.568(2.3); 7.563(2.3); 7.380(3.2); 7.360(2.6); 4.171(1.3); 4.145(4.3); 4.119(4.4); 4.093(1.5); 3.349(0.4); 3.334(63.3); 2.673(0.3); 2.526(0.8); 2.513(18.3); 2.509(37.9); 2.504(50.6); 2.499(37.8); 2.495(19.1); 2.416(16.0); 2.331(0.3); 1.397(0.4)。

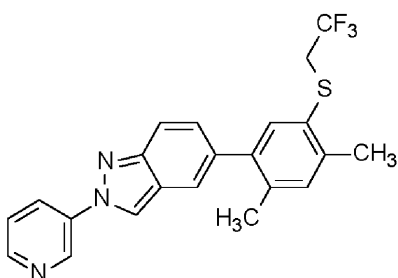
30

【0 4 4 1】

実施例51: 5-[2,4-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール

40

【化 1 3 1】



【0 4 4 2】

50

T. Furuya et al., J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807からの反応手順と同様にして、アルゴン下に、炭酸カリウム60mg (0.43mmol)、2-[2, 4-ジメチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン100mg (289μmol) およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム17mg (15μmol)を、5-ブロモ-2-(3-ピリジル)インダゾール(参照実施例49、段階2)79mg (0.28mmol)の1, 2-ジメトキシエタン(1.0mL)および水(1.0mL)中溶液に加えた。その反応混合物を100℃で3時間攪拌し、冷却して室温とした後、水を加えた。相を分離し、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。その残留物を、シリカゲルMPLC(勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン0:100→60:40)により、次にHPLC(勾配: H₂O/アセトニトリル90:10→0:100)によってさらに1回クロマトグラフィー分離した。これによって、5-[2, 4-ジメチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール37mg(純度98%、収率30%)を得た。

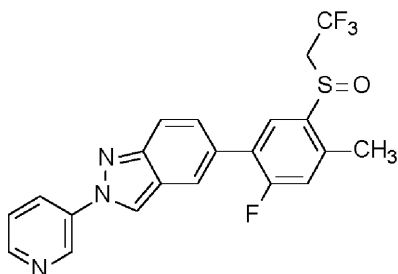
【0443】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO): δ=9.366(3.2); 9.359(3.2); 9.247(5.6); 9.245(5.6); 8.679(2.2); 8.676(2.4); 8.667(2.3); 8.664(2.4); 8.533(1.3); 8.529(1.5); 8.526(1.5); 8.523(1.3); 8.512(1.4); 8.508(1.5); 8.505(1.6); 8.502(1.4); 7.810(2.7); 7.788(3.0); 7.706(4.1); 7.681(1.8); 7.670(1.7); 7.661(1.7); 7.649(1.7); 7.441(5.8); 7.352(2.5); 7.348(2.5); 7.329(2.3); 7.325(2.4); 7.236(4.8); 3.979(1.3); 3.953(4.0); 3.927(4.2); 3.901(1.4); 3.335(13.6); 2.528(0.4); 2.524(0.6); 2.515(8.4); 2.510(17.5); 2.506(23.5); 2.501(17.5); 2.497(8.7); 2.409(14.6); 2.242(16.0); 0.000(1.1)。

【0444】

実施例52: 5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール

【化132】



【0445】

0℃で、メタクロロ過安息香酸(純度70%)56mg(0.23mmol)を、5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール(実施例49)56mg(0.23mmol)の塩化メチレン(5mL)中溶液に加えた。その反応混合物を室温で2時間攪拌し、飽和炭酸ナトリウム溶液を加えた。15分後、相を分離し、水相を塩化メチレンで抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を減圧下に除去し、残留物をシリカゲルMPLC(勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン0:100→50:50)によって

クロマトグラフィー分離した。これによって、5-[2-フルオロ-4-メチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール60mg(純度100%、収率62%)を得た。

【0446】

$^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz、 d_6 -DMSO) : δ = 9.377 (3.5) ; 9.371 (3.5) ; 9.323 (6.1) ; 9.321 (5.9) ; 8.692 (2.5) ; 8.688 (2.7) ; 8.680 (2.6) ; 8.677 (2.7) ; 8.545 (1.4) ; 8.541 (1.6) ; 8.538 (1.5) ; 8.535 (1.4) ; 8.524 (1.6) ; 8.521 (1.6) ; 8.518 (1.7) ; 8.514 (1.4) ; 8.059 (7.0) ; 8.039 (3.4) ; 7.900 (2.8) ; 7.878 (3.3) ; 7.693 (1.9) ; 7.692 (1.9) ; 7.681 (1.8) ; 7.673 (1.8) ; 7.661 (1.8) ; 7.660 (1.8) ; 7.613 (1.3) ; 7.609 (2.3) ; 7.605 (1.3) ; 7.591 (1.2) ; 7.587 (2.0) ; 7.582 (1.1) ; 7.447 (2.6) ; 7.418 (2.5) ; 4.298 (0.5) ; 4.288 (0.5) ; 4.271 (0.7) ; 4.261 (1.7) ; 4.243 (0.4) ; 4.233 (2.1) ; 4.203 (1.8) ; 4.193 (0.6) ; 4.175 (0.6) ; 4.166 (0.6) ; 3.329 (42.3) ; 2.677 (0.4) ; 2.672 (0.5) ; 2.668 (0.4) ; 2.525 (1.4) ; 2.512 (28.8) ; 2.508 (57.1) ; 2.503 (74.6) ; 2.499 (54.0) ; 2.494 (25.9) ; 2.451 (16.0) ; 2.334 (0.4) ; 2.330 (0.5) ; 2.325 (0.4) ; 1.990 (0.7) ; 1.176 (0.4) ; 0.008 (1.4) ; 0.000 (41.3) ; -0.009 (1.3)。

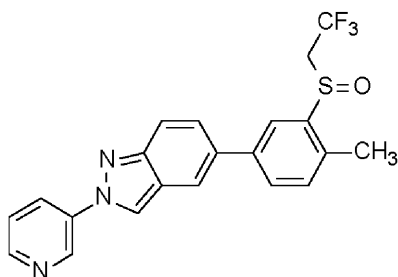
【0447】

同様に、表1および3に挙げた化合物74を、硫黄の酸化によって化合物63から得た。

【0448】

実施例53 : 5-[4-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール

【化133】



【0449】

5-[4-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾールの製造を、実施例52の合成と同様にして行った。ここで、5-[4-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール104mg(217 μmol)およびメタクロロ過安息香酸(純度70%)54mg(0.22mmol)を用いた。これによって、5-[4-メチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)フェニル]-2-(3-ピリジル)インダゾール64mg(純度100%、収率71%)を得た。

【0450】

$^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz、 d_6 -DMSO) : δ = 9.379 (3.6) ; 9.373 (3.7) ; 9.294 (6.2) ; 9.293 (6.0) ; 8.686 (2.5) ; 8.683 (2.7) ; 8.674 (2.7) ; 8.671 (2.7) ; 8.54

6 (1. 4) ; 8. 5 4 2 (1. 7) ; 8. 5 3 9 (1. 6) ; 8. 5 3 6 (1. 4) ;
 8. 5 2 5 (1. 6) ; 8. 5 2 1 (1. 7) ; 8. 5 1 8 (1. 8) ; 8. 5 1 5 (1.
 . 5) ; 8. 1 9 6 (4. 0) ; 8. 1 9 1 (4. 2) ; 8. 1 4 4 (4. 2) ; 7. 9
 1 0 (2. 1) ; 7. 9 0 0 (2. 9) ; 7. 8 9 0 (2. 4) ; 7. 8 8 5 (2. 4)
 ; 7. 8 7 7 (3. 7) ; 7. 7 7 8 (2. 9) ; 7. 7 7 4 (2. 8) ; 7. 7 5 5 (
 2. 0) ; 7. 7 5 1 (2. 0) ; 7. 6 8 9 (1. 9) ; 7. 6 7 7 (1. 9) ; 7.
 6 6 9 (1. 9) ; 7. 6 5 7 (1. 8) ; 7. 4 8 5 (3. 0) ; 7. 4 6 5 (2. 7
) ; 4. 2 5 7 (0. 4) ; 4. 2 4 7 (0. 6) ; 4. 2 3 0 (0. 8) ; 4. 2 2 0
 (1. 9) ; 4. 2 0 6 (1. 8) ; 4. 1 9 3 (2. 0) ; 4. 1 7 8 (2. 0) ; 4
 . 1 6 6 (0. 8) ; 4. 1 5 1 (0. 7) ; 4. 1 4 2 (0. 4) ; 3. 3 3 1 (1 3
 6. 6) ; 2. 6 7 6 (0. 5) ; 2. 6 7 2 (0. 7) ; 2. 6 6 7 (0. 5) ; 2.
 5 2 5 (1. 9) ; 2. 5 1 2 (3 8. 7) ; 2. 5 0 7 (7 7. 7) ; 2. 5 0 3 (1
 0 2. 1) ; 2. 4 9 8 (7 5. 9) ; 2. 4 9 4 (3 8. 6) ; 2. 4 3 7 (1 6. 0
) ; 2. 3 3 4 (0. 5) ; 2. 3 3 0 (0. 7) ; 2. 3 2 5 (0. 5) ; 1. 9 8 9
 (0. 6) ; 0. 0 0 8 (0. 5) ; 0. 0 0 0 (1 4. 6) ; -0. 0 0 8 (0. 7)

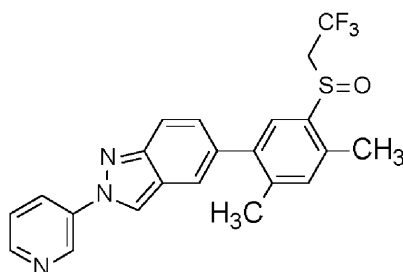
10

【0451】

実施例 5 4 : 5 - [2, 4 - ジメチル - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィ
 ニル) フェニル] - 2 - (3 - ピリジル) インダゾール

【化 1 3 4】

20



【0452】

5 - [2, 4 - ジメチル - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル) フェ
 ニル] - 2 - (3 - ピリジル) インダゾールの製造を、実施例 5 2 の合成と同様にして行
 った。ここで、5 - [2, 4 - ジメチル - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフ
 ィニル) フェニル] - 2 - (3 - ピリジル) インダゾール (純度 < 70 %) 117 mg お
 よびメタクロロ過安息香酸 (純度 70 %) 71 mg (0. 28 mmol) を用いた。こ
 れによって、5 - [2, 4 - ジメチル - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィ
 ニル) フェニル] - 2 - (3 - ピリジル) インダゾール 54 mg (純度 100 %) を得た

30

【0453】

¹H-NMR (400. 0 MHz、d₆-DMSO) : δ = 9. 3 7 1 (3. 3) ; 9.
 . 3 6 5 (3. 5) ; 9. 2 6 3 (5. 7) ; 8. 6 8 1 (2. 5) ; 8. 6 7 2 (2.
 5) ; 8. 6 6 9 (2. 6) ; 8. 5 3 6 (1. 6) ; 8. 5 3 4 (1. 6) ; 8. 5 1
 5 (1. 7) ; 8. 5 1 3 (1. 7) ; 8. 5 1 0 (1. 4) ; 7. 8 4 7 (2. 6) ;
 7. 8 2 5 (2. 9) ; 7. 7 8 8 (4. 4) ; 7. 7 5 3 (6. 3) ; 7. 6 8 7 (1
 . 8) ; 7. 6 7 5 (1. 8) ; 7. 6 6 6 (1. 8) ; 7. 6 5 4 (1. 7) ; 7. 4
 0 4 (2. 3) ; 7. 4 0 0 (2. 4) ; 7. 3 8 1 (2. 2) ; 7. 3 7 8 (2. 2)
 ; 7. 3 3 1 (4. 8) ; 4. 1 7 3 (1. 1) ; 4. 1 4 6 (3. 4) ; 4. 1 1 8 (
 3. 5) ; 4. 0 9 1 (1. 2) ; 3. 3 2 9 (8 3. 0) ; 2. 6 7 2 (0. 9) ; 2
 . 5 6 2 (0. 3) ; 2. 5 0 7 (1 0 7. 3) ; 2. 5 0 3 (1 3 8. 4) ; 2. 4 9
 8 (1 1 1. 3) ; 2. 4 0 3 (1 4. 9) ; 2. 3 4 1 (1 6. 0) ; 1. 9 8 9 (0
 . 6) ; 0. 1 4 6 (0. 9) ; 0. 0 0 0 (1 7 5. 9) ; -0. 1 5 0 (0. 9)。

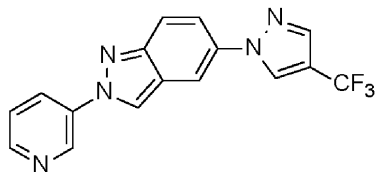
40

50

【0454】

実施例 55：2-（3-ピリジル）-5-〔4-（トリフルオロメチル）ピラゾール-1-イル〕インダゾール

【化135】



【0455】

10

J. C. Antilla et al., J. Org. Chem., 2004, 69, 5578-5587からの反応手順と同様にして、アルゴン下、5-ブロモ-2-（3-ピリジル）インダゾール（実施例49、段階2参照）100mg（365μmol）およびトランス-N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン20μL（0.12mmol）の脱気トルエン（1.0mL）を、ヨウ化銅（I）12mg（63μmol）、4-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール41mg（0.30mmol）および炭酸カリウム88mg（0.64mmol）の混合物に加えた。容器を閉じ、反応混合物をCEM Discoverマイクロ波リアクターで加熱して120℃として18時間経過させた。冷却して室温とした後、その混合物をデプスフィルターで濾過し、それを次に酢酸エチルで洗った。溶媒を減圧下で除去した後、その残留物を、シリカゲルMPLC（勾配：酢酸エチル／シクロヘキサン0：100→50：50）によってクロマトグラフィー的に分離する。これによって、2-（3-ピリジル）-5-〔4-（トリフルオロメチル）ピラゾール-1-イル〕インダゾール17mg（純度94%、収率16%）を得た。

20

【0456】

¹H-NMR（400.0MHz、d₆-DMSO）：δ=9.379（2.7）；9.361（13.4）；9.259（7.9）；9.210（0.4）；8.695（2.3）；8.686（2.4）；8.550（2.2）；8.547（2.6）；8.544（2.5）；8.541（2.1）；8.529（2.4）；8.526（2.6）；8.523（2.7）；8.520（2.2）；8.285（8.4）；8.237（9.1）；7.947（16.0）；7.943（15.7）；7.693（2.6）；7.681（2.6）；7.672（2.6）；7.660（2.5）；5.759（0.7）；3.333（56.9）；2.678（0.5）；2.673（0.7）；2.527（2.0）；2.513（40.5）；2.509（79.4）；2.505（102.3）；2.500（75.1）；2.336（0.5）；2.331（0.6）；1.245（0.5）；1.230（0.5）；0.146（0.9）；0.022（0.5）；0.008（8.3）；0.000（189.5）；-0.009（7.9）；-0.150（1.0）。

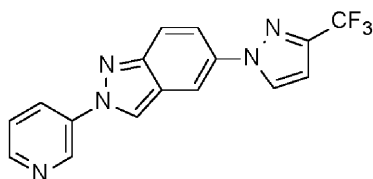
30

【0457】

実施例 56：2-（3-ピリジル）-5-〔3-（トリフルオロメチル）ピラゾール-1-イル〕インダゾール

40

【化136】



【0458】

2-（3-ピリジル）-5-〔3-（トリフルオロメチル）ピラゾール-1-イル〕インダゾールをの製造、実施例55の合成と同様にして行った。ここで、3-（トリフルオ

50

ロメチル) - 1H-ピラゾール 100 mg (735 μ mol)、5-ブロモ-2-(3-ピリジル) インダゾール (実施例 49、段階 2 参照) 242 mg (882 μ mol)、ヨウ化銅 (I) 7.1 mg (37 μ mol)、炭酸カリウム 213 mg (1.54 mmol) およびトランス-N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン 24 μ L (0.15 mmol) を用いた。反応を脱気トルエン (1 mL) 中で行い、反応時間は 6 時間であった。これによって、2-(3-ピリジル)-5-[3-(トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] インダゾール 167 mg (純度 100%、収率 69%) を得た。

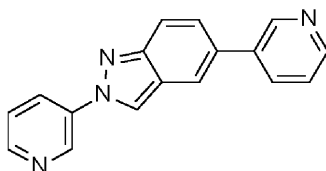
【0459】

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz、 d_6 -DMSO) : δ = 9.375 (8.8) ; 9.368 (8.8) ; 9.346 (16.0) ; 8.809 (7.3) ; 8.806 (7.4) ; 8.699 (5.9) ; 8.696 (6.4) ; 8.688 (6.1) ; 8.684 (6.3) ; 8.547 (3.4) ; 8.543 (3.9) ; 8.540 (3.8) ; 8.537 (3.4) ; 8.526 (3.7) ; 8.522 (3.9) ; 8.519 (4.1) ; 8.516 (3.4) ; 8.318 (0.5) ; 8.277 (9.1) ; 8.274 (8.8) ; 7.968 (3.2) ; 7.944 (11.9) ; 7.930 (9.9) ; 7.925 (9.3) ; 7.907 (2.6) ; 7.902 (2.8) ; 7.695 (4.7) ; 7.683 (4.6) ; 7.674 (4.6) ; 7.662 (4.4) ; 7.076 (8.5) ; 7.070 (8.5) ; 3.332 (215.6) ; 2.677 (0.9) ; 2.673 (1.2) ; 2.669 (0.9) ; 2.526 (3.4) ; 2.513 (66.6) ; 2.508 (131.4) ; 2.504 (171.9) ; 2.499 (127.4) ; 2.335 (0.8) ; 2.331 (1.2) ; 2.326 (0.8) ; 1.990 (0.6) ; 0.000 (0.7)。

【0460】

実施例 57 : 2, 5-ビス (3-ピリジル) インダゾール

【化 137】



【0461】

H. Dong et al., Org. Lett., 2011, 13, 2726-2729 からの反応手順と同様にして、アルゴン下に、[1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II)、1, 4-ジオキサン 4.0 mL、水 1.0 mL および 5-ブロモ-2-(3-ピリジル) インダゾール (参照実施例 49、段階 2) 100 mg (365 μ mol) を、3-ピリジルボロン酸 58 mg (0.47 mmol)、炭酸ナトリウム 155 mg (1.46 mmol) および 13.0 mg (18 μ mol) の混合物に加えた。反応混合物を 80 °C で 2.5 時間加熱し、冷却して室温とした後、綿濾過し、1 M 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性とした。相を分離し、水相を塩化メチレンで繰り返し抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を、シリカゲル MPLC (勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン 0 : 100 $\rightarrow$ 100 : 0) によってクロマトグラフィー分離した。これによって、2, 5-ビス (3-ピリジル) インダゾール 80 mg (純度 100%、収率 81%) を得た。

【0462】

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz、 d_6 -DMSO) : δ = 9.384 (9.1) ; 9.377 (9.3) ; 9.309 (16.0) ; 8.988 (8.7) ; 8.983 (8.9) ; 8.685 (5.7) ; 8.682 (6.6) ; 8.673 (6.1) ; 8.670 (6.6) ; 8.591 (5.6) ; 8.587 (6.3) ; 8.579 (6.0) ; 8.575 (6.2) ; 8.554 (3.3) ; 8.550 (3.9) ; 8.547 (4.0) ; 8.544 (3.5) ; 8.533 (3.6) ; 8.529 (4.0) ; 8.

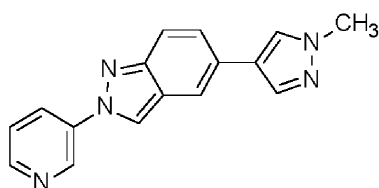
5 2 7 (4. 3) ; 8. 5 2 3 (3. 6) ; 8. 3 1 8 (0. 3) ; 8. 1 7 9 (3. 3)
) ; 8. 1 7 3 (4. 8) ; 8. 1 6 9 (3. 6) ; 8. 1 5 4 (1 5. 7) ; 7. 8 9
 8 (6. 3) ; 7. 8 7 6 (8. 7) ; 7. 7 5 4 (7. 1) ; 7. 7 5 0 (7. 3) ;
 7. 7 3 2 (5. 3) ; 7. 7 2 7 (5. 5) ; 7. 6 8 6 (5. 1) ; 7. 6 7 4 (5.
 . 0) ; 7. 6 6 5 (5. 0) ; 7. 6 5 3 (4. 8) ; 7. 5 2 8 (4. 8) ; 7. 5
 1 6 (4. 7) ; 7. 5 0 8 (4. 6) ; 7. 4 9 6 (4. 4) ; 3. 3 3 2 (1 0 3.
 5) ; 2. 6 7 7 (0. 7) ; 2. 6 7 3 (0. 9) ; 2. 6 6 9 (0. 7) ; 2. 5 2
 6 (2. 4) ; 2. 5 0 8 (1 0 2. 3) ; 2. 5 0 4 (1 3 6. 8) ; 2. 4 9 9 (1
 0 4. 3) ; 2. 3 3 5 (0. 6) ; 2. 3 3 1 (0. 9) ; 2. 3 2 6 (0. 7) ; 1
 . 9 9 0 (0. 4) ; 1. 2 5 9 (0. 4) ; 1. 2 5 0 (0. 3) ; 1. 2 3 0 (0.
 5) ; 0. 0 0 0 (5. 7) 。

10

【0 4 6 3】

実施例 5 8 : 5 - (1 - メチルピラゾール - 4 - イル) - 2 - (3 - ピリジル) インダ
 ズール

【化 1 3 8】



20

【0 4 6 4】

Ch. O. Ndubaku et al., J. Med. Chem., 20
 13, 56, 4597-4610からの反応手順と同様にして、水1.2mLおよびア
 セトニトリル0.6mLを、5-ブromo-2-(3-ピリジル)インダズール(実施例4
 9、段階2参照)100mg(365μmol)および酢酸カリウム107mg(1.0
 9mmol)の混合物に加えた。反応混合物にアルゴン気流を繰り返し流し、アセトニト
 リル0.6mL中溶液としての1-メチル-4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,
 3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール114mg(547μmol)
)と次にテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム42mg(36μmol)を
 加えた。容器を閉じ、反応混合物をCEM Discoverマイクロ波リアクター中で
 加熱して120℃として60分間経過させた。その反応混合物をデプスフィルターで濾過
 し、そのフィルターを酢酸エチルで洗った。濾液を水で洗浄し、相を分離し、水相を酢酸
 エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した
 。残留物を、シリカゲルMPLC(勾配:酢酸エチル/シクロヘキサン0:100→10
 0:0)によってクロマトグラフィー分離した。これによって、5-(1-メチルピラゾ
 ール-4-イル)-2-(3-ピリジル)インダズール26mg(純度100%、収率2
 6%)を得た。

30

【0 4 6 5】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO): δ=9.349(2.4); 9.
 .343(2.4); 9.149(4.2); 9.147(4.1); 8.656(1.
 7); 8.653(1.8); 8.645(1.8); 8.641(1.8); 8.51
 1(1.0); 8.507(1.2); 8.504(1.1); 8.501(1.0);
 8.490(1.1); 8.486(1.2); 8.483(1.2); 8.480(1.
 .0); 8.199(4.4); 7.943(4.6); 7.942(4.5); 7.9
 13(3.2); 7.757(1.8); 7.735(2.5); 7.664(1.3)
 ; 7.663(1.3); 7.652(1.3); 7.643(1.3); 7.631(
 1.3); 7.630(1.3); 7.618(2.1); 7.614(2.1); 7.
 596(1.6); 7.592(1.6); 3.885(16.0); 3.334(44
 .0); 2.526(0.9); 2.512(17.3); 2.508(34.2); 2.
 .504(44.4); 2.499(32.6); 2.495(16.2); 1.232

40

50

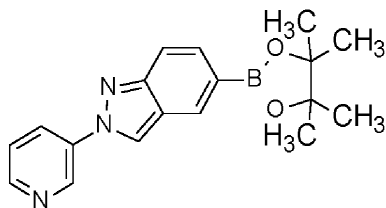
(0.8); 0.000 (7.6)。

【0466】

実施例 59: 5-(2-ピリジル)-2-(3-ピリジル)インダゾール

段階 1: 2-(3-ピリジル)-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)インダゾール (59a)

【化139】



10

【0467】

T. Ishiyama et al., J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510からの反応手順と同様にして、アルゴン下、脱気1,4-ジオキサン (6.0 mL) を、5-ブロモ-2-(3-ピリジル)インダゾール (実施例 49、段階 2 参照) 500 mg (1.82 mmol)、ビス(ピナコラト)ジボロン 486 mg (1.92 mmol)、酢酸カリウム 537 mg (5.47 mmol)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) (塩化メチレンとの 1:1 付加物) 45 mg (55 μmol) および 1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン 30 mg (55 μmol) の混合物に加えた。反応混合物を 6 時間還流加熱し、冷却して室温とした後、デプスフィルターで濾過し、それを酢酸エチルで洗った。水および塩化メチレンを濾液に加え、相を分離し、水相を塩化メチレンで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を、シリカゲル MPLC (勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→50:50) によってクロマトグラフィー分離した。これによって、2-(3-ピリジル)-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)インダゾール 343 mg (純度 70%、収率 42%) を 2-(3-ピリジル)インダゾールとの混合物として得た。それ以上精製することなく、この混合物を以降の反応に用いた。

20

【0468】

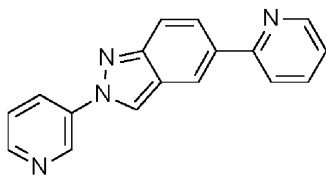
$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.349 (1.4); 9.342 (1.4); 9.287 (1.4); 9.285 (1.4); 9.216 (1.2); 9.214 (1.2); 8.678 (0.6); 8.674 (0.6); 8.666 (1.1); 8.663 (1.1); 8.655 (0.5); 8.651 (0.5); 8.523 (0.3); 8.520 (0.4); 8.517 (0.4); 8.513 (0.6); 8.510 (0.4); 8.506 (0.4); 8.503 (0.6); 8.499 (0.5); 8.496 (0.5); 8.492 (0.7); 8.489 (0.4); 8.486 (0.4); 8.217 (1.3); 7.810 (0.6); 7.789 (0.6); 7.754 (0.5); 7.752 (0.5); 7.732 (0.6); 7.730 (0.6); 7.716 (0.6); 7.694 (0.8); 7.673 (0.5); 7.669 (0.5); 7.668 (0.5); 7.661 (0.5); 7.655 (0.6); 7.654 (0.6); 7.648 (0.5); 7.640 (0.5); 7.636 (0.4); 7.559 (0.8); 7.557 (0.8); 7.537 (0.6); 7.535 (0.6); 7.354 (0.4); 7.352 (0.4); 7.349 (0.3); 7.332 (0.3); 7.330 (0.3); 7.157 (0.4); 7.155 (0.4); 7.140 (0.4); 7.139 (0.4); 7.136 (0.4); 7.134 (0.4); 3.939 (0.4); 3.336 (6.5); 2.510 (8.3); 2.505 (10.7); 2.501 (7.9); 1.397 (1.3); 1.328 (16.0); 1.072 (2.3)。

40

【0469】

50

段階 2 : 5 - (2 - ピリジル) - 2 - (3 - ピリジル) インダゾール
【化 1 4 0】



【0 4 7 0】

T. Furuya et al., J. AM. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807からの反応手順と同様にして、アルゴン下、炭酸カリウム 39 mg (0.28 mmol)、2-(3-ピリジル)-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)インダゾール (純度 70%) 100 mg (218 μmol) およびテラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム 11 mg (9.6 μmol) を、2-ブロモピリジン 18 μL (0.19 mmol) の 1,2-ジメトキシエタン (1.0 mL) 中溶液に加えた。反応混合物を 100℃で 3 時間加熱し、冷却して室温とした後、水を加えた。相を分離し、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を、シリカゲル MPLC (勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→100:0) によってクロマトグラフィーで分離した。これによって、5-(2-ピリジル)-2-(3-ピリジル)インダゾール 25 mg (純度 100%、収率 41%) を得た。

【0 4 7 1】

¹H-NMR (400.0 MHz、d₆-DMSO): δ = 9.378 (9.5); 9.371 (9.4); 9.330 (15.8); 9.329 (16.0); 8.697 (5.2); 8.695 (5.4); 8.684 (11.3); 8.681 (10.9); 8.672 (6.8); 8.669 (6.8); 8.548 (3.8); 8.544 (4.4); 8.541 (4.4); 8.537 (4.3); 8.527 (14.6); 8.520 (5.2); 8.517 (3.9); 8.318 (0.6); 8.167 (6.3); 8.163 (6.1); 8.144 (7.2); 8.140 (7.2); 8.078 (6.7); 8.058 (8.6); 7.926 (3.6); 7.921 (3.6); 7.906 (5.6); 7.902 (5.5); 7.887 (3.1); 7.883 (3.1); 7.856 (8.5); 7.833 (7.4); 7.686 (5.2); 7.675 (5.0); 7.666 (5.0); 7.654 (4.8); 7.373 (4.1); 7.371 (4.3); 7.359 (4.5); 7.355 (4.3); 7.353 (4.0); 7.342 (3.8); 7.340 (3.8); 3.336 (231.2); 2.677 (1.2); 2.672 (1.6); 2.668 (1.2); 2.526 (4.3); 2.512 (90.3); 2.508 (177.5); 2.503 (229.6); 2.499 (167.1); 2.495 (82.5); 2.335 (1.1); 2.330 (1.5); 2.326 (1.1); 2.237 (0.6); 0.008 (2.4); 0.000 (66.9); -0.008 (2.5)。

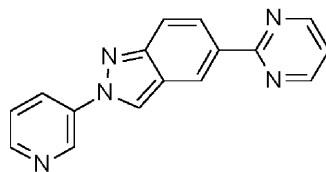
【0 4 7 2】

表 1 および 3 に挙げた化合物 61 から 73、101 および 104 を同様にして製造した。

【0 4 7 3】

実施例 60 : 2-(3-ピリジル)-5-ピリミジン-2-イル-インダゾール

【化 1 4 1】



【0474】

WO2010/151601からの反応手順と同様にして、アルゴン下、脱気アセトニトリル(1.0mL)および炭酸ナトリウム86mg(0.81mmol)の脱気水(1.0mL)中溶液を、2-ブロモピリミジン32mg(0.20mmol)、2-(3-ピリジル)-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)インダゾール(70%純度)109mg(238μmol)およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム7mg(6μmol)の混合物に加えた。反応混合物を73℃で24時間加熱し、冷却して室温とした後、水および酢酸エチルを加えた。相を分離し、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を、シリカゲルMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン50:50→75:2)によってクロマトグラフィー分離した。これによって、2-(3-ピリジル)-5-ピリミジン-2-イルインダゾール60mg(純度96%、収率88%)を得た。

10

【0475】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO): δ=9.408(7.7); 9.406(7.6); 9.373(4.0); 9.367(4.0); 8.934(14.4); 8.922(16.0); 8.918(6.0); 8.915(4.4); 8.695(2.8); 8.691(3.0); 8.683(2.9); 8.679(3.0); 8.544(1.8); 8.541(2.1); 8.538(2.0); 8.534(1.8); 8.524(2.0); 8.520(2.1); 8.517(2.2); 8.513(1.9); 8.418(3.6); 8.414(3.5); 8.395(3.9); 8.391(3.9); 7.871(4.3); 7.848(4.0); 7.694(2.3); 7.693(2.3); 7.682(2.3); 7.681(2.3); 7.673(2.3); 7.672(2.3); 7.661(2.2); 7.660(2.2); 7.456(3.9); 7.443(7.3); 7.431(3.8); 5.761(0.7); 3.340(50.8); 2.529(0.6); 2.524(0.9); 2.516(14.0); 2.511(28.9); 2.507(38.4); 2.502(27.9); 2.498(13.6); 0.000(5.9)。

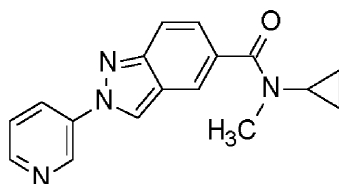
20

【0476】

実施例75: N-シクロプロピル-N-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド

30

【化142】



【0477】

2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボン酸57mg(0.24mmol)、N-メチルシクロプロパンアミン17mg(0.24mmol)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド55mg(0.29mmol)および1-ヒドロキシ-1H-ベンゾトリアゾール3.2mg(24μmol)のピリジン(3mL)中溶液を室温で4時間攪拌した。反応混合物を水および酢酸エチルで希釈した。相を分離し、水相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。残留物を、シリカゲルMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン0:100→100:0)によってクロマトグラフィー分離した。これによって、N-シクロプロピル-N-メチル-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド30mg(純度100%、収率43%)を得た。

40

【0478】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO): ¹H-NMR(400.0MHz

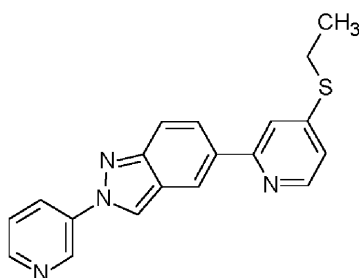
50

z、d₆-DMSO) : δ = 9.350 (3.2) ; 9.343 (3.3) ; 9.287 (5.6) ; 9.285 (5.5) ; 8.681 (2.1) ; 8.677 (2.3) ; 8.669 (2.3) ; 8.666 (2.3) ; 8.522 (1.2) ; 8.518 (1.4) ; 8.515 (1.4) ; 8.512 (1.3) ; 8.501 (1.3) ; 8.497 (1.4) ; 8.495 (1.5) ; 8.491 (1.3) ; 7.978 (3.7) ; 7.761 (2.5) ; 7.738 (2.9) ; 7.677 (1.8) ; 7.665 (1.7) ; 7.656 (1.7) ; 7.644 (1.7) ; 7.468 (2.0) ; 7.465 (2.0) ; 7.446 (1.7) ; 7.442 (1.8) ; 5.755 (3.4) ; 3.319 (22.1) ; 3.008 (16.0) ; 2.987 (1.3) ; 2.978 (0.9) ; 2.970 (0.7) ; 2.960 (0.4) ; 2.672 (0.4) ; 2.525 (0.7) ; 2.511 (19.0) ; 2.507 (38.5) ; 2.503 (51.1) ; 2.498 (37.7) ; 2.494 (18.9) ; 0.561 (1.8) ; 0.547 (1.8) ; 0.458 (2.1) ; 0.008 (0.8) ; 0.000 (23.7) ; -0.008 (1.0) ppm.

【0479】

実施例76 : 5-[4-(エチルスルファニル)ピリジン-2-イル]-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール

【化143】



【0480】

ナトリウムエタノチオレート93mg (0.89mmol)を、5-(4-クロロピリジン-2-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール27mg (89 μ mol)の純粋ジメチルホルムアミド(4mL)中溶液に加えた。反応混合物を室温で一晩攪拌し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を酢酸エチルおよび水に取り、相を分離し、水相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。残留物を、シリカゲルMPLC(勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン0:100 $\rightarrow$ 50:0)によってクロマトグラフィー分離した。これによって、5-[4-(エチルスルファニル)ピリジン-2-イル]-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール11mg(純度100%、収率38%)を得た。

【0481】

¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO) : ¹H-NMR(400.0MHz、d₆-DMSO) : δ = 9.375 (4.2) ; 9.369 (4.3) ; 9.309 (7.2) ; 8.683 (2.9) ; 8.680 (3.1) ; 8.672 (3.1) ; 8.669 (3.1) ; 8.545 (6.4) ; 8.534 (1.8) ; 8.523 (1.9) ; 8.519 (2.0) ; 8.516 (2.1) ; 8.513 (1.7) ; 8.486 (4.3) ; 8.473 (4.4) ; 8.150 (2.8) ; 8.146 (2.7) ; 8.127 (3.2) ; 8.123 (3.1) ; 7.852 (5.0) ; 7.850 (5.1) ; 7.837 (4.0) ; 7.814 (3.4) ; 7.685 (2.3) ; 7.673 (2.2) ; 7.664 (2.2) ; 7.652 (2.1) ; 7.236 (3.1) ; 7.232 (3.1) ; 7.223 (3.1) ; 7.219 (3.0) ; 3.318 (62.4) ; 3.232 (2.2) ; 3.214 (6.9) ; 3.195 (7.1) ; 3.177 (2.3) ; 2.676 (0.6) ; 2.671 (0.8) ; 2.667 (0.6) ; 2.507 (87.7) ; 2.502 (113.3) ; 2.498 (84.3) ;

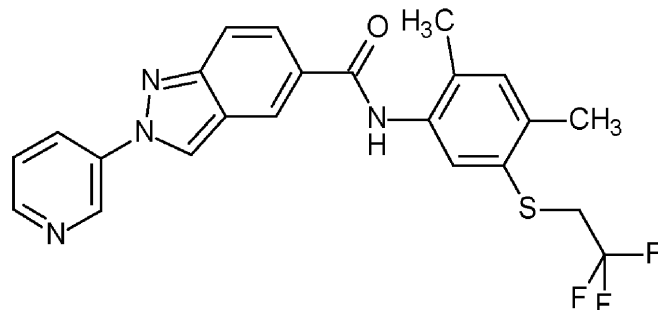
2. 333 (0. 6) ; 2. 329 (0. 7) ; 2. 325 (0. 5) ; 1. 363 (7. 6) ; 1. 345 (16. 0) ; 1. 327 (7. 4) ; 1. 259 (0. 4) ; 1. 250 (0. 7) ; 1. 230 (0. 6) ; 0. 000 (2. 0) ppm.

表1および3で列記の化合物77から80を、同様にして製造した。

【0482】

実施例81 : N- {2, 4-ジメチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル] フェニル} -2- (ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボキサミド

【化144】



10

【0483】

アルゴン雰囲気下に、2Mトリメチルアルミニウムのトルエン中溶液0. 53mL (1. 07mmol) を、2, 4-ジメチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル] アニリン251mg (1. 07mmol) の1, 2-ジクロロエタン (5mL) 中溶液にゆっくり滴下した。その溶液を室温で30分間攪拌し、2- (ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボン酸メチル200mg (0. 71mmol) を加え、混合物を100℃で終夜攪拌した。冷却して室温とした後、反応混合物に飽和酒石酸カリウムナトリウム溶液を注意深く加え、混合物をジクロロメタンで繰り返し抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。の残留物を、シリカゲルMPLC (勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン0 : 100→100 : 0) によってクロマトグラフィー分離した。これによって、N- {2, 4-ジメチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル] フェニル} -2- (ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボキサミド102mg (純度90%、収率28%) を得た。

20

【0484】

$^1\text{H-NMR}$ (400. 0MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$) : $^1\text{H-NMR}$ (400. 0MHz、 $\text{d}_6\text{-DMSO}$) : δ = 9. 967 (3. 6) ; 9. 462 (5. 6) ; 9. 448 (0. 4) ; 9. 390 (3. 2) ; 9. 384 (3. 3) ; 8. 702 (2. 3) ; 8. 699 (2. 5) ; 8. 690 (2. 4) ; 8. 687 (2. 5) ; 8. 557 (5. 0) ; 8. 539 (1. 5) ; 8. 536 (1. 8) ; 8. 533 (1. 9) ; 8. 529 (1. 5) ; 7. 921 (1. 4) ; 7. 918 (1. 3) ; 7. 899 (2. 6) ; 7. 895 (2. 6) ; 7. 851 (3. 5) ; 7. 828 (1. 8) ; 7. 698 (1. 8) ; 7. 686 (1. 8) ; 7. 678 (1. 8) ; 7. 666 (1. 7) ; 7. 571 (5. 2) ; 7. 208 (4. 7) ; 4. 038 (0. 4) ; 4. 021 (0. 4) ; 3. 892 (1. 1) ; 3. 866 (3. 5) ; 3. 840 (3. 6) ; 3. 814 (1. 2) ; 3. 317 (32. 3) ; 2. 675 (0. 4) ; 2. 671 (0. 5) ; 2. 666 (0. 4) ; 2. 524 (1. 5) ; 2. 510 (31. 3) ; 2. 506 (61. 7) ; 2. 502 (81. 3) ; 2. 497 (60. 7) ; 2. 493 (30. 4) ; 2. 385 (14. 2) ; 2. 333 (0. 5) ; 2. 329 (0. 6) ; 2. 324 (0. 5) ; 2. 226 (16. 0) ; 2. 204 (1. 4) ; 2. 185 (0. 9) ; 1. 988 (1. 9) ; 1. 193 (0. 5) ; 1. 175 (1. 0) ; 1. 158 (0. 5) ; 0. 008 (1. 4) ; 0. 000 (38. 9) ; -0. 008 (1. 4) ppm

40

50

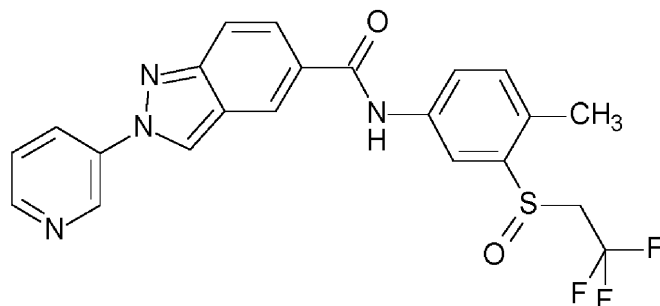
m.

表1および3に列記の化合物82から93を、同様にして製造した。

【0485】

実施例94：N- {4-メチル-3- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -2-(ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボキサミド

【化145】



10

【0486】

触媒量のタングステン酸ナトリウムを、N- {4-メチル-3- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル] フェニル} -2-(ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボキサミド50mg (0.11mmol) の酢酸 (2.5mL) 中溶液に加え、3.5%強度過酸化水素溶液98μL (0.11mmol) を0℃で加えた。反応混合物を0℃で1時間、室温で終夜撹拌した。3.5%強度過酸化水素溶液4μL (44μmol) を加え、混合物を室温でさらに1夜撹拌した。反応混合物を水およびジクロロメタンで希釈した。有機相を分離し、水および濃重亜硫酸ナトリウム溶液の順で洗浄した。次に、有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残留物を、シリカゲルMPLC (勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン20：80→100：0) によってクロマトグラフィー分離した。これによって、N- {4-メチル-3- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -2-(ピリジン-3-イル) -2H-インダゾール-5-カルボキサミド19.8mg (純度95%、収率37%) を得た。

20

【0487】

¹H-NMR (400.0MHz、d₆-DMSO) : ¹H-NMR (400.0MHz、d₆-DMSO) : δ=10.618 (4.2) ; 9.478 (6.2) ; 9.394 (3.7) ; 9.387 (3.8) ; 8.706 (2.5) ; 8.703 (2.8) ; 8.695 (2.7) ; 8.691 (2.9) ; 8.600 (4.5) ; 8.563 (1.4) ; 8.560 (1.7) ; 8.557 (1.6) ; 8.553 (1.5) ; 8.543 (1.6) ; 8.539 (1.7) ; 8.536 (1.8) ; 8.532 (1.5) ; 8.373 (3.9) ; 8.368 (4.2) ; 8.314 (0.3) ; 8.000 (1.9) ; 7.995 (1.9) ; 7.980 (2.1) ; 7.974 (2.1) ; 7.940 (1.7) ; 7.936 (1.8) ; 7.917 (3.3) ; 7.913 (3.5) ; 7.869 (4.0) ; 7.847 (2.1) ; 7.703 (2.0) ; 7.691 (1.9) ; 7.682 (1.9) ; 7.670 (1.9) ; 7.367 (3.0) ; 7.346 (2.8) ; 4.181 (1.0) ; 4.171 (0.5) ; 4.153 (1.1) ; 4.143 (1.3) ; 4.126 (0.5) ; 4.116 (1.3) ; 4.089 (0.4) ; 3.949 (0.3) ; 3.922 (1.2) ; 3.913 (0.4) ; 3.895 (1.4) ; 3.885 (1.1) ; 3.868 (0.5) ; 3.858 (1.0) ; 3.832 (0.3) ; 3.318 (50.7) ; 2.791 (0.6) ; 2.676 (0.6) ; 2.671 (0.8) ; 2.667 (0.6) ; 2.635 (0.5) ; 2.524 (2.4) ; 2.511 (44.9) ; 2.507 (91.6) ; 2.502 (122.3) ; 2.497 (92.4) ; 2.493 (47.8) ; 2.351 (16.0) ; 2.333 (0.9) ; 2.329 (1.0) ; 2.324 (0.8) ; 1

30

40

50

. 336 (0.7); 1.299 (0.5); 1.259 (0.8); 1.250 (1.0); 1.234 (0.5); 0.146 (0.6); 0.008 (5.1); 0.000 (138.3); -0.008 (6.3); -0.150 (0.6) ppm。

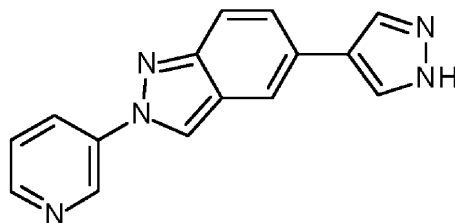
【0488】

表1および3で列記の化合物95から97を、同様にして製造した。

【0489】

実施例98: 5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-2H-インダゾール

【化146】



10

【0490】

N, N-ジメチルホルムアミド (15 mL) および水 (8.25 mL) 中の 5-(4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)-1H-ピラゾール 1.06 g (5.47 mmol) を最初に、50 mL 丸底フラスコに入れた。フラスコにアルゴンを通じ、アルゴン気流下に維持しながら、炭酸ナトリウム 1.74 g (16.42 mmol)、5-ブromo-2-(3-ピリジル) インダゾール 1.50 g (5.47 mmol) およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム 0.31 g (0.27 mmol) を加えた。その反応混合物を 120 °C の油浴で約 18 時間攪拌した。冷却後、反応混合物を濾過し、フィルターを酢酸エチルで洗った。濾液を水で繰り返し洗浄した。有機相を濾過し、水で洗浄した。合わせた有機相を乾燥硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下に溶媒除去した。さらなる精製のため、残留物を最初にジクロロメタンに溶かし、濾過によって不溶成分から分離した。濾液を水とともに攪拌し、不溶部分を濾過し、真空乾燥した。これによって、標題化合物 505 mg (LC/MS により純度 100%、収率 35%) を得た。

20

【0491】

¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 12.941 (2.9); 9.350 (9.6); 9.344 (9.6); 9.136 (16.0); 8.655 (6.5); 8.652 (7.1); 8.643 (6.8); 8.640 (7.0); 8.510 (3.7); 8.507 (4.5); 8.505 (4.5); 8.501 (3.8); 8.490 (4.0); 8.486 (4.6); 8.484 (4.8); 8.480 (3.8); 8.314 (0.7); 8.257 (4.7); 8.007 (4.6); 7.951 (12.7); 7.755 (5.7); 7.732 (9.9); 7.676 (8.2); 7.673 (8.3); 7.662 (5.6); 7.650 (9.7); 7.641 (5.2); 7.629 (4.7); 3.321 (105.7); 2.891 (0.4); 2.732 (0.4); 2.672 (1.3); 2.507 (159.7); 2.503 (205.5); 2.498 (160.5); 2.329 (1.3); 0.000 (5.4) ppm。

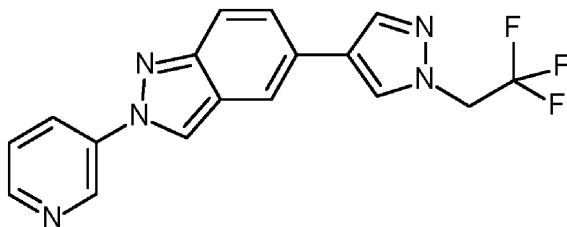
30

40

【0492】

実施例99: 2-(ピリジン-3-イル)-5-[1-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2H-インダゾール

【化 1 4 7】



【0 4 9 3】

最初に、5-（1H-ピラゾール-4-イル）-2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール100mg（0.38mmol）を脱水N，N-ジメチルホルムアミド2mLに入れた。炭酸カリウム79mg（0.57mmol）を加え、フラスコにアルゴン気流を流したまま、トリフルオロメタンスルホン酸2，2，2-トリフルオロエチル83μL（133mg，0.57mmol）を加えた。反応混合物を室温で終夜撹拌した。反応の進行を薄層クロマトグラフィーおよびLC/MSによってモニタリングした。トリフルオロメタンスルホン酸トリフルオロエチル28μL（0.11mmol）を加えた後に、反応混合物を室温で週末にわたって撹拌した。濾液を水で繰り返し洗浄し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下に溶媒除去した。さらなる精製のため、残留物について最初にジクロロメタンに溶かし、不溶成分から濾過によって分離した。濾液を水とともに撹拌し、得られた固体を濾過によって単離した。これによって、標題化合物505mg（LC/MSにより純度100%、収率35%）を得た。

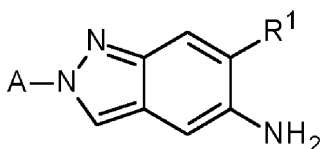
【0 4 9 4】

$^1\text{H-NMR}$ （400.0MHz、 d_6 -DMSO）： δ =9.356（8.4）；9.350（8.8）；9.175（14.9）；8.661（6.6）；8.649（6.7）；8.513（4.1）；8.492（4.4）；8.349（15.0）；8.139（16.0）；7.998（11.7）；7.786（6.0）；7.763（8.2）；7.667（4.5）；7.655（4.9）；7.646（11.1）；7.635（4.8）；7.623（5.3）；5.206（2.9）；5.183（9.2）；5.160（9.6）；5.137（3.3）；3.323（45.8）；2.673（0.7）；2.504（114.3）；2.330（0.7）；1.990（0.9）；1.176（0.5）；0.146（0.6）；0.000（109.6）；-0.150（0.6）ppm。

【0 4 9 5】

式（I、 $R^2 = \text{NH}_2$ ）の2-（ヘタリール）-2H-インダゾール-5-アミン類の一般合成

【化 1 4 8】

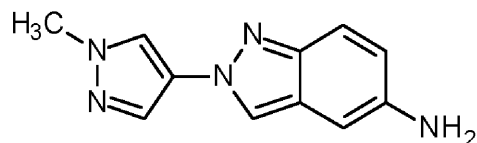


【0 4 9 6】

保護ガス（アルゴン）雰囲気下に、式（I； $R^2 = \text{COOH}$ ）の4-置換された2-（ヘタリール）インダゾール-5-カルボン酸を脱水1，4-ジオキサン（4mL/mmole）に溶かし、1.5当量のジフェニルホスホリルアジド（DPPA）および1.5当量のトリエチルアミンを加えた。次に、反応混合物を室温で3時間撹拌した。1M塩酸（4mL/mmole）を加えた後、反応混合物を100℃で30分間撹拌した。冷却して室温とした後、炭酸ナトリウム溶液を加えることでpHを7に調節し、反応混合物をジクロロメタンで抽出した（4mL/mmoleで3回）。有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物をシリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0%から5%メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。

【0497】

式（I、A = 1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル； $R^1 = H$ 、 $R^2 = NH_2$ ）の2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-アミン類【化149】



【0498】

この化合物を、言及した一般合成に従って、例えば2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-カルボン酸2.87g（11.8mmol）から製造した。これによって、標題化合物2.06g（理論量の収率81%；HPLC-MSによる純度98%）を得た。

10

【0499】

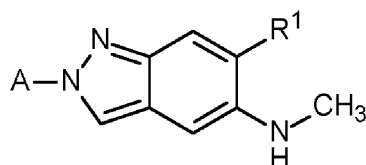
APCI MS、 $m/z = 214 [M+H]^+$ 。

【0500】

式（I、 $R^2 = NHCH_3$ ）のN-メチル-2-（ヘタリール）-2H-インダゾール-5-アミン類の一般合成

方法A：

【化150】



20

【0501】

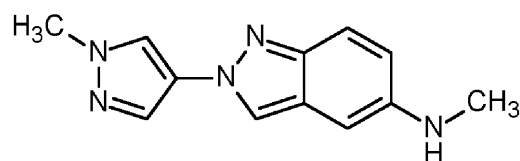
5当量のナトリウムおよびメタノール（5mL/mmole）から調製してあったナトリウムメトキシド溶液を、メタノール（50mL/mmole）中の相当する式（I、 $R^2 = NH_2$ ）の2-（ヘタリール）-2H-インダゾール-5-アミンおよび5当量のパラホルムアルデヒドからなる懸濁液に加えた。反応混合物を環流温度で1時間攪拌し、5当量の水素化ホウ素ナトリウムを加えた。反応混合物をさらに30分間攪拌し、冷却して室温とした。1M水酸化ナトリウム溶液（50mL/mmole）を加え、反応混合物をジクロロメタンで抽出した（50mL/mmoleで3回）。合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。

30

【0502】

式（I、A = 1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル； $R^1 = H$ 、 $R^2 = NH_2$ ）のN-メチル-2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-アミン類

【化151】



40

【0503】

例えば、言及した一般合成に従って、2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-アミン9.90g（4.6mmol）から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物1.20g（理論値の収率100%；HPLC-MSによる純度99%）を得た。

【0504】

50

A P C I MS、 $m/z = 228 [M+H]^+$ 。

【0505】

方法B：

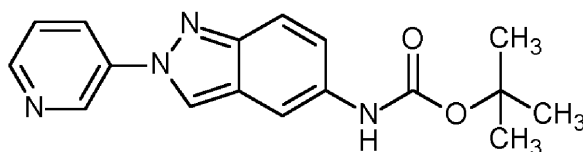
段階1：

保護ガス（アルゴン）雰囲気下に、5-ブロモ-2-（ヘタリール）-2H-インダゾール類（化合物49、段階2参照）を脱水1，4-ジオキサン（3 mL/mm ol）に溶かし、1.2当量のtert-ブチルカーバメート、2当量の炭酸セシウム、0.05当量のトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウムおよび0.1当量のXantphosを加えた。反応混合物を環流温度で6時間攪拌し、そして冷却して室温とした。水（3 mL/mm ol）を加え、反応混合物を酢酸エチルで抽出した（3 mL/mm olで3回）。有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、シリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0%から7%メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。 10

【0506】

式（I-f、A=ピリジン-3-イル-； $R^1 = H$ 、 $R^2 = NH-CO-C(CH_3)_3$ ）のtert-ブチル（2-（2-ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）カーバメート類

【化152】



【0507】

例えば、言及した一般合成に従って、5-ブロモ-2-（ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール2.47 g（9 mm ol）から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物1.67 g（理論値の収率60%；HPLC-MSによる純度98%）を得た。

【0508】

A P C I MS、 $m/z = 311 [M+H]^+$ 。

【0509】

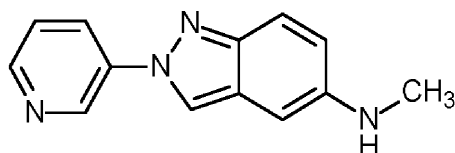
段階2：

保護ガス（アルゴン）雰囲気下に、tert-ブチル（2-ヘタリール）-2H-インダゾール-5-イル）カーバメート類を脱水テトラヒドロフラン（20 mL/mm ol）に溶かし、2.5当量の水素化リチウムアルミニウムを短時間で加えた。反応混合物を環流温度で10時間攪拌し、追加の1当量の水素化リチウムアルミニウムを加え、混合物を環流温度でさらに20時間攪拌した。1 M水酸化ナトリウム水溶液（1 mL/mm ol）を加え、混合物を濾過した。濾液を減圧下に濃縮し、残った残留物をジクロロメタン（10 mL/mm ol）に取った。得られた溶液を炭酸ナトリウム水溶液（10 mL/mm ol）で洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、シリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0%から5%メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。 40

【0510】

式（I、A=ピリジン-3-イル-； $R^1 = H$ 、 $R^2 = NH_2$ ）のN-メチル-（2-ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-アミン類

【化 1 5 3】



【0 5 1 1】

例えば、言及した一般合成に従って、tert-ブチル（2-（2-ピリジン-3-イル）-2H-インダゾール-5-イル）カーバメート 1.67 g（5.4 mmol）から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物 686 mg（理論値の収率 57%；HPLC-MS による純度 93%）を得た。

10

【0 5 1 2】

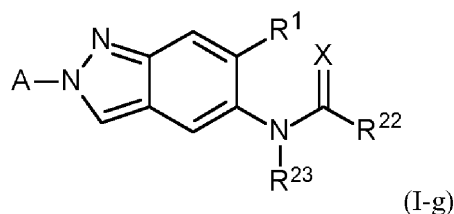
APCI MS、 $m/z = 225 [M+H]^+$ 。

【0 5 1 3】

式（I-g）の化合物の一般合成

方法 A：

【化 1 5 4】



20

【0 5 1 4】

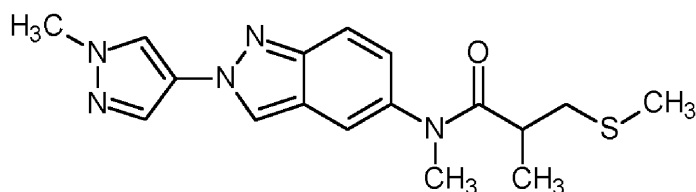
式（I、A = ヘタリール； $R^1 = H$ 、 $R^2 = NH-CH_3$ ）の個々の N-メチル-2-（ヘタリール）-2H-インダゾール-5-アミン類を脱水ジクロロメタン（5 mL/mmole）に溶かし、0℃で攪拌しながら、1.2 当量の適切な酸、2.4 当量のジイソプロピルエチルアミン（ヒューニッヒ塩基）および 1.5 当量の 50% 強度プロピルホスホン酸無水物（T3P）/テトラヒドロフラン溶液を加えた。反応混合物を 0℃でさらに 30 分間、次に室温で 20 時間攪拌した。反応が終了した後、反応混合物をジクロロメタン（5 mL/mmole）に溶かし、最初に炭酸カリウム水溶液（5 mL/mmole）で、次に水（5 mL/mmole）で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、シリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0% から 5% メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。

30

【0 5 1 5】

実施例 105：N，2-ジメチル-N-（2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-イル）-3-（メチルチオ）プロパンアミド

【化 1 5 5】



40

【0 5 1 6】

例えば、言及した一般合成に従って、2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-アミン 300 mg（1.3 mmol）から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物 389 mg（理論値の収率 86%；HPLC-MS による純度 98%）を得た。

50

【0517】

A P C I MS、 $m/z = 344$ $[M+H]^+$ 。

【0518】

^1H NMR (300MHz、DMSO- d_6) $\delta = 0.99$ (3H、d、 $J = 6.4$ Hz)、 1.79 (3H、s)、 2.30 (1H、dd、 $J_1 = 11.8$ Hz、 $J_2 = 4.9$ Hz)、 $2.57 - 2.77$ (2H、m)、 3.21 (3H、s)、 3.93 (3H、s)、 7.22 (1H、dd、 $J_1 = 9.0$ Hz、 $J_2 = 1.7$ Hz)、 $7.71 - 7.81$ (2H、m)、 8.08 (1H、s)、 8.43 (1H、s)、 8.86 (1H、s) ppm。

【0519】

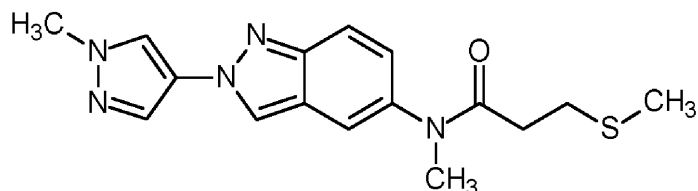
方法B：

0℃で、1.2当量のピリジンを、脱水ジクロロメタン (10mL/mmole) 中の式 (I、A=ヘタリール； $R^1 = \text{H}$ 、 $R^2 = \text{NH-CH}_3$) の個々のN-メチル-2-(ヘタリール)-2H-インダゾール-5-アミン類に加えた。1.1当量の適切な酸塩化物を滴下し、反応混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物を水で洗浄した (5mL/mmoleで2回)。有機相を脱水し、硫酸マグネシウムで濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、HPLCによって精製した。

【0520】

実施例106：N-メチル-N-(2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-3-(メチルチオ)プロパンアミド

【化156】



【0521】

例えば、言及した一般合成に従って、2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2H-インダゾール-5-アミン300mg (1.3mmole) から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物452mg (理論値の収率100%；HPLC-MSによる純度97%) を得た。

【0522】

A P C I MS、 $m/z = 330$ $[M+H]^+$ 。

【0523】

^1H NMR (300MHz、DMSO- d_6) $\delta = 1.88$ (3H、s)、 2.34 (2H、t、 $J = 7.1$ Hz)、 2.62 (2H、t、 $J = 7.1$ Hz)、 3.20 (3H、s)、 3.93 (3H、s)、 7.21 (1H、dd、 $J_1 = 8.9$ Hz、 $J_2 = 1.5$ Hz)、 $7.70 - 7.79$ (2H、m)、 8.08 (1H、s)、 8.44 (1H、s)、 8.85 (1H、s)。

【0524】

表1および2で列記の化合物107から113を、同様にして製造した。

【0525】

方法C：

式 (I、A=ヘタリール； $R^1 = \text{H}$ 、 $R^2 = \text{NH-CH}_3$) の個々のN-メチル-2-(ヘタリール)-2H-インダゾール-5-アミンを、N,N-ジメチルホルムアミド (3mL/mmole) 中で攪拌し、1.0当量の適切なカルボン酸、1.1当量の1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt)、1.1当量のジイソプロピルエチルアミン (ヒューニツヒ塩基) および1.1当量の1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)

10

20

30

40

50

カルボジイミド（EDCI）を加え、混合物を60℃で8時間攪拌した。次に、反応混合物をジクロロメタン（5mL/mmole）に溶かし、水で洗浄した（5mL/mmoleで3回）。有機相を脱水し、硫酸マグネシウムで濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、HPLCによって精製した。

【0526】

表1および2で列記の化合物114から118を、同様にして製造した。

【0527】

一般的スルホニル酸化方法

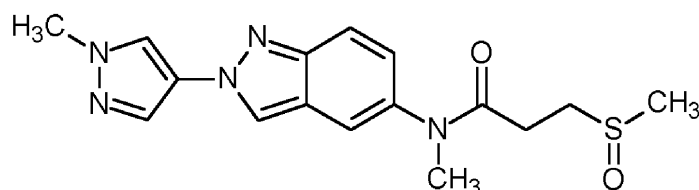
0.9当量の過ホウ酸ナトリウム水和物（ $\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$ ）を個々のアミドの水酢酸中溶液（5mL/mmole）に加え、反応混合物を60℃で1時間攪拌した。飽和重炭酸ナトリウム溶液を、ガス発生が停止するまで加えた。反応混合物を酢酸エチルで抽出した（5mL/mmoleで3回）。有機相を脱水し、硫酸マグネシウムで濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、シリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0%から5%メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。

【0528】

実施例119：N-メチル-N-（2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-イル）-3-（メチルスルフィニル）

プロパンアミド

【化157】



【0529】

例えば、言及した一般合成に従って、N-メチル-N-（2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-イル）-3-（メチルチオ）プロパンアミド80mg（0.24mmole）から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物452mg（理論値の収率85%；HPLC-MSによる純度86%）を得た。

【0530】

APCI MS、 $m/z = 346$ $[\text{M}+\text{H}]^+$ 。

【0531】

^1H NMR（300MHz、 $\text{DMSO}-d_6$ ） $\delta = 2.55$ （3H、s）、2.59–2.72（2H、m）、2.79–2.90（1H、m）、3.05–3.18（1H、m）、3.33（3H、s）、4.00（3H、s）、7.10（1H、dd、 $J_1 = 9.0\text{Hz}$ 、 $J_2 = 1.9\text{Hz}$ ）、7.54（1H、d、 $J = 1.3\text{Hz}$ ）、7.80（1H、d、 $J = 9.0\text{Hz}$ ）、7.89（1H、s）、7.94（1H、s）、8.22（1H、s）ppm。

【0532】

表1および2で列記の化合物120から124を、同様にして製造した。

一般的スルホニル酸化法

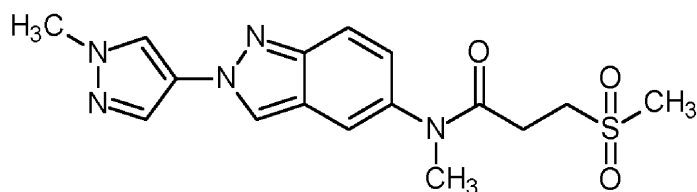
2.2当量の過ホウ酸ナトリウム水和物（ $\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$ ）を個々のアミドの水酢酸中溶液（5mL/mmole）に加え、反応混合物を60℃で1時間攪拌した。飽和重炭酸ナトリウム溶液を、ガス発生が停止するまで加えた。反応混合物を酢酸エチルで抽出した（5mL/mmoleで3回）。有機相を脱水し、硫酸マグネシウムで濾過し、減圧下で濃縮した。残った粗生成物を、シリカゲルカラムで精製した（使用した移動相は、0%から5%メタノール/ジクロロメタンの勾配であった。）。

【0533】

実施例125：N-メチル-N-（2-（1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル）-2H-インダゾール-5-イル）-3-（メチルスルホニル）

プロパンアミド

【化158】



【0534】

例えば、言及した一般合成に従って、N-メチルーN-(2-(1-メチルー1H-ピラゾール-4-イル)-2H-インダゾール-5-イル)-3-(メチルチオ)プロパンアミド80mg(0.24mmol)から、この化合物を製造した。これによって、標題化合物60mg(理論値の収率68%;HPLC-MSによる純度97%)を得た。

【0535】

APCI MS、 $m/z = 362 [M+H]^+$ 。

【0536】

^1H NMR(300MHz、DMSO- d_6) $\delta = 2.70$ (2H、t、 $J = 7.2$ Hz)、 2.94 (3H、s)、 3.35 (3H、s)、 3.40 (2H、t、 $J = 7.2$ Hz)、 4.03 (3H、s)、 7.12 (1H、dd、 $J_1 = 9.0$ Hz、 $J_2 = 1.6$ Hz)、 7.57 (1H、s)、 7.83 (1H、d、 $J = 8.8$ Hz)、 7.92 (1H、s)、 7.97 (1H、s)、 8.25 (1H、s) ppm。

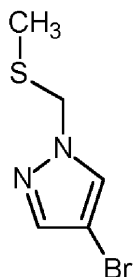
【0537】

表1および2で列記の化合物126から130を、同様にして製造した。

中間体の合成：

4-ブロモ-1-[(メチルスルファニル)メチル]-1H-ピラゾール

【化159】



【0538】

0℃で、水素化ナトリウム41mg(1.02mmol)を、4-ブロモ-1H-ピラゾール100mg(0.68mmol)の純粋ジメチルホルムアミド中溶液に短時間で加えた。反応混合物を室温で15分間攪拌し、クロロジメチルスルフィド0.11mL(1.4mmol)を加え、混合物を室温で一晩攪拌した。水を加え、混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。これによって、4-ブロモ-1-[(メチルスルファニル)メチル]-1H-ピラゾール100mg(純度93%、収率66%)を得た。

【0539】

^1H -NMR(400.0MHz、 d_6 -DMSO)： ^1H -NMR(400.0MHz、 d_6 -DMSO)： $\delta = 8.069$ (4.4)； 7.591 (3.9)； 5.242 (10.2)； 3.319 (8.9)； 2.502 (15.8)； 2.157 (0.5)； 2.121 (16.0)； 2.029 (0.4)； 2.024 (0.5)； 1.236 (0.4)； 0.002 (7.1)； 0.000 (10.0)。

【0540】

4-メチルー3-((2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル)安息香酸メチ

10

20

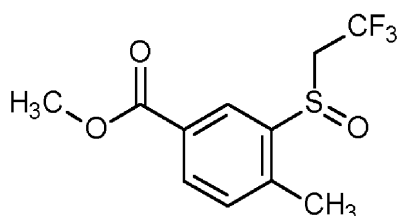
30

40

50

ル

【化 1 6 0】



【0 5 4 1】

段階 1：4-メチル-3-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)安息香酸メチルの合成 10

炭酸カリウム 1.07 g (7.8 mmol) および 2, 2, 2-トリフルオロエチルヨージド 5.61 μ L (1.1 mmol) を、3-メルカプト-4-メチル安息香酸メチル (WO 2010/094695 A1 での製造を参照) 943 mg (5.17 mmol) の DMF (15 mL) 中溶液に加えた。反応混合物を室温で 20 時間攪拌した。次に、反応混合物を水 50 mL で希釈し、ジクロロメタン 50 mL で 2 回抽出した。合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。残った粗生成物を、フラッシュクロマトグラフィーによって精製した (使用した移動相は、0% から 10% 酢酸エチル/n-ヘプタンの勾配であった。)。これによって、4-メチル-3-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)安息香酸メチル 990 mg (純度：93%；収率 72%) を得た。 20

【0 5 4 2】

APCI MS、 $m/z = 265 [M+H]^+$ 。

【0 5 4 3】

段階 2：

過ホウ酸ナトリウム水和物 ($\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$) 559 mg (3.6 mmol；1.0 当量) を、4-メチル-3-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)安息香酸メチル 960 mg (3.6 mmol) の (27 mL) 中溶液に加え、反応混合物を 60°C で 1 時間攪拌した。飽和重炭酸ナトリウムを、ガス発生が停止するまで加えた。次に、反応混合物を酢酸エチルで抽出した (30 mL/mmole で 3 回)。有機相を脱水し、硫酸マグネシウムで濾過し、減圧下で濃縮した。これによって、4-メチル-3-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)安息香酸メチル 1.08 g (純度：96%；収率 100%) を得た。 30

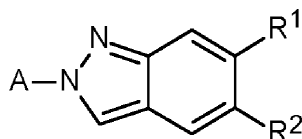
【0 5 4 4】

APCI MS、 $m/z = 281 [M+H]^+$ 。

【0 5 4 5】

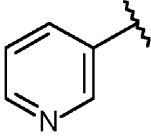
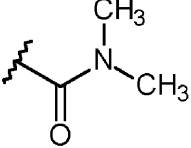
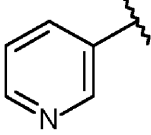
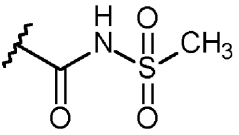
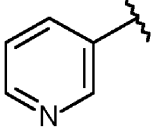
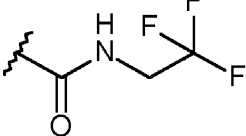
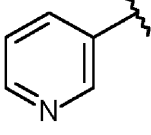
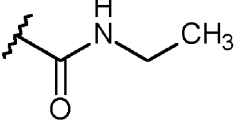
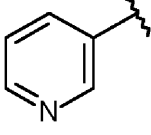
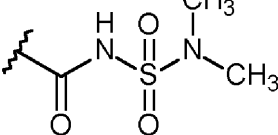
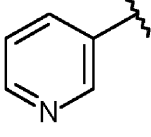
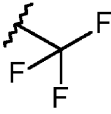
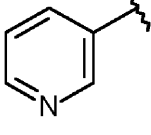
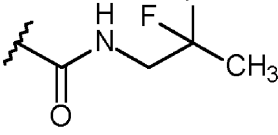
式 (I) の化合物、さらには式 (I) によって包含されない化合物を、下記の表で列記している。その式 (I) によって包含されない化合物も、本発明の主題の一部を形成するものである。

【化 1 6 1】



40

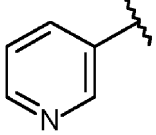
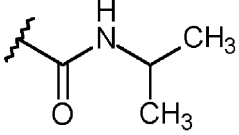
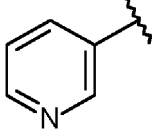
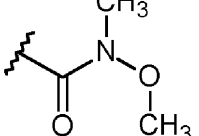
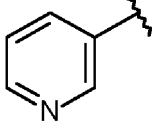
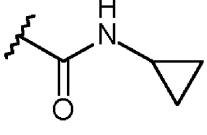
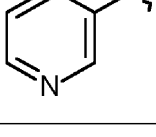
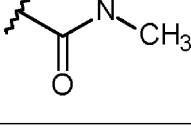
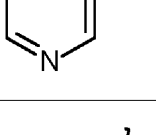
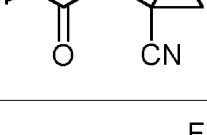
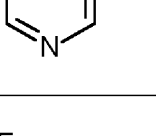
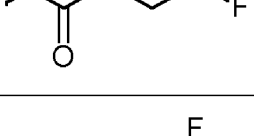
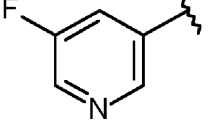
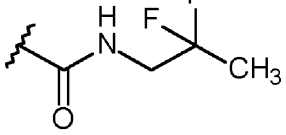
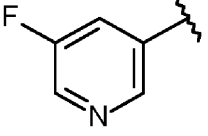
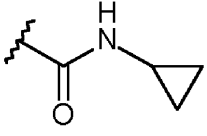
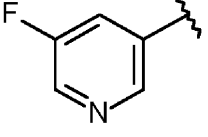
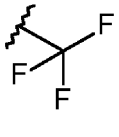
【表 1】

化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
1		H		105,6	94,4
2		H		89,4	94,7
3		H		144,4	97,7
4 *)		H		11,5	98,9
5 *)		H		17,2	86,4
6 *)		H		30,0	99,1
7 *)		H		51,3	98,4

10

20

30

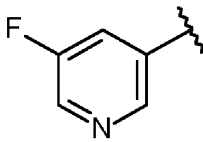
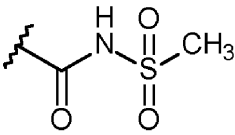
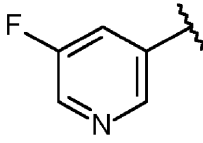
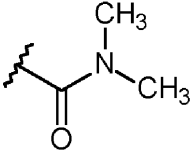
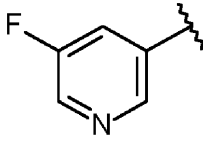
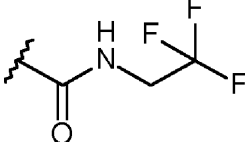
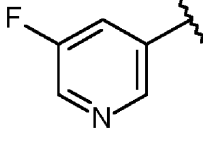
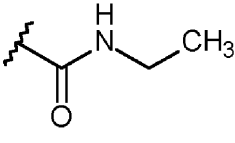
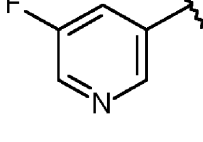
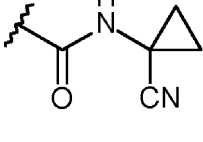
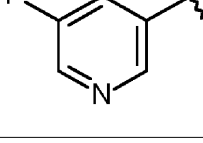
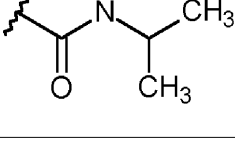
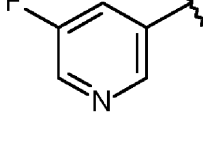
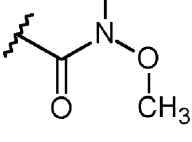
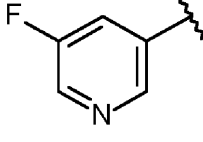
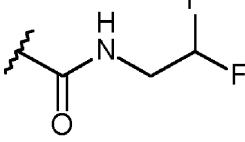
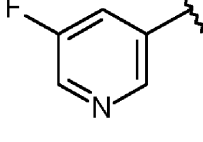
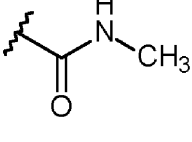
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
8 *)		H		32,6	99,4
9 *)		H		43,6	97,2
10 *)		H		33,7	99,3
11 *)		H		54,4	99,9
12 *)		H		56,7	99,2
13 *)		H		41,2	99,1
14 *)		H		41,5	99,8
15 *)		H		41,6	99,0
16		H		45,9	96,9

10

20

30

40

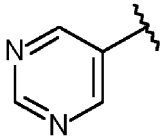
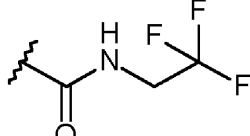
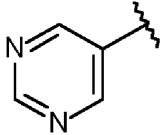
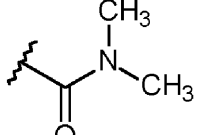
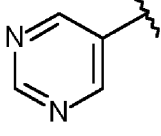
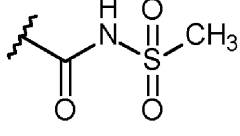
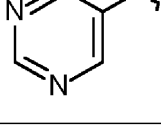
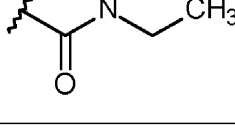
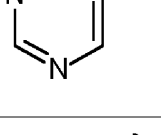
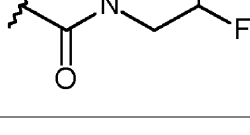
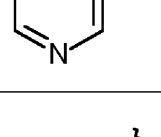
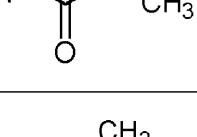
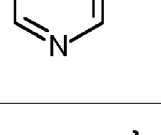
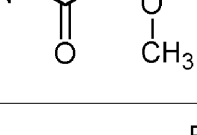
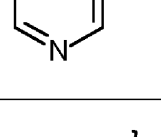
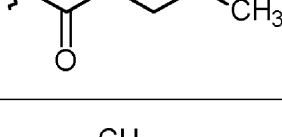
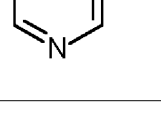
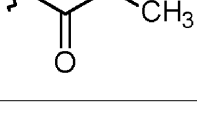
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
17		H		97,5	97,1
18		H		138,4	96,3
19		H		96,3	98,5
20 *)		H		32,1	95,8
21*)		H		23,8	95,9
22 *)		H		55,2	98,7
23 *)		H		40,2	98,2
24 *)		H		33,1	96,6
25 *)		H		67,3	100

10

20

30

40

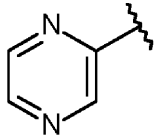
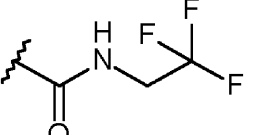
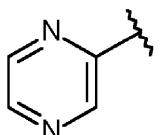
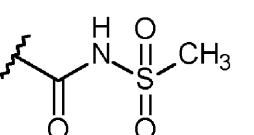
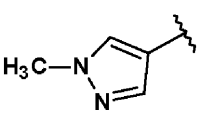
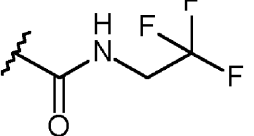
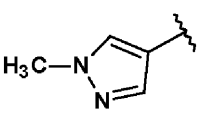
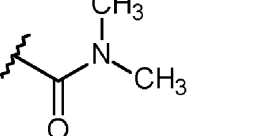
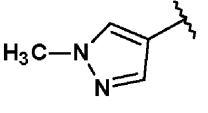
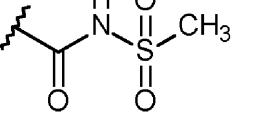
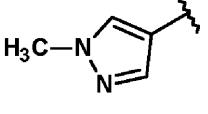
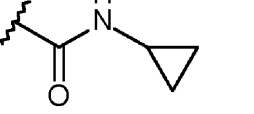
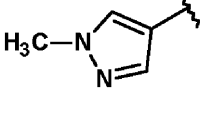
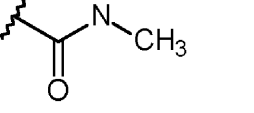
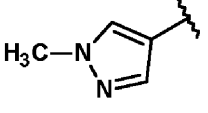
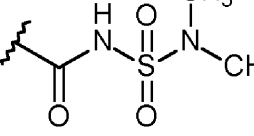
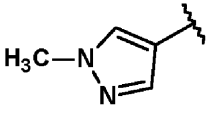
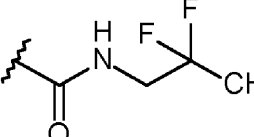
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
26		H		64,3	91,8
27		H		45,6	96,5
28		H		67,2	96,8
29		H		35,6	85,8
30		H		10,9	87,1
31		H		14,3	85,8
32		H		11,7	86,5
33		H		12,6	94,0
34		H		76,2	94,4

10

20

30

40

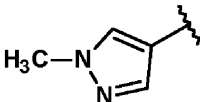
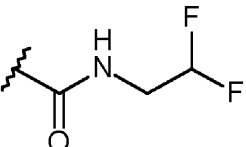
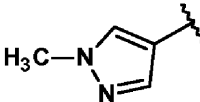
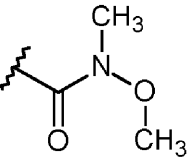
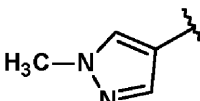
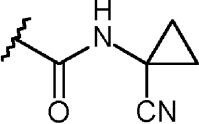
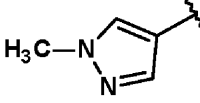
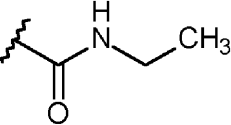
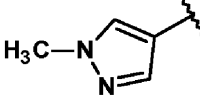
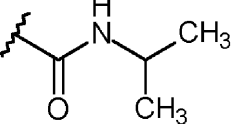
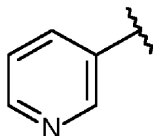
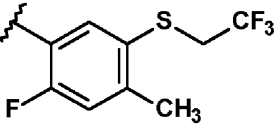
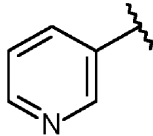
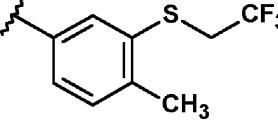
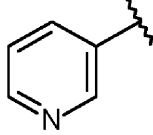
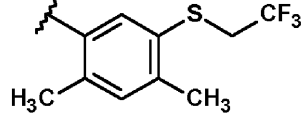
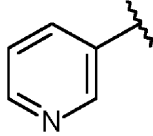
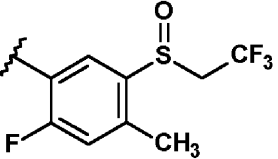
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
35		H		106,5	98,4
36		H		259,8	91,9
37		H		78,7	96,7
38		H		80,5	99,7
39		H		51,8	92,8
40		H		53,7	99,2
41		H		60,4	99,6
42		H		37,7	100
43		H		67,4	99,4

10

20

30

40

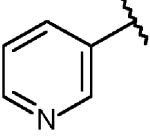
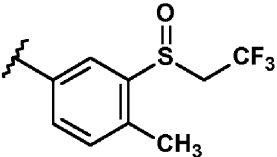
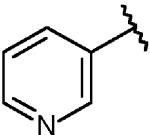
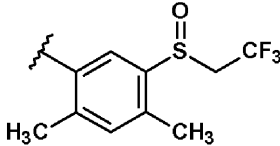
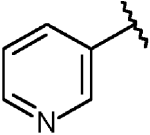
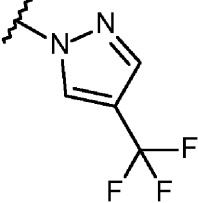
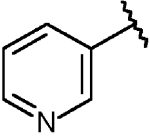
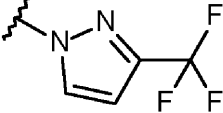
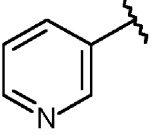
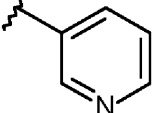
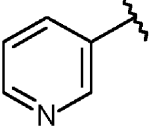
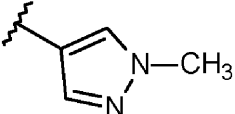
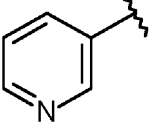
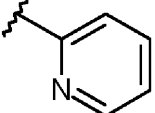
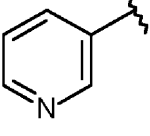
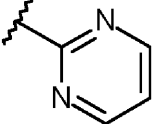
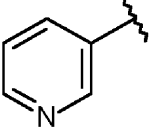
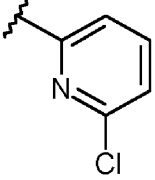
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
44		H		78,3	98,5
45		H		64,7	98,6
46		H		78,5	98,7
47		H		62,7	99,4
48		H		65,3	98,4
49		H		392	93
50		H		149	97
51		H		37	98
52		H		60	100

10

20

30

40

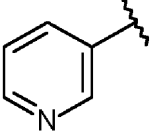
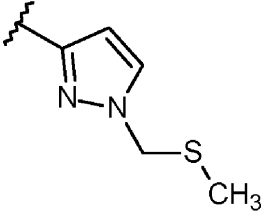
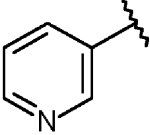
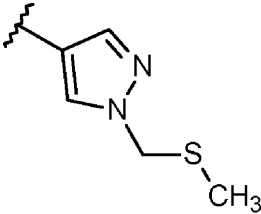
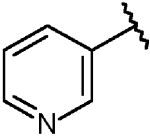
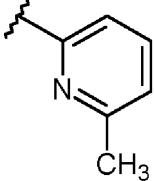
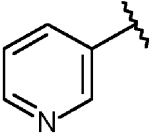
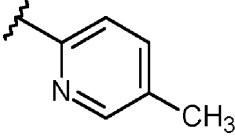
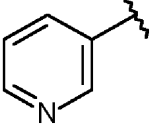
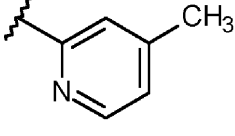
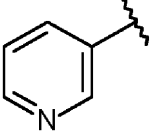
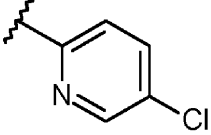
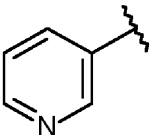
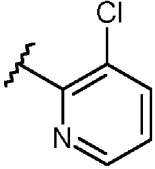
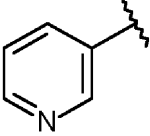
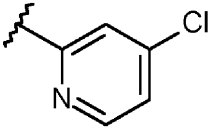
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
53		H		64	100
54		H		54	100
55		H		17	94
56		H		167	100
57		H		80	100
58		H		26	100
59		H		25	100
60		H		60	96
61		H		56	100

10

20

30

40

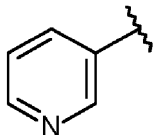
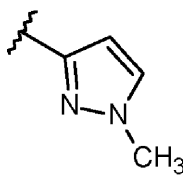
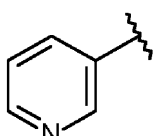
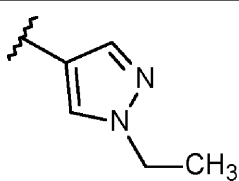
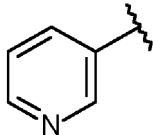
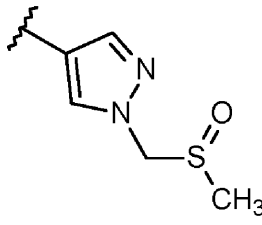
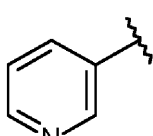
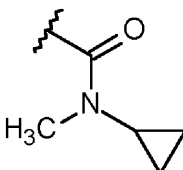
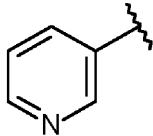
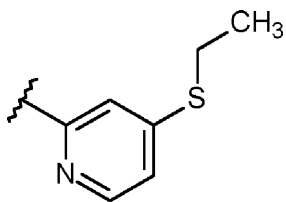
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
62		H		10	97
63		H		62	100
64		H		34	96
65		H		40	98
66		H		49	100
67		H		73	97
68		H		55	97
69		H		46	100

10

20

30

40

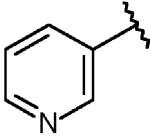
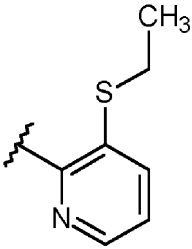
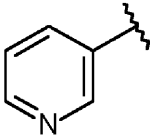
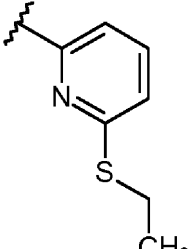
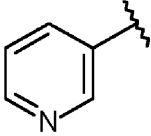
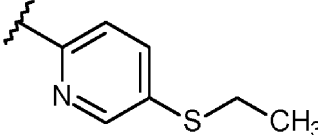
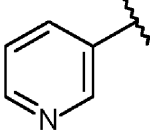
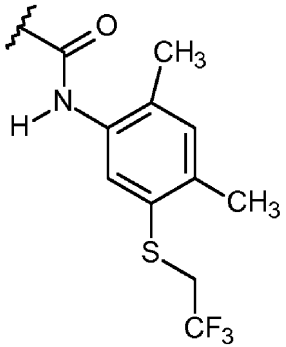
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
71		H		39	98
73		H		21	100
74		H		55	91
75		H		43	100
76		H		38	100

10

20

30

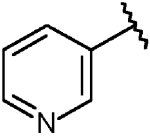
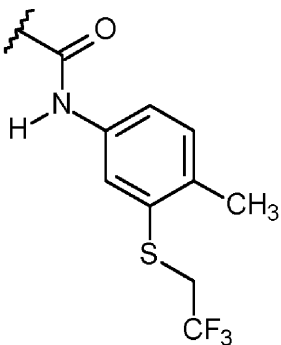
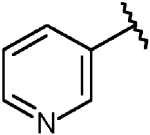
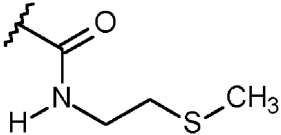
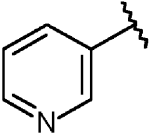
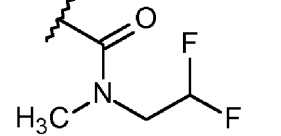
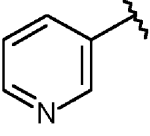
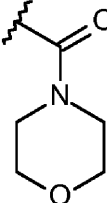
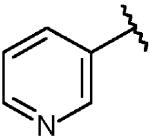
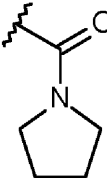
40

化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
77		H		37	100
79		H		100	96
80		H		32	97
81		H		28	90

10

20

30

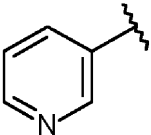
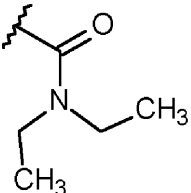
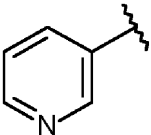
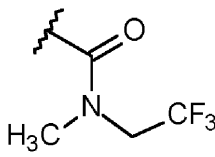
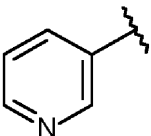
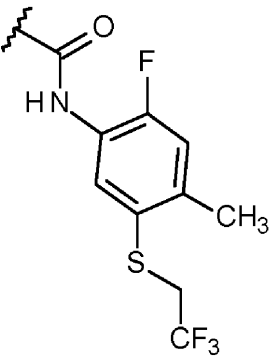
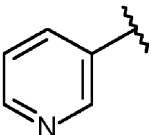
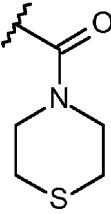
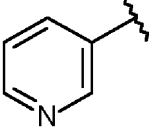
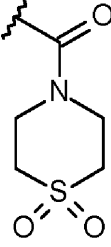
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
82		H		32	99
85		H		48	100
86		H		55	100
87		H		81	100
88		H		11	100

10

20

30

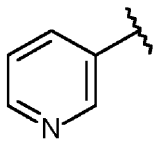
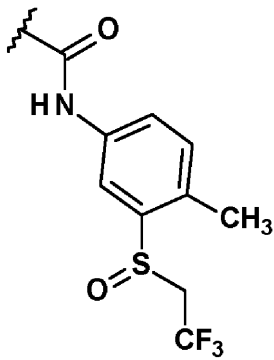
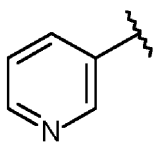
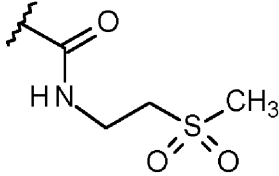
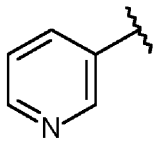
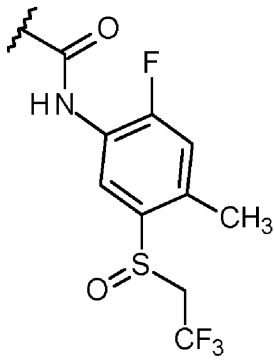
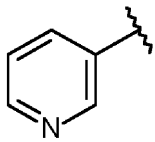
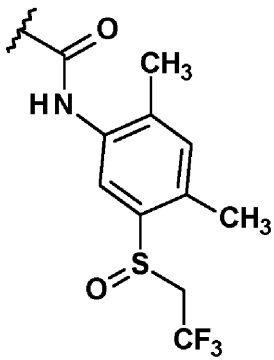
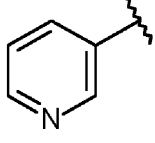
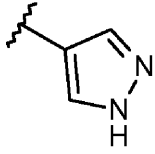
40

化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
89		H		12	100
90		H		65	100
91		H		93	99
92		H		79	100
93		H		49	100

10

20

30

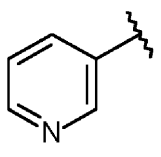
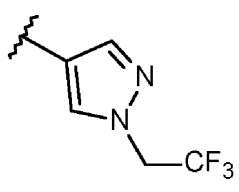
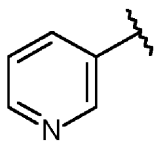
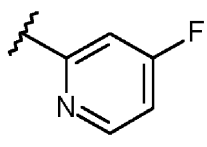
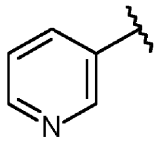
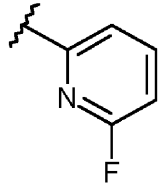
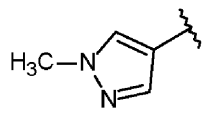
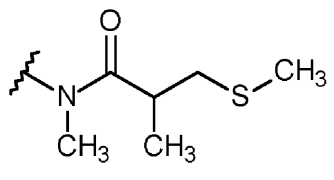
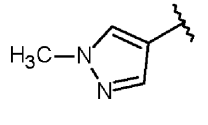
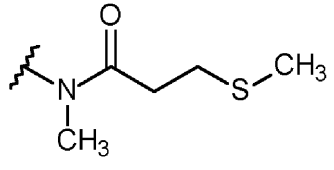
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
94		H		37	95
95		H		59	100
96		H		51	95
97		H		15	97
98		H		35	100

10

20

30

40

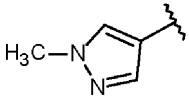
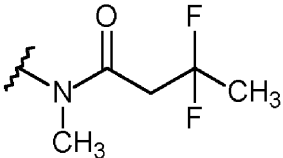
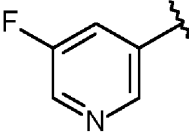
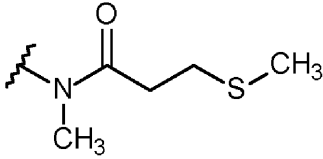
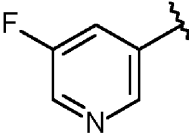
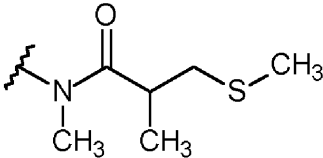
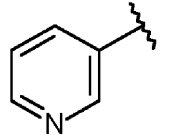
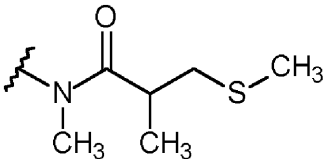
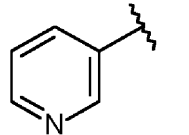
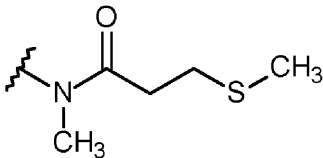
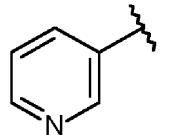
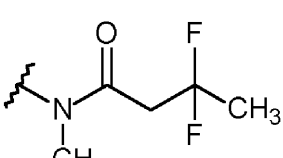
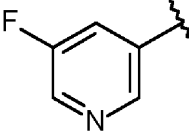
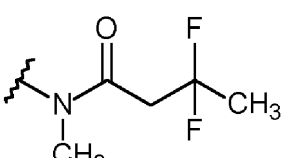
化合物番号	A	R ¹	R ²	収率 [単位mg]	純度: [単位%]
99		H		35	100
101		H			
104		H			
105		H		40,8	98
106		H		54,5	97

10

20

30

40

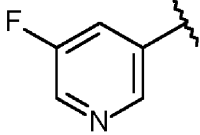
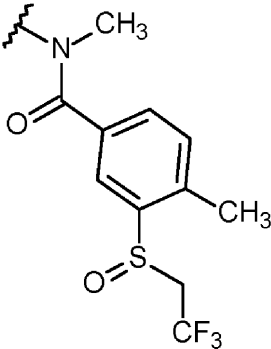
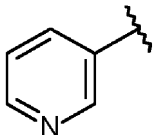
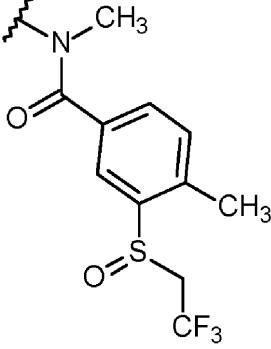
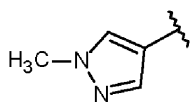
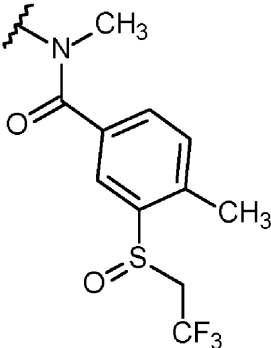
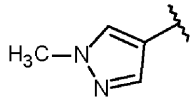
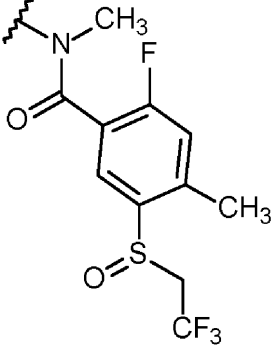
107		H		59,7	98
108		H		58,4	98
109		H		41,3	100
110		H		50,9	97
111		H		42,1	98
112		H		44,4	99
113		H		34,2	89

10

20

30

40

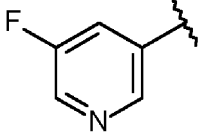
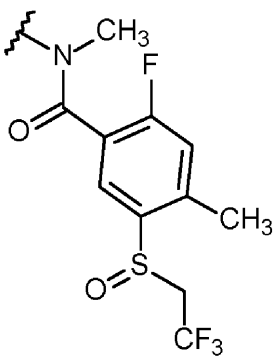
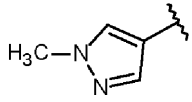
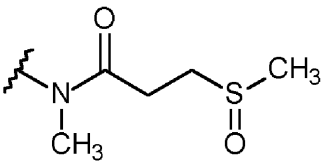
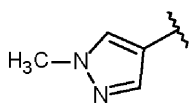
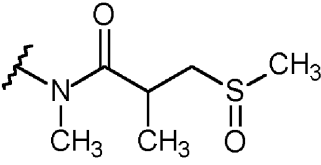
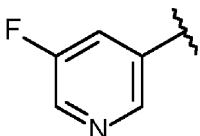
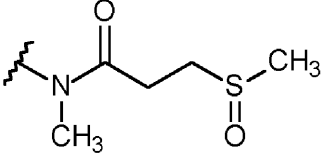
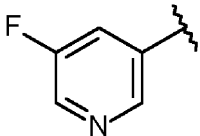
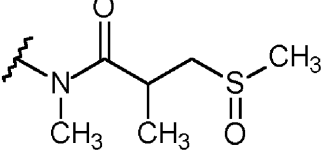
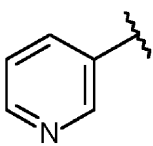
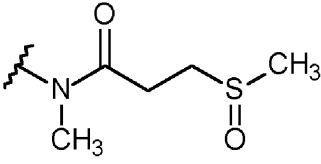
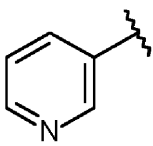
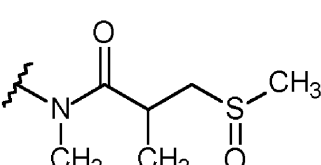
114		H		42,4	89
115		H		44	99
116		H		42,4	89
117		H		45,5	96

10

20

30

40

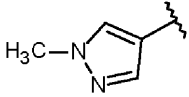
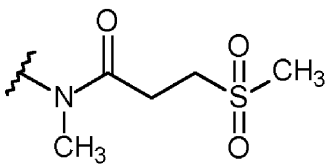
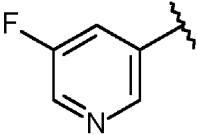
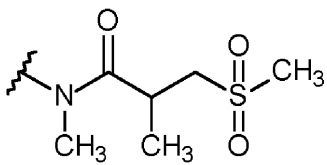
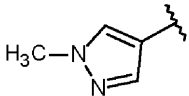
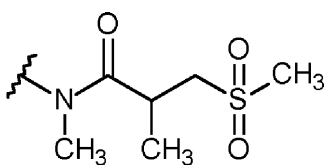
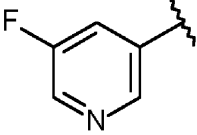
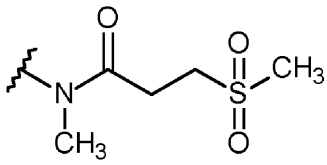
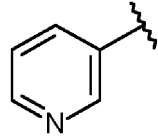
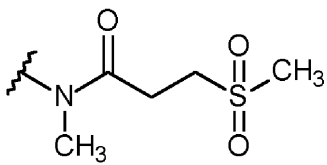
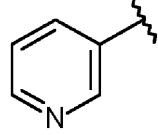
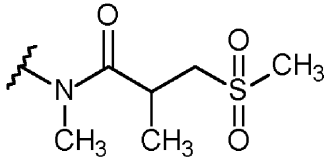
118		H		42,9	94
119		H		43,7	86
120		H		60,1	95
121		H		45,6	85
122		H		42,6	99
123		H		42,9	98
124 ^{*)}		H		55,7	100

10

20

30

40

125		H		59,9	97
126 ^{**})		H		73,3	97
127 ^{**})		H		54	98
128		H		44,2	95
129		H		41,3	100
130		H		42,7	100

【0546】

*) 1×HCOOHで結晶化する；**) 1×CH₃COOHで結晶化する。

【0547】

表2

報告の化合物1から48および105から128についての分析データ

【表 2】

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
1	1,725	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,01 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7,36; 7,67; 7,79; 7,88; 8,50; 8,67; 9,29; 9,34 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 267.1 (M+1); 266.29 (計算値)
2	1,203	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,23 (s, 3H, CH ₃); 7,66; 7,76; 7,86; 7,52; 8,68; 9,36; 9,44 (8H, =CH, アリール/ヘタリール); 12,4 (br. 1H, NH). LC-MS = 317.1 (M+1); 316.33 (計算値)
3	1,203	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 4,13 (m, 2H, CH ₂); 7,67; 7,83; 8,51; 8,54; 8,69; 9,17; 9,36; 9,45 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 320.9 (M ⁺); 320.26 (計算値)
4	2,391	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,15; 3,4 (t+ m, 5H, CH ₂ CH ₃); 7,66; 7,78; 8,36; 8,53; 8,67; 9,35; 9,39 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 267.3 (M+1)[HCOOH なし]
5	2,875	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,34 (s, 3H, CH ₃); 7,67; 7,81; 8,53; 8,58; 8,68; 9,36; 9,48 (8H, =CH, アリール/ヘタリール); 11,9 (br. 1H, NH). LC-MS = 346.1 (M+1) [HCOOH なし]
6	2,881	¹ H-NMR(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,53; 7,90; 8,11; 8,31; 8,61; 8,73; 9,21 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 364.0 (M+1); 263.21 (計算値)
7	2,319	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,64; 3,76 (t+ m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7,66; 7,81; 8,45; 8,52; 8,68; 8,92; 9,36; 9,42 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 317.1 (M+1)[HCOOH なし]
8	2,536	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,19; 4,12 (d+ m, 7H, CH(CH ₃)); 7,67; 7,79; 8,31; 8,37; 8,51; 8,68; 8,67; 9,37 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 281.3 (M+1)[HCOOH なし]
9	2,448	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,34; 3,57 (2s 6H, 2xCH ₃); 7,53; 7,66; 7,76; 8,13; 8,50; 8,67; 9,33 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 283.2 (M+1) [HCOOH なし]
10	2,422	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 0,60; 0,69, 2,86 (3m 5H, シクロプロピル); 7,65; 7,76; 8,33; 8,51; 8,66; 9,35; 9,38 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 279.3 (M+1) [HCOOH なし]
11	2,261	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,81 (s 3H, CH ₃); 7,66; 7,78; 8,35; 8,51; 8,67; 9,35; 9,40 (8H, =CH, アリール/ヘタリール).

10

20

30

40

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
		LC-MS = 253.2 (M+1)[HCOOH なし]
12	2,017	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,81 (s 3H, CH ₃); 7,67; 7,79; 8,40; 8,52; 8,68; 9,36; 9,40; 9,44 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 304.2 (M+1)[HCOOH なし]
13	2,497	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,72; 6,16 (2m 3H, CH ₂ CHF ₂); 7,67; 7,82; 8,44; 8,53; 8,68; 8,95; 9,36; 9,43 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 303.2 (M+1)[HCOOH なし]
14	2,342	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,64; 3,76 (t+m 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7,79; 7,83; 8,44; 8,54; 8,71; 8,91; 9,29; 9,46 (8H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 335.1 (M+1)[HCOOH なし]
15	3,106	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 0,60; 0,70; 2,86 (3m 5H, シクロプロピル); 7,74; 7,78; 8,33; 8,55; 8,71; 9,28; 9,42 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 297.0 (M+1)[HCOOH なし]
16	2,902	¹ H-NMR(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,53; 7,88; 8,10; 8,14; 8,58; 8,63; 9,04 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 282.0 (M+1); 281.20(計算値)
17	3,142	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,1 (s, 3H, CH ₃); 7,72; 7,91; 8,49; 8,55; 8,71; 9,29; 9,45 (7H, =CH, アリール/ヘタリール), 12,3 (br, 1H, NH). LC-MS = 335.0 (M+1); 334.32(計算値)
18	1,983	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,01 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7,37; 7,79; 7,89; 8,54; 8,72; 9,28; 9,35 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 385.1 (M+1); 284.28(計算値)
19	2,745	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 4,13 (m, 2H, CH ₂); 7,83; 8,47; 8,56; 8,72; 9,18; 9,30; 9,48 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 339.1 (M+1); 338.25(計算値)
20	2,962	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,15; 3,31 (t+q, 5H, CH ₂ CH ₃); 7,76; 7,80; 8,36; 8,53; 8,71; 9,29; 9,43 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 285.0 (M+1)[HCOOH なし]
21	2,248	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,32; 1,58 (2m, 4H, CH ₂ CH ₂); 8,54; 8,55; 8,57; 8,73; 9,29; 9,41; 9,48 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 322.2 (M+1)[HCOOH なし]
22	2,820	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,19; 4,12 (d+m, 7H, CH(CH ₃)); 7,76; 7,81; 8,37; 8,56; 8,71; 9,29; 9,42 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 299.2 (M+1)[HCOOH なし]
23	2,732	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,30; 3,57 (d+m, 7H, CH(CH ₃)); 7,53; 7,76; 8,13; 8,54; 8,72; 9,27; 9,39

10

20

30

40

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
		(7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 301.2 (M+1) [HCOOH なし]
24	2,781	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,70; 6,16 (2m 3H, CH ₂ CHF ₂); 7,82; 8,44; 8,56; 8,72; 8,96; 9,29; 9.47 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 321.2 (M+1) [HCOOH なし]
25	2,344	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,81 (s, 3H, CH ₃); 7,78; 7,82; 8,35; 8,55; 8,71; 9,28; 9.44 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 271.0 (M+1) [HCOOH なし]
26	2,132	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 4,14 (m, 2H, CH ₂); 7,83; 8,49; 9,18; 9,30; 9,37; 9.51; 9,58 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 322.0 (M+1); 321.25 (計算値)
27	1,768	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,99 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7,35; 7,37; 7,78; 7,89; 9,27; 9.34; 9,54 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 268.1 (M+1); 267.28 (計算値)
28	2,349	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,87 (s, 3H, CH ₃); 7,63; 7,98; 8,40; 9,26; 9,37; 9.55 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 318.2 (M+1); 317.32 (計算値)
29	1,872	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,87 (s, 3H, CH ₃); 7,80; 8,38; 8,56; 9,29; 9,46; 9.57 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 268.2 (M+1); 267.28 (計算値)
30	1,969	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,87 (s, 3H, CH ₃); 7,83; 8,45; 8,95; 9,29; 9,49; 9.57 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 304.2 (M+1); 303.26 (計算値)
31	1,967	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,81 (s, 3H, CH ₃); 7,80; 8,37; 8,52; 9,28; 9,46; 9.56 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 254.1 (M+1); 253.25 (計算値)
32	1,895	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,30; 3,57 (2s, 6H, 2xCH ₃); 7,55; 8,79; 8,15; 9,29; 9,40; 9.55 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 284.2 (M+1); 283.28 (計算値)
33	2,031	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,64; 3,77 (t+m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7,82; 8,46; 8,92; 9,29; 9,48; 9.57 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 318.1 (M+1); 317.29 (計算値)
34	2,034	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,00 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7,38; 7,80; 7,91; 8,71; 8,79; 9.34; 9,50 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 268.0 (M+1); 267.28 (計算値)

10

20

30

40

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
35	2,322	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 4,12 (m, 2H, CH ₂); 7,83; 7,48; 7,72; 8,80; 9,20; 9,50 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 322.1 (M+1); 321.25 (計算値)
36	2,042	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,86 (s, 3H, CH ₃); 7,63; 7,97; 8,46; 8,68; 8,76; 9,35; 9,48 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 318.0 (M+1); 317.32 (計算値)
37	2,447	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,92 (s, 3H, CH ₃); 4,11 (m, 2H, CH ₂); 7,71; 7,77; 8,10; 8,44; 9,02; 9,09 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 324.0 (M+1); 323.27 (計算値)
38	1,690	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,99 (s, 6H, 2 x CH ₃); 3,92 (s, 3H, CH ₃); 7,29; 7,68; 7,82; 8,08; 8,43; 8,87 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 270.1 (M+1); 269.30 (計算値)
39	1,037	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,39; 3,93 (2s, 6H, 2 x CH ₃); 7,74; 8,12; 8,48; 8,53; 9,09 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 320.0 (M+1); 319.33 (計算値)
40	1,997	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 0,59; 0,69; 2,85 (3m, 5H, シクロプロピル); 3,92 (s, 3H, CH ₃); 7,66; 7,73; 8,09; 8,27; 8,45; 8,96 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 282,1 (M+1); 281.31 (計算値)
41	1,843	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,80; 3,92; (2s, 6H, 2xCH ₃); 7,67; 7,73; 8,09; 8,29; 8,45; 8,98 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 282,1 (M+1); 255.27 (計算値)
42	1,695	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2,89; 3,92; (2s, 6H, 2xCH ₃); 7,71; 7,75; 7,76; 8,12; 8,48; 9,06 (6H, =CH, アリール/ヘタリール), 11,79 (br, 1H, NH). LC-MS = 349,1 (M+1); 348.38 (計算値)
43	2,350	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,63; 3,76 (t+m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 3,92 (s, 1H, CH ₃); 7,74; 8,10; 8,38; 8,46; 8,84; 9,00 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 320,1 (M+1); 319.3093
44	2,454	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,68; 6,14 (2m, 3H, CH ₂ CHF ₂); 3,92 (s, 1H, CH ₃); 7,75; 8,10; 8,37; 8,45; 8,88; 9,01 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 306,1 (M+1); 305.28 (計算値)
45	2,033	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 3,28; 3,33; 3,92 (2s, 9H, 3xCH ₃); 3,92 (s, 1H, CH ₃); 7,49; 7,68; 8,09; 8,44; 8,93 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 286,1 (M+1); 285.30 (計算値)
46	2,053	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,29; 1,56; (2m, 4H, 2xCH ₂); 3,92 (s, 1H, CH ₃); 7,71; 8,10; 8,34; 8,46;

10

20

30

40

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
		9,02; 9,34 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 307,1 (M+1); 306.32 (計算値)
47	1,968	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,14; 3,29; (t+q, 5H, CH ₂ CH ₃); 3,92 (s, 1H, CH ₃); 7,67; 7,75; 8,09; 8,30; 8,49; 8,97 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 270,1 (M+1); 269.30 (計算値)
48	2,127	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,18; 4,13 (d+m, 5H, CH(CH ₃) ₂); 3,92 (s, 3H, CH ₃); 7,70; 8,09; 8,24; 8,31; 8,45; 8,95 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 284,2 (M+3); 283.32(計算値)
105		¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 0,99 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.79 (3H, s), 2.30 (1H, dd, JI=11.8 Hz, J2=4.9 Hz), 2.57-2.77 (2H, m), 3.21 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.22 (1H, dd, JI=9.0 Hz, J2=1.7 Hz), 7.71-7.81 (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.43 (1H, s), 8.86 (1H, s).
106	1,10	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 1.88 (3H, s), 2.34 (2H, t, J=7.1 Hz), 2.62 (2H, t, J=7.1 Hz), 3.20 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.21 (1H, dd, JI=8.9 Hz, J2=1.5 Hz), 7.70-7.79 (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.85 (1H, s). LC-MS = 330,2 (M+1); 329,42(計算値)
108	1,20	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,22; 1,89; 2,34; 2,62; 3,21 (アルキル); 7,30; 7,83; 5,52; 8,70; 9,26; 9,30 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 345,2 (M+1); 344,41 (計算値)
109	1,26	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 0,99; 1,02; 1,81; 2,69-2,73; 3,21 (アルキル); 7,29; 7,32; 7,82; 7,84; 7,87; 8,51; 8,54; 8,71; 8,72; 9,27; 9,32 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 359,2 (M+1); 358,44(計算値)
119	1,16	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 2.55 (3H, s), 2.59-2.72 (2H, m), 2.79-2.90 (1H, m), 3.05-3.18 (1H, m), 3.33 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.10 (1H, dd, JI=9.0 Hz, J2=1.9 Hz), 7.54 (1H, d, J=1.3 Hz), 7.80 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.89 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.22 (1H, s). LC-MS = 346,2 (M+1); 345,42(計算値)
120	0,86	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ = 1,13; 1,21; 2,50; 3,14; 3,25; 3,33; 3,99 (アルキル); 7,12-7,18; 7,55-7,8; 8,23 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 360,2 (M+1); 359,45 (計算値)
121	0,94	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ = 1,25; 1,62; (アルキル); 7,14; 7,60; 7,84; 8,09; 8,12; 8,51; 8,56; 9,02 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 361,2 (M+1); 360,41(計算値)
125	0,90	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 2.70 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.94 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.40 (2H, t, J=7.2 Hz), 4.03 (3H, s), 7.12 (1H, dd, JI=9.0 Hz, J2=1.6 Hz), 7.57 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.92 (1H, s), 7.97

10

20

30

40

実施例番号	保持時間[分]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
		(1H, s), 8.25 (1H, s) LC-MS = 362,2 (M+1); 361,42 (計算値)
126	1,05	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,05; 1,07; 1,76; 2,86; 3,21 (アルキル); 7,32; 7,35; 7,85; 7,88; 8,51; 8,55; 8,71; 9,27; 9,34 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 490,1 (M+1); [CH ₃ COOH なし]
127	0,92	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 1,04; 1,78; 2,96; 3,92 (アルキル); 7,24; 7,75; 7,78; 8,08; 8,43; 8,88 (6H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 376,1 (M+1); [CH ₃ COOH なし]
128	2,12	¹ H-NMR(300,0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ = 2,69; 2,94; 3,38; 3,42 (アルキル); 7,15; 7,60; 7,86; 7,89; 8,12; 8,55; 9,01 (7H, =CH, アリール/ヘタリール). LC-MS = 377,1 (M+1); 376,41 (計算値)

10

【 0 5 4 8 】

表 3

報告の化合物 4 9 から 1 0 4 についての分析データ

【表 3】

20

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
49	4,23	4,11	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,374 (3,5); 9,367 (3,5); 9,306 (5,9); 9,305 (5,9); 8,686 (2,4); 8,682 (2,6); 8,674 (2,5); 8,671 (2,6); 8,541 (1,3); 8,537 (1,5); 8,534 (1,5); 8,531 (1,3); 8,520 (1,5); 8,516 (1,5); 8,513 (1,7); 8,510 (1,4); 8,228 (0,3); 7,975 (3,7); 7,860 (2,7); 7,837 (3,1); 7,774 (3,1); 7,754 (3,2); 7,687 (1,9); 7,675 (1,9); 7,666 (1,9); 7,655 (1,9); 7,558 (1,3); 7,553 (2,2); 7,549 (1,3); 7,535 (1,1); 7,531 (2,0); 7,527 (1,1); 7,338 (2,8); 7,309 (2,7); 4,066 (1,3); 4,040 (4,2); 4,014 (4,4); 3,988 (1,5); 3,335 (28,4); 2,893 (0,4); 2,528 (0,5); 2,514 (12,2); 2,510 (24,6); 2,505 (32,5); 2,501 (24,0); 2,496 (11,9); 2,453 (16,0); 2,406 (0,4); 1,397 (1,7).
50	4,12	4,07	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,377 (3,4); 9,371 (3,5); 9,274 (5,9); 9,272 (6,2); 8,678 (2,3); 8,675 (2,6); 8,666 (2,5); 8,663 (2,7); 8,542 (1,4); 8,539 (1,6); 8,536 (1,6); 8,532 (1,4); 8,522 (1,5); 8,518 (1,6); 8,515 (1,7); 8,511 (1,5); 8,072 (4,1); 7,858 (2,7); 7,855 (2,3); 7,851 (3,7); 7,847 (3,9); 7,835 (3,6); 7,731 (2,9); 7,727 (2,9); 7,708 (2,1); 7,704 (2,1); 7,681 (1,9); 7,669 (1,9); 7,660 (1,9); 7,648 (1,9); 7,587 (1,9); 7,583 (1,9); 7,568 (2,3); 7,563 (2,3); 7,380 (3,2); 7,360 (2,6); 4,171 (1,3); 4,145 (4,3); 4,119 (4,4); 4,093 (1,5); 3,349 (0,4); 3,334 (63,3); 2,673 (0,3); 2,526 (0,8); 2,513 (18,3); 2,509 (37,9); 2,504 (50,6); 2,499 (37,8); 2,495 (19,1); 2,416 (16,0); 2,331 (0,3); 1,397 (0,4).
51	4,42	4,40	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,366 (3,2); 9,359 (3,2); 9,247 (5,6); 9,245 (5,6); 8,679 (2,2); 8,676 (2,4); 8,667 (2,3); 8,664 (2,4); 8,533 (1,3); 8,529 (1,5); 8,526

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			(1,5); 8,523 (1,3); 8,512 (1,4); 8,508 (1,5); 8,505 (1,6); 8,502 (1,4); 7,810 (2,7); 7,788 (3,0); 7,706 (4,1); 7,681 (1,8); 7,670 (1,7); 7,661 (1,7); 7,649 (1,7); 7,441 (5,8); 7,352 (2,5); 7,348 (2,5); 7,329 (2,3); 7,325 (2,4); 7,236 (4,8); 3,979 (1,3); 3,953 (4,0); 3,927 (4,2); 3,901 (1,4); 3,335 (13,6); 2,528 (0,4); 2,524 (0,6); 2,515 (8,4); 2,510 (17,5); 2,506 (23,5); 2,501 (17,5); 2,497 (8,7); 2,409 (14,6); 2,242 (16,0); 0,000 (1,1).
52	2,80	2,74	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,377 (3,5); 9,371 (3,5); 9,323 (6,1); 9,321 (5,9); 8,692 (2,5); 8,688 (2,7); 8,680 (2,6); 8,677 (2,7); 8,545 (1,4); 8,541 (1,6); 8,538 (1,5); 8,535 (1,4); 8,524 (1,6); 8,521 (1,6); 8,518 (1,7); 8,514 (1,4); 8,059 (7,0); 8,039 (3,4); 7,900 (2,8); 7,878 (3,3); 7,693 (1,9); 7,692 (1,9); 7,681 (1,8); 7,673 (1,8); 7,661 (1,8); 7,660 (1,8); 7,613 (1,3); 7,609 (2,3); 7,605 (1,3); 7,591 (1,2); 7,587 (2,0); 7,582 (1,1); 7,447 (2,6); 7,418 (2,5); 4,298 (0,5); 4,288 (0,5); 4,271 (0,7); 4,261 (1,7); 4,243 (0,4); 4,233 (2,1); 4,203 (1,8); 4,193 (0,6); 4,175 (0,6); 4,166 (0,6); 3,329 (42,3); 2,677 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,525 (1,4); 2,512 (28,8); 2,508 (57,1); 2,503 (74,6); 2,499 (54,0); 2,494 (25,9); 2,451 (16,0); 2,334 (0,4); 2,330 (0,5); 2,325 (0,4); 1,990 (0,7); 1,176 (0,4); 0,008 (1,4); 0,000 (41,3); -0,009 (1,3).
53	2,72	2,68	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,379 (3,6); 9,373 (3,7); 9,294 (6,2); 9,293 (6,0); 8,686 (2,5); 8,683 (2,7); 8,674 (2,7); 8,671 (2,7); 8,546 (1,4); 8,542 (1,7); 8,539 (1,6); 8,536 (1,4); 8,525 (1,6); 8,521 (1,7); 8,518 (1,8); 8,515 (1,5); 8,196 (4,0); 8,191 (4,2); 8,144 (4,2); 7,910 (2,1); 7,900 (2,9); 7,890 (2,4); 7,885 (2,4); 7,877 (3,7); 7,778 (2,9); 7,774 (2,8); 7,755 (2,0); 7,751 (2,0); 7,689 (1,9); 7,677 (1,9); 7,669 (1,9); 7,657 (1,8); 7,485 (3,0); 7,465 (2,7); 4,257 (0,4); 4,247 (0,6); 4,230 (0,8); 4,220 (1,9); 4,206 (1,8); 4,193 (2,0); 4,178 (2,0); 4,166 (0,8); 4,151 (0,7); 4,142 (0,4); 3,331 (136,6); 2,676 (0,5); 2,672 (0,7); 2,667 (0,5); 2,525 (1,9); 2,512 (38,7); 2,507 (77,7); 2,503 (102,1); 2,498 (75,9); 2,494 (38,6); 2,437 (16,0); 2,334 (0,5); 2,330 (0,7); 2,325 (0,5); 1,989 (0,6); 0,008 (0,5); 0,000 (14,6); -0,008 (0,7).
54	2,99	2,92	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,371 (3,3); 9,365 (3,5); 9,263 (5,7); 8,681 (2,5); 8,672 (2,5); 8,669 (2,6); 8,536 (1,6); 8,534 (1,6); 8,515 (1,7); 8,513 (1,7); 8,510 (1,4); 7,847 (2,6); 7,825 (2,9); 7,788 (4,4); 7,753 (6,3); 7,687 (1,8); 7,675 (1,8); 7,666 (1,8); 7,654 (1,7); 7,404 (2,3); 7,400 (2,4); 7,381 (2,2); 7,378 (2,2); 7,331 (4,8); 4,173 (1,1); 4,146 (3,4); 4,118 (3,5); 4,091 (1,2); 3,329 (83,0); 2,672 (0,9); 2,562 (0,3); 2,507 (107,3); 2,503 (138,4); 2,498 (111,3); 2,403 (14,9); 2,341 (16,0); 1,989 (0,6); 0,146 (0,9); 0,000 (175,9); -0,150 (0,9). 0,000 (16,1); -0,008 (0,6)
55	2,77	2,74	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,379 (2,7); 9,361 (13,4); 9,259 (7,9); 9,210 (0,4); 8,695 (2,3); 8,686 (2,4); 8,550 (2,2); 8,547 (2,6); 8,544 (2,5); 8,541 (2,1); 8,529 (2,4); 8,526 (2,6); 8,523 (2,7); 8,520 (2,2); 8,285 (8,4);

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			8,237 (9,1); 7,947 (16,0); 7,943 (15,7); 7,693 (2,6); 7,681 (2,6); 7,672 (2,6); 7,660 (2,5); 5,759 (0,7); 3,333 (56,9); 2,678 (0,5); 2,673 (0,7); 2,527 (2,0); 2,513 (40,5); 2,509 (79,4); 2,505 (102,3); 2,500 (75,1); 2,336 (0,5); 2,331 (0,6); 1,245 (0,5); 1,230 (0,5); 0,146 (0,9); 0,022 (0,5); 0,008 (8,3); 0,000 (189,5); -0,009 (7,9); -0,150 (1,0).
56	2,83	2,79	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,375 (8,8); 9,368 (8,8); 9,346 (16,0); 8,809 (7,3); 8,806 (7,4); 8,699 (5,9); 8,696 (6,4); 8,688 (6,1); 8,684 (6,3); 8,547 (3,4); 8,543 (3,9); 8,540 (3,8); 8,537 (3,4); 8,526 (3,7); 8,522 (3,9); 8,519 (4,1); 8,516 (3,4); 8,318 (0,5); 8,277 (9,1); 8,274 (8,8); 7,968 (3,2); 7,944 (11,9); 7,930 (9,9); 7,925 (9,3); 7,907 (2,6); 7,902 (2,8); 7,695 (4,7); 7,683 (4,6); 7,674 (4,6); 7,662 (4,4); 7,076 (8,5); 7,070 (8,5); 3,332 (215,6); 2,677 (0,9); 2,673 (1,2); 2,669 (0,9); 2,526 (3,4); 2,513 (66,6); 2,508 (131,4); 2,504 (171,9); 2,499 (127,4); 2,335 (0,8); 2,331 (1,2); 2,326 (0,8); 1,990 (0,6); 0,000 (0,7).
57	0,88	1,71	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,384 (9,1); 9,377 (9,3); 9,309 (16,0); 8,988 (8,7); 8,983 (8,9); 8,685 (5,7); 8,682 (6,6); 8,673 (6,1); 8,670 (6,6); 8,591 (5,6); 8,587 (6,3); 8,579 (6,0); 8,575 (6,2); 8,554 (3,3); 8,550 (3,9); 8,547 (4,0); 8,544 (3,5); 8,533 (3,6); 8,529 (4,0); 8,527 (4,3); 8,523 (3,6); 8,318 (0,3); 8,179 (3,3); 8,173 (4,8); 8,169 (3,6); 8,154 (15,7); 7,898 (6,3); 7,876 (8,7); 7,754 (7,1); 7,750 (7,3); 7,732 (5,3); 7,727 (5,5); 7,686 (5,1); 7,674 (5,0); 7,665 (5,0); 7,653 (4,8); 7,528 (4,8); 7,516 (4,7); 7,508 (4,6); 7,496 (4,4); 3,332 (103,5); 2,677 (0,7); 2,673 (0,9); 2,669 (0,7); 2,526 (2,4); 2,508 (102,3); 2,504 (136,8); 2,499 (104,3); 2,335 (0,6); 2,331 (0,9); 2,326 (0,7); 1,990 (0,4); 1,259 (0,4); 1,250 (0,3); 1,230 (0,5); 0,000 (5,7).
58	1,51	1,57	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,349 (2,4); 9,343 (2,4); 9,149 (4,2); 9,147 (4,1); 8,656 (1,7); 8,653 (1,8); 8,645 (1,8); 8,641 (1,8); 8,511 (1,0); 8,507 (1,2); 8,504 (1,1); 8,501 (1,0); 8,490 (1,1); 8,486 (1,2); 8,483 (1,2); 8,480 (1,0); 8,199 (4,4); 7,943 (4,6); 7,942 (4,5); 7,913 (3,2); 7,757 (1,8); 7,735 (2,5); 7,664 (1,3); 7,663 (1,3); 7,652 (1,3); 7,643 (1,3); 7,631 (1,3); 7,630 (1,3); 7,618 (2,1); 7,614 (2,1); 7,596 (1,6); 7,592 (1,6); 3,885 (16,0); 3,334 (44,0); 2,526 (0,9); 2,512 (17,3); 2,508 (34,2); 2,504 (44,4); 2,499 (32,6); 2,495 (16,2); 1,232 (0,8); 0,000 (7,6).
59	1,13	1,93	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,378 (9,5); 9,371 (9,4); 9,330 (15,8); 9,329 (16,0); 8,697 (5,2); 8,695 (5,4); 8,684 (11,3); 8,681 (10,9); 8,672 (6,8); 8,669 (6,8); 8,548 (3,8); 8,544 (4,4); 8,541 (4,4); 8,537 (4,3); 8,527 (14,6); 8,520 (5,2); 8,517 (3,9); 8,318 (0,6); 8,167 (6,3); 8,163 (6,1); 8,144 (7,2); 8,140 (7,2); 8,078 (6,7); 8,058 (8,6); 7,926 (3,6); 7,921 (3,6); 7,906 (5,6); 7,902 (5,5); 7,887 (3,1); 7,883 (3,1); 7,856 (8,5); 7,833 (7,4); 7,686 (5,2); 7,675 (5,0); 7,666 (5,0); 7,654 (4,8); 7,373 (4,1); 7,371 (4,3); 7,359 (4,5); 7,355 (4,3); 7,353 (4,0); 7,342 (3,8); 7,340 (3,8); 3,336 (231,2); 2,677 (1,2); 2,672 (1,6); 2,668 (1,2); 2,526 (4,3); 2,512 (90,3); 2,508 (177,5); 2,503

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			(229,6); 2,499 (167,1); 2,495 (82,5); 2,335 (1,1); 2,330 (1,5); 2,326 (1,1); 2,237 (0,6); 0,008 (2,4); 0,000 (66,9); -0,008 (2,5).
60	1,72	1,73	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,408 (7,7); 9,406 (7,6); 9,373 (4,0); 9,367 (4,0); 8,934 (14,4); 8,922 (16,0); 8,918 (6,0); 8,915 (4,4); 8,695 (2,8); 8,691 (3,0); 8,683 (2,9); 8,679 (3,0); 8,544 (1,8); 8,541 (2,1); 8,538 (2,0); 8,534 (1,8); 8,524 (2,0); 8,520 (2,1); 8,517 (2,2); 8,513 (1,9); 8,418 (3,6); 8,414 (3,5); 8,395 (3,9); 8,391 (3,9); 7,871 (4,3); 7,848 (4,0); 7,694 (2,3); 7,693 (2,3); 7,682 (2,3); 7,681 (2,3); 7,673 (2,3); 7,672 (2,3); 7,661 (2,2); 7,660 (2,2); 7,456 (3,9); 7,443 (7,3); 7,431 (3,8); 5,761 (0,7); 3,340 (50,8); 2,529 (0,6); 2,524 (0,9); 2,516 (14,0); 2,511 (28,9); 2,507 (38,4); 2,502 (27,9); 2,498 (13,6); 0,000 (5,9).
61	2,79	2,80	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,372(9,4);9,366 (9,6);9,351(16,0);9,350(15,8);8,692(6,4);8,688(7,0);8,680(6,8);8,677(7,0);8,555(11,1);8,542(4,0);8,538(4,4);8,535(4,2);8,532(3,8);8,521(4,1);8,517(4,4);8,514(4,6);8,511(3,9);8,315(0,5);8,104(8,0);8,098(6,9);8,094(6,6);8,085(10,7);8,075(7,8);8,071(7,8);7,985(7,3);7,965(12,8);7,946(6,1);7,875(9,0);7,852(7,4);7,691(5,0);7,690(5,0);7,679(4,9);7,670(4,9);7,658(4,7);7,477(10,2);7,458(9,4);3,320(58,1);2,677(0,8);2,672(1,1);2,668(0,8);2,525(2,9);2,512(61,4);2,508(125,1);2,503(166,2);2,499(123,8);2,494(62,2);2,334(0,8);2,330(1,1);2,325(0,8);1,398(4,1);0,146(0,4);0,008(3,0);0,000(90,2);-0,008(3,8);-0,150(0,4)
62	1,97	2,11	¹ H-NMR(601,6 MHz, CDCl ₃): δ= 9,216(1,9);9,212(1,9);9,199(0,3);8,704(1,3);8,702(1,4);8,697(1,4);8,694(1,3);8,554(3,4);8,553(3,3);8,440(0,5);8,323(0,8);8,320(0,9);8,318(0,9);8,316(0,8);8,309(0,9);8,306(1,1);8,304(1,0);8,302(0,9);7,900(3,0);7,882(1,7);7,867(1,8);7,854(0,5);7,814(0,6);7,596(2,8);7,593(2,8);7,537(1,1);7,529(1,2);7,523(1,0);7,515(1,2);7,464(1,7);7,462(1,6);7,449(1,5);7,447(1,5);7,261(23,5);6,412(2,9);6,409(2,8);5,220(8,1);5,210(0,6);5,196(1,3);5,082(0,5);2,289(16,0);2,248(0,8);2,228(0,9);2,200(2,2);1,574(8,2);0,005(0,8);0,000(21,7);-0,006(0,9)
63	2,02		¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,353(2,1);9,347(2,1);9,158(3,6);8,659(1,4);8,656(1,6);8,648(1,5);8,644(1,5);8,515(0,8);8,511(0,9);8,509(0,9);8,505(0,8);8,494(0,9);8,491(0,9);8,488(1,0);8,484(0,8);8,337(3,9);8,031(4,0);7,965(2,6);7,771(1,4);7,748(2,0);7,664(1,2);7,652(1,2);7,645(2,3);7,643(2,6);7,631(1,2);7,623(1,3);7,619(1,3);5,290(8,0);3,322(10,6);2,525(0,5);2,512(9,7);2,508(19,6);2,503(26,1);2,499(19,5);2,494(10,0);2,190(16,0);0,008(0,6);0,000(15,6);-0,008(0,7)
64	1,06	2,41	¹ H-NMR(600,1 MHz, CDCl ₃): δ= 9,217(2,7);9,213(2,7);8,675(1,8);8,674(1,8);8,668(1,9);8,666(1,8);8,532(4,8);8,371(3,5);8,323(1,0);8,321(1,2);8,320(1,2);8,317(1,0);8,309(1,1);8,307(1,3);8,306(1,3);8,303(1,0);8,045(1,7);8,042(1,7);8,030(2,0);8,027(2,0);7,873(2,4);7,858(2,0);7,676(1,3);7,663(2,9);7,650(1,8);7,590(2,6);7,577(1,9);7,514(1,4);7,506(1,4);7,5

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)] または LC-MS [m/z]
			00(1,4);7,493(1,3);7,262(6,2);7,118(2,3);7,106(2,2);2,657(1,6,0);1,652(2,9);0,000(5,3)
65	1,23	2,25	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,371(3,6);9,364(3,6);9,299(6,0);8,678(2,4);8,675(2,6);8,666(2,5);8,663(2,5);8,539(1,5);8,535(1,8);8,528(3,7);8,521(3,4);8,515(1,9);8,512(1,8);8,508(1,4);8,476(4,4);8,141(2,3);8,138(2,2);8,118(2,7);8,115(2,6);7,969(2,8);7,949(3,3);7,833(3,1);7,810(2,8);7,728(1,8);7,723(1,9);7,707(1,6);7,702(1,6);7,680(2,0);7,669(1,9);7,660(1,9);7,648(1,9);3,318(61,0);2,675(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,506(97,9);2,502(126,3);2,498(93,1);2,353(16,0);2,333(0,8);2,329(0,9);2,324(0,7);0,146(0,6);0,008(5,6);0,000(126,5);-0,008(5,1);-0,150(0,6)
66	0,97	2,2	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,377(3,1);9,372(3,2);9,309(5,4);9,307(5,3);8,682(2,2);8,679(2,4);8,670(2,4);8,667(2,4);8,544(1,8);8,540(4,4);8,534(1,7);8,527(3,3);8,523(2,1);8,520(1,8);8,516(2,1);8,513(4,1);8,510(4,1);8,157(2,3);8,153(2,2);8,134(2,6);8,130(2,6);7,907(3,7);7,840(3,0);7,817(2,6);7,683(1,7);7,681(1,7);7,671(1,6);7,670(1,6);7,662(1,7);7,661(1,6);7,650(1,6);7,649(1,6);7,190(2,0);7,189(2,0);7,178(2,0);7,176(2,0);3,326(10,1);2,527(0,4);2,514(9,5);2,509(19,3);2,505(25,5);2,500(19,0);2,496(9,5);2,418(16,0);0,008(1,1);0,000(32,7);-0,008(1,5)
67	2,8	2,78	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,374(8,4);9,369(8,5);9,338(14,7);9,336(14,2);8,724(7,9);8,723(8,3);8,718(8,4);8,717(8,0);8,686(6,0);8,682(6,6);8,674(6,4);8,670(6,5);8,544(12,8);8,542(12,8);8,534(4,1);8,524(3,9);8,520(4,0);8,517(4,3);8,514(3,6);8,314(0,6);8,136(12,2);8,132(7,9);8,113(16,0);8,109(8,4);8,036(8,1);8,029(7,8);8,014(5,4);8,008(5,5);7,862(8,2);7,839(7,1);7,686(4,7);7,684(4,6);7,674(4,5);7,672(4,4);7,665(4,5);7,663(4,4);7,653(4,5);7,651(4,3);7,627(0,5);7,615(0,3);7,598(0,4);3,321(179,5);2,676(1,0);2,672(1,3);2,667(1,0);2,663(0,5);2,525(3,2);2,520(5,0);2,512(71,7);2,507(149,0);2,503(198,9);2,498(144,8);2,494(69,7);2,338(0,4);2,334(0,9);2,329(1,3);2,325(1,0);1,989(0,8);1,176(0,4);0,146(0,4);0,008(2,9);0,000(98,3);-0,009(3,3);-0,150(0,4)
68	2,17	2,21	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,371(8,7);9,365(8,7);9,336(15,4);9,334(16,0);8,689(6,1);8,686(6,8);8,678(6,6);8,674(7,4);8,671(8,5);8,667(8,2);8,659(7,9);8,656(8,0);8,540(3,7);8,537(4,3);8,534(4,2);8,530(3,8);8,520(4,1);8,516(4,3);8,513(4,6);8,509(3,9);8,160(7,5);8,158(10,3);8,157(10,4);8,154(8,5);8,090(7,4);8,086(7,8);8,069(8,2);8,066(8,0);7,851(7,4);7,831(5,4);7,829(9,3);7,827(5,9);7,689(4,8);7,687(5,0);7,677(4,8);7,675(4,9);7,665(10,3);7,661(8,7);7,656(5,3);7,655(5,1);7,642(6,7);7,638(6,9);7,629(0,8);7,617(0,4);7,601(0,5);7,567(0,4);7,552(0,3);7,549(0,3);7,473(8,2);7,462(7,9);7,453(7,6);7,441(7,7);5,756(7,7);3,324(44,9);2,674(0,4);2,528(1,0);2,523(1,6);2,514(19,5);2,510(40,5);2,505(55,7);2,501(42,3);2,496(20,8);2,332(0,4);1,250(0,3);0,008(0,5);0,000(15,6);-0,009(0,5)
69	2,62	2,66	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,382(9,0);9,376(9,2);9,341(16,0);8,687(6,1);8,684(6,6);8,676(6,6);8,673(6,7);8,663(10,4);8,650(10,4);8,619(11,1);8,553(3,6);8,549(4,2);8,

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)] または LC-MS [m/z]
			546(4,1);8,543(3,6);8,532(3,9);8,528(4,3);8,526(4,4);8,522(3,6);8,313(0,6);8,231(10,8);8,227(11,2);8,181(6,0);8,177(6,0);8,158(6,9);8,154(7,0);7,857(8,3);7,834(7,3);7,686(4,9);7,674(4,8);7,665(4,8);7,653(4,6);7,501(6,7);7,496(6,8);7,488(6,5);7,483(6,5);3,316(106,8);2,676(0,9);2,671(1,2);2,667(0,9);2,525(3,7);2,507(133,7);2,502(180,6);2,498(138,2);2,334(0,9);2,329(1,3);2,325(1,0);0,008(1,2);0,000(32,1);-0,008(1,3)
71	1,58		¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,347(2,4);9,340(2,5);9,190(4,2);8,662(1,6);8,659(1,8);8,650(1,7);8,647(1,7);8,511(0,9);8,508(1,1);8,505(1,1);8,502(0,9);8,491(1,0);8,487(1,1);8,484(1,1);8,481(0,9);8,128(3,2);7,885(1,4);7,882(1,4);7,862(2,0);7,859(2,1);7,763(2,5);7,750(3,0);7,744(3,5);7,666(1,3);7,654(1,9);7,646(1,4);7,634(1,2);6,770(3,2);6,765(3,3);6,440(0,7);6,435(0,7);3,904(16,0);3,839(3,7);3,309(16,0);2,670(0,4);2,523(1,2);2,506(48,7);2,501(64,0);2,497(47,7);2,328(0,4);0,008(0,3);0,000(9,5)
73	1,81	1,82	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,348(4,9);9,342(4,9);9,141(8,6);8,652(3,6);8,643(3,5);8,641(3,5);8,506(2,3);8,503(2,3);8,485(2,4);8,482(2,5);8,252(8,9);7,945(9,1);7,920(6,6);7,755(3,3);7,732(4,7);7,661(2,6);7,650(2,7);7,640(2,7);7,629(6,1);7,608(2,8);7,605(2,8);4,196(2,3);4,178(7,1);4,159(7,2);4,141(2,4);3,319(26,8);2,671(0,8);2,502(113,9);2,329(0,7);1,447(7,7);1,428(16,0);1,410(7,6);1,336(0,4);1,250(0,5);0,146(0,5);0,000(95,4);-0,150(0,5)
74	1,17	1,19	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,354(2,8);9,349(3,1);9,172(4,7);8,658(2,2);8,647(2,3);8,512(1,5);8,491(1,6);8,360(0,4);8,274(4,9);8,213(0,4);8,175(5,0);8,014(0,3);7,997(3,8);7,784(1,9);7,761(2,7);7,665(1,7);7,655(3,8);7,645(1,8);7,633(3,2);5,769(0,5);5,755(0,7);5,545(2,1);5,512(2,8);5,325(2,9);5,293(2,2);3,321(17,1);3,075(1,0);2,671(0,4);2,596(16,0);2,503(58,2);2,330(0,4);2,075(0,5);0,000(19,0)
75	1,47	1,5	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,350(3,2);9,343(3,3);9,287(5,6);9,285(5,5);8,681(2,1);8,677(2,3);8,669(2,3);8,666(2,3);8,522(1,2);8,518(1,4);8,515(1,4);8,512(1,3);8,501(1,3);8,497(1,4);8,495(1,5);8,491(1,3);7,978(3,7);7,761(2,5);7,738(2,9);7,677(1,8);7,665(1,7);7,656(1,7);7,644(1,7);7,468(2,0);7,465(2,0);7,446(1,7);7,442(1,8);5,755(3,4);3,319(22,1);3,008(16,0);2,987(1,3);2,978(0,9);2,970(0,7);2,960(0,4);2,672(0,4);2,525(0,7);2,511(19,0);2,507(38,5);2,503(51,1);2,498(37,7);2,494(18,9);0,561(1,8);0,547(1,8);0,458(2,1);0,008(0,8);0,000(23,7);-0,008(1,0)
76	1,62	2,84	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,375(4,2);9,369(4,3);9,309(7,2);8,683(2,9);8,680(3,1);8,672(3,1);8,669(3,1);8,545(6,4);8,534(1,8);8,523(1,9);8,519(2,0);8,516(2,1);8,513(1,7);8,486(4,3);8,473(4,4);8,150(2,8);8,146(2,7);8,127(3,2);8,123(3,1);7,852(5,0);7,850(5,1);7,837(4,0);7,814(3,4);7,685(2,3);7,673(2,2);7,664(2,2);7,652(2,1);7,236(3,1);7,232(3,1);7,223(3,1);7,219(3,0);3,318(62,4);3,232(2,2);3,214(6,9);3,

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)] または LC-MS [m/z]
			195(7,1);3,177(2,3);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,507(87,7);2,502(113,3);2,498(84,3);2,333(0,6);2,329(0,7);2,325(0,5);1,363(7,6);1,345(16,0);1,327(7,4);1,259(0,4);1,250(0,7);1,230(0,6);0,000(2,0)
77	2,53	1,93	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,364(3,9);9,358(4,0);9,306(6,8);9,304(6,7);8,682(2,8);8,678(3,1);8,670(3,0);8,667(3,1);8,534(1,6);8,531(1,9);8,528(1,8);8,524(1,7);8,514(1,8);8,510(1,9);8,507(2,0);8,503(1,7);8,461(3,0);8,458(3,3);8,450(3,3);8,446(3,3);7,989(4,8);7,987(3,8);7,883(2,7);7,879(2,8);7,862(3,0);7,859(3,0);7,819(3,3);7,796(3,9);7,685(2,2);7,683(2,2);7,673(2,1);7,672(2,1);7,664(2,1);7,663(2,1);7,652(2,1);7,651(2,0);7,564(3,4);7,560(3,4);7,541(2,9);7,537(3,0);7,396(3,2);7,384(3,0);7,376(2,9);7,364(2,9);5,754(2,5);3,318(64,0);2,983(2,1);2,965(6,8);2,947(6,9);2,928(2,2);2,676(0,5);2,671(0,6);2,667(0,5);2,525(1,7);2,520(2,7);2,511(34,0);2,507(69,0);2,502(92,0);2,498(68,4);2,493(34,2);2,334(0,4);2,329(0,6);2,324(0,4);1,352(1,8);1,336(1,3);1,299(0,4);1,259(0,7);1,250(1,9);1,232(1,8);1,228(1,8);1,208(7,6);1,189(16,0);1,171(7,3);0,000(1,9)
79	3,57	3,57	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,375(3,2);9,369(3,2);9,347(6,5);9,346(6,7);8,683(2,3);8,680(2,4);8,671(2,4);8,669(2,4);8,549(5,0);8,543(2,5);8,539(2,1);8,536(1,9);8,533(1,7);8,522(1,8);8,518(1,9);8,515(2,0);8,512(1,6);8,314(0,4);8,157(2,7);8,153(2,7);8,134(3,1);8,130(3,2);7,866(3,7);7,844(3,2);7,788(1,7);7,786(2,0);7,769(4,7);7,767(4,5);7,751(3,8);7,732(4,8);7,713(1,9);7,685(2,0);7,673(2,0);7,665(2,0);7,652(1,9);7,240(3,4);7,238(3,7);7,221(3,2);7,219(3,4);3,319(52,8);3,305(2,4);3,287(6,8);3,268(6,9);3,250(2,2);2,891(0,5);2,732(0,4);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,525(2,2);2,511(45,8);2,507(91,2);2,502(119,4);2,498(88,9);2,494(44,6);2,334(0,6);2,329(0,8);2,325(0,6);1,419(7,4);1,401(16,0);1,383(7,2);1,232(0,3);0,922(0,4);0,146(0,5);0,008(4,1);0,000(106,0);-0,008(4,7);-0,150(0,5)
80	2,87	3,03	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,371(3,9);9,365(3,9);9,314(6,6);8,681(2,7);8,678(2,9);8,669(2,8);8,666(2,8);8,618(3,8);8,613(3,8);8,540(1,6);8,537(1,8);8,534(1,7);8,530(1,5);8,513(6,5);8,146(2,6);8,142(2,4);8,123(2,9);8,119(2,9);8,039(3,0);8,018(3,9);7,882(3,0);7,876(2,9);7,861(2,4);7,855(2,4);7,845(3,5);7,822(3,0);7,682(2,1);7,671(2,0);7,662(2,0);7,650(2,0);3,318(79,7);3,113(2,3);3,095(7,4);3,076(7,5);3,058(2,5);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,524(2,4);2,511(45,8);2,507(90,2);2,502(117,9);2,498(87,2);2,493(44,0);2,334(0,6);2,329(0,8);2,325(0,6);1,352(0,9);1,336(0,4);1,295(7,8);1,276(16,0);1,258(7,8);1,250(0,9);1,232(1,0);0,000(1,9)
81	3,15	3,12	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,967(3,6);9,462(5,6);9,448(0,4);9,390(3,2);9,384(3,3);8,702(2,3);8,699(2,5);8,690(2,4);8,687(2,5);8,557(5,0);8,539(1,5);8,536(1,8);8,533(1,9);8,529(1,5);7,921(1,4);7,918(1,3);7,899(2,6);7,895(2,6);7,851(3,5);7,828(1,8);7,698(1,8);7,686(1,8);7,678(1,8);7,666(1,7);7,571(5,2);7,208(4,7);4,038(0,4);4,021(0,4);3,892(1,1);3,866(3,5);3,840(3,6);3,814(1,2);3,317(32,3);2,675(0,4);2,

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			671(0,5);2,666(0,4);2,524(1,5);2,510(31,3);2,506(61,7);2,502(81,3);2,497(60,7);2,493(30,4);2,385(14,2);2,333(0,5);2,329(0,6);2,324(0,5);2,226(16,0);2,204(1,4);2,185(0,9);1,988(1,9);1,193(0,5);1,175(1,0);1,158(0,5);0,008(1,4);0,000(38,9);-0,008(1,4)
82	3,22	3,15	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,340(4,2);9,465(6,6);9,464(6,2);9,390(3,5);9,384(3,6);8,705(2,5);8,701(2,7);8,693(2,6);8,689(2,7);8,559(1,5);8,555(1,8);8,552(1,7);8,549(1,6);8,538(6,1);8,535(4,9);8,528(1,7);8,313(0,4);8,005(3,7);8,000(3,8);7,907(1,4);7,903(1,3);7,884(3,8);7,880(4,0);7,861(4,6);7,838(1,6);7,718(2,0);7,713(2,0);7,699(3,3);7,692(2,6);7,689(2,5);7,680(1,9);7,668(1,9);7,667(1,8);7,278(3,1);7,257(2,8);3,916(1,4);3,891(4,5);3,865(4,7);3,839(1,6);3,316(3,7,0);2,676(0,5);2,671(0,7);2,667(0,5);2,524(2,1);2,511(39,5);2,506(79,7);2,502(106,8);2,497(80,0);2,493(39,9);2,370(16,0);2,333(0,6);2,329(0,8);2,324(0,6);1,988(0,8);1,176(0,4);0,008(1,6);0,000(47,8);-0,009(1,7)
85	1,45	1,5	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,411(3,6);9,366(1,8);9,360(1,8);8,700(0,5);8,690(1,8);8,687(2,2);8,678(1,6);8,675(1,7);8,536(0,7);8,532(0,8);8,529(0,8);8,526(0,7);8,515(0,8);8,511(0,9);8,508(0,9);8,505(0,7);8,377(2,5);7,799(2,5);7,795(3,6);7,792(3,1);7,686(1,0);7,674(1,0);7,665(0,9);7,653(0,9);3,514(0,7);3,498(1,5);3,480(1,5);3,464(0,8);3,319(45,1);2,704(1,8);2,685(2,5);2,676(0,4);2,668(1,8);2,525(0,8);2,511(17,8);2,507(36,3);2,502(48,0);2,498(35,2);2,493(17,3);2,122(16,0);0,008(0,6);0,000(20,4);-0,008(0,8)
86	1,55	1,55	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,350(2,9);9,344(3,1);9,311(5,6);8,687(2,3);8,678(2,1);8,675(2,3);8,524(1,2);8,520(1,5);8,517(1,5);8,514(1,4);8,503(1,3);8,499(1,5);8,496(1,6);8,493(1,4);7,912(1,3);7,826(2,6);7,804(2,9);7,683(1,7);7,671(1,7);7,662(1,7);7,650(1,6);7,366(1,0);7,345(0,9);6,295(0,6);5,755(1,1);3,893(0,7);3,323(9,7);3,088(16,0);2,508(22,2);2,504(30,2);2,500(24,3);0,000(5,7)
87	1,14	1,16	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,346(8,9);9,340(9,0);9,303(15,2);9,302(16,0);8,686(5,7);8,683(6,4);8,674(6,0);8,671(6,4);8,520(3,4);8,517(3,9);8,514(3,9);8,510(3,5);8,500(3,7);8,496(3,9);8,493(4,2);8,489(3,6);8,313(0,7);7,896(11,8);7,813(7,2);7,790(8,0);7,680(5,1);7,668(4,9);7,659(4,8);7,647(4,6);7,377(6,8);7,373(7,0);7,354(6,2);7,351(6,5);4,056(0,4);4,038(1,2);4,020(1,2);4,003(0,4);3,628(10,1);3,548(4,7);3,415(0,3);3,355(0,4);3,339(0,6);3,315(198,6);2,716(0,5);2,675(1,4);2,671(1,9);2,666(1,4);2,662(0,7);2,565(0,4);2,524(4,8);2,510(94,3);2,506(194,6);2,501(267,1);2,497(203,5);2,493(103,2);2,333(1,3);2,328(1,8);2,324(1,3);1,988(5,2);1,336(0,9);1,299(0,3);1,259(0,5);1,250(1,2);1,235(0,5);1,193(1,4);1,175(2,7);1,157(1,3);0,008(1,5);0,000(50,0);-0,008(1,9)
88	1,43	1,48	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,412(0,3);9,348(8,9);9,342(9,0);9,293(16,0);9,291(15,5);8,683(6,2);8,679(6,7);8

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			,671(6,4);8,668(6,6);8,523(3,8);8,519(4,4);8,516(4,2);8,512(3,7);8,502(4,1);8,498(4,4);8,495(4,6);8,492(3,8);8,313(1,6);8,005(12,2);7,781(7,8);7,758(9,0);7,729(0,3);7,678(5,1);7,677(5,1);7,667(5,0);7,657(4,8);7,646(4,7);7,644(4,5);7,481(7,9);7,477(7,8);7,459(6,7);7,455(6,9);7,183(0,4);5,920(0,5);5,753(1,0);3,902(1,1);3,503(10,8);3,492(10,9);3,371(0,3);3,315(234,6);2,675(2,4);2,671(3,3);2,666(2,5);2,595(0,5);2,524(9,5);2,511(169,3);2,506(342,2);2,502(458,1);2,497(343,6);2,493(171,5);2,333(2,1);2,328(2,9);2,324(2,1);2,043(0,5);2,009(0,5);1,898(4,5);1,883(4,8);1,865(3,8);1,848(4,9);1,833(4,5);1,352(0,6);1,336(4,4);1,298(2,0);1,259(3,1);1,250(6,1);1,235(2,8);1,188(0,4);0,854(0,5);0,146(1,1);0,016(0,8);0,008(9,3);0,000(270,2);-0,009(9,9);-0,150(1,1)
89	1,63	1,65	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,342(8,9);9,336(8,9);9,271(15,2);9,270(16,0);8,682(5,9);8,678(6,6);8,670(6,2);8,667(6,5);8,517(3,5);8,513(4,1);8,511(4,0);8,507(3,6);8,496(3,8);8,493(4,1);8,490(4,4);8,486(3,6);8,314(0,5);7,834(0,5);7,804(15,5);7,803(15,6);7,779(8,1);7,676(5,1);7,665(4,9);7,656(4,8);7,644(4,7);7,307(6,9);7,303(6,7);7,285(6,1);7,281(6,5);4,303(0,5);3,671(0,9);3,375(2,5);3,356(2,5);3,345(2,4);3,335(2,4);3,317(58,3);2,676(0,7);2,671(0,9);2,667(0,7);2,524(2,8);2,507(106,2);2,502(142,9);2,498(108,9);2,494(56,1);2,466(0,5);2,463(0,5);2,334(0,7);2,329(1,0);2,325(0,7);1,336(1,0);1,299(0,5);1,259(0,7);1,250(1,4);1,233(0,7);1,214(0,5);1,197(0,9);1,134(11,3);0,146(0,8);0,008(6,0);0,000(158,8);-0,008(7,1);-0,150(0,8)
90	1,84	1,87	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,348(3,5);9,342(3,5);9,313(5,9);8,693(2,4);8,690(2,6);8,681(2,5);8,678(2,5);8,524(1,4);8,521(1,7);8,518(1,6);8,514(1,4);8,503(1,5);8,500(1,7);8,497(1,7);8,493(1,4);7,940(2,4);7,840(2,9);7,817(3,1);7,685(1,9);7,674(1,9);7,665(1,9);7,653(1,8);7,368(1,6);7,345(1,5);4,425(0,4);4,378(1,0);4,361(1,0);3,318(44,4);3,143(0,4);3,121(16,0);2,672(0,5);2,667(0,4);2,507(59,1);2,502(76,5);2,498(57,7);2,333(0,4);2,329(0,5);2,325(0,4);0,000(2,5)
91	3,22	3,12	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,202(4,5);9,474(6,5);9,389(3,7);9,383(3,8);8,704(2,5);8,701(2,8);8,693(2,7);8,689(2,8);8,576(4,5);8,560(1,6);8,556(1,8);8,554(1,8);8,550(1,6);8,539(1,6);8,536(1,8);8,533(1,9);8,529(1,6);8,313(0,3);7,913(1,5);7,909(1,5);7,890(3,4);7,886(3,6);7,857(4,3);7,844(3,4);7,834(2,3);7,824(3,3);7,699(2,0);7,687(2,0);7,678(2,0);7,667(1,9);7,313(2,8);7,284(2,8);3,918(1,4);3,892(4,3);3,866(4,5);3,840(1,6);3,317(33,8);2,676(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,511(26,0);2,507(51,7);2,502(70,1);2,498(55,4);2,465(0,6);2,429(16,0);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);0,008(0,5);0,000(11,8)
92	1,5	1,58	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,346(9,8);9,340(10,0);9,293(16,0);8,682(7,3);8,670(7,1);8,514(4,9);8,493(5,0);8,311(0,6);7,883(13,3);7,810(7,4);7,788(8,0);7,678(5,0);7,666(5,2);7,657(5,0);7,645(4,5);7,352(7,3);7,329(6,6);4,056(0,6);4,039(1,6);4,021(1,7);4,003(0,7);3,768(4,7);3,626(0,5);3,308(53,9);2,671(15,8);2,501(307,4);2,328(2,0);1,988(6,2);1,193(1,7);1,176(3,3);1,158(1,7);0,000(15,5)
93	0,87	1,03	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,353(9,2);9,346(9,3);9,323(16,0);8,690(5,9);8,687(6,8);8,678(6,2);8,675(6,7);8,

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)] または LC-MS [m/z]
			526(3,2);8,523(3,9);8,520(4,0);8,516(3,5);8,505(3,5);8,502(3,9);8,499(4,3);8,495(3,6);8,310(0,7);8,014(12,3);7,829(7,1);7,807(8,0);7,683(5,1);7,671(4,9);7,662(4,8);7,650(4,7);7,457(0,4);7,442(6,5);7,439(6,9);7,420(5,8);7,417(6,3);4,056(1,0);4,050(0,8);4,039(2,5);4,021(2,6);4,003(1,4);3,920(4,2);3,793(0,4);3,322(349,3);3,294(11,0);3,282(12,9);2,722(0,4);2,675(1,1);2,671(1,6);2,666(1,3);2,524(3,9);2,506(186,6);2,502(251,0);2,497(188,8);2,333(1,1);2,328(1,6);2,324(1,2);1,988(9,0);1,193(2,4);1,176(4,6);1,158(2,3);0,008(0,4);0,000(13,4)
94	2,23	2,23	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,618(4,2);9,478(6,2);9,394(3,7);9,387(3,8);8,706(2,5);8,703(2,8);8,695(2,7);8,691(2,9);8,600(4,5);8,563(1,4);8,560(1,7);8,557(1,6);8,553(1,5);8,543(1,6);8,539(1,7);8,536(1,8);8,532(1,5);8,373(3,9);8,368(4,2);8,314(0,3);8,000(1,9);7,995(1,9);7,980(2,1);7,974(2,1);7,940(1,7);7,936(1,8);7,917(3,3);7,913(3,5);7,869(4,0);7,847(2,1);7,703(2,0);7,691(1,9);7,682(1,9);7,670(1,9);7,367(3,0);7,346(2,8);4,181(1,0);4,171(0,5);4,153(1,1);4,143(1,3);4,126(0,5);4,116(1,3);4,089(0,4);3,949(0,3);3,922(1,2);3,913(0,4);3,895(1,4);3,885(1,1);3,868(0,5);3,858(1,0);3,832(0,3);3,318(50,7);2,791(0,6);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,635(0,5);2,524(2,4);2,511(44,9);2,507(91,6);2,502(122,3);2,497(92,4);2,493(47,8);2,351(16,0);2,333(0,9);2,329(1,0);2,324(0,8);1,336(0,7);1,299(0,5);1,259(0,8);1,250(1,0);1,234(0,5);0,146(0,6);0,008(5,1);0,000(138,3);-0,008(6,3);-0,150(0,6)
95	0,9	0,95	
96	2,19	2,14	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,415(4,3);9,488(6,7);9,391(3,8);9,385(3,8);8,707(2,8);8,704(2,7);8,695(2,8);8,692(2,7);8,598(4,7);8,562(1,5);8,558(1,8);8,556(1,7);8,552(1,4);8,541(1,6);8,538(1,8);8,535(1,8);8,531(1,4);8,314(0,4);8,167(3,2);8,148(3,2);7,923(1,5);7,920(1,4);7,900(3,6);7,897(3,5);7,870(4,4);7,847(1,8);7,703(2,1);7,691(2,0);7,682(2,0);7,670(1,9);7,413(2,7);7,385(2,7);5,754(0,5);4,238(0,9);4,229(0,5);4,211(1,1);4,201(1,3);4,183(0,5);4,174(1,3);4,147(0,4);4,055(0,4);4,029(1,2);4,020(0,4);4,002(1,4);3,992(1,0);3,974(0,5);3,965(1,0);3,317(62,0);2,671(1,7);2,557(0,4);2,524(3,1);2,506(119,8);2,502(153,5);2,497(112,4);2,399(16,0);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);1,909(3,4);1,235(0,9);0,146(1,0);0,008(8,2);0,000(206,2);-0,008(8,5);-0,025(0,4);-0,150(1,0)
97	2,2	2,22	¹ H-NMR(601,6 MHz, DMF): δ= 10,128(0,3);9,505(1,0);9,504(0,9);9,455(0,5);9,451(0,5);8,740(0,4);8,738(0,4);8,732(0,4);8,730(0,4);8,705(0,7);8,091(1,0);8,052(0,4);8,049(0,4);8,037(0,7);8,034(0,7);8,024(5,2);7,906(0,6);7,891(0,5);7,326(0,8);3,465(16,0);2,921(2,9);2,918(5,7);2,915(8,1);2,912(5,6);2,909(2,7);2,751(3,1);2,747(6,3);2,744(9,0);2,741(6,3);2,738(3,1);2,438(3,0);2,433(2,9);0,005(0,5);0,000(12,7);-0,006(0,4)
98	1,27	1,30	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12,941(2,9);9,350(9,6);9,344(9,6);9,136(16,0);8,655(6,5);8,652(7,1);8,643(6,8);8,640(7,0);8,510(3,7);8,507(4,5);8,505(4,5);8,501(3,8);8,490(

10

20

30

40

実施例番号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]またはLC-MS [m/z]
			4,0);8,486(4,6);8,484(4,8);8,480(3,8);8,314(0,7);8,257(4,7);8,007(4,6);7,951(12,7);7,755(5,7);7,732(9,9);7,676(8,2);7,673(8,3);7,662(5,6);7,650(9,7);7,641(5,2);7,629(4,7);3,321(105,7);2,891(0,4);2,732(0,4);2,672(1,3);2,507(159,7);2,503(205,5);2,498(160,5);2,329(1,3);0,000(5,4)
99	2,12	2,12	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,356(8,4);9,350(8,8);9,175(14,9);8,661(6,6);8,649(6,7);8,513(4,1);8,492(4,4);8,349(15,0);8,139(16,0);7,998(11,7);7,786(6,0);7,763(8,2);7,667(4,5);7,655(4,9);7,646(11,1);7,635(4,8);7,623(5,3);5,206(2,9);5,183(9,2);5,160(9,6);5,137(3,3);3,323(45,8);2,673(0,7);2,504(114,3);2,330(0,7);1,990(0,9);1,176(0,5);0,146(0,6);0,000(109,6);-0,150(0,6)
101	2,04	2,21	¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,382(9,7);9,375(9,6);9,348(16,0);8,730(5,1);8,716(5,4);8,707(5,3);8,693(5,9);8,688(7,0);8,685(7,1);8,676(6,8);8,673(6,8);8,608(11,3);8,551(3,6);8,548(4,2);8,545(4,1);8,541(3,6);8,531(3,9);8,527(4,2);8,524(4,4);8,521(3,6);8,315(0,4);8,186(6,1);8,182(5,9);8,163(7,0);8,159(6,9);8,045(5,1);8,040(5,2);8,017(5,3);8,011(5,0);7,859(8,5);7,836(7,4);7,686(5,0);7,674(4,9);7,665(4,8);7,653(4,7);7,310(3,2);7,304(3,0);7,296(3,3);7,289(4,8);7,283(3,0);7,275(3,2);7,269(2,8);3,324(78,0);3,322(83,3);2,677(0,6);2,673(0,8);2,668(0,6);2,508(103,2);2,504(133,3);2,499(96,6);2,335(0,6);2,331(0,8);2,326(0,6);0,008(2,0);0,000(50,1);-0,008(2,0)
104	2,4	2,44	

【0549】

生物学的实施例

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験

溶媒: アセトン 78 重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が得られるまで、1000 ppm の濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0550】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉ディスクに、所望濃度の活性化合物製剤を噴霧する。

【0551】

6 日間経過した後、効力 (%) を求める。100% は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0% は、死んだモモアカアブラムシがなかったことを意味する。

【0552】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物: 1、3、5、7、16、24、30、32、33、50、52、61、67、68、69、74、79、80、86、87、88、89、92、96、97、108、109、112、115、121、122、128 が、500 g/h a の施用量で、100% の効力を示した。

10

20

30

40

50

【0553】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：4、6、8、9、10、11、13、14、15、18、19、20、22、25、27、31、37、49、51、53、54、55、56、57、58、60、62、63、64、65、66、71、73、75、76、77、81、82、85、90、94、95、99、101、104、105、110、111、113、114、116、118、123、124、126、129、130が、500 g/h aの施用量で、90%の効力を示した。

【0554】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：23が、100 g/h aの施用量で、100%の効力を示した。

10

【0555】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：26、29、59、91が、100 g/h aの施用量で、90%の効力を示した。

【0556】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒： ジメチルホルムアミド7重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、活性化化合物1重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が得られるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。アンモニウム塩または／および浸透剤を加える必要がある場合、それらはそれぞれ、製剤溶液に対して1000 ppmの濃度で加える。

20

【0557】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) が重度に発生しているピーマン植物 (Bell pepper) を、所望濃度での活性化化合物製剤の噴霧によって処理する。

【0558】

6日後、死亡率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが全くなかったことを意味する。

【0559】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：51が、4 ppmの施用量で、100%の効力を示した。

30

【0560】

カラシナハムシ (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験

溶媒： アセトン78.0重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、活性化化合物1重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が得られるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。

40

【0561】

ハクサイ葉 (Brassica pekinensis) のディスクに所望濃度の活性化化合物調製物を噴霧し、乾燥後、ハムシ (mustard beetle) (カラシナハムシ (Phaedon cochleariae)) 幼虫を付ける。

【0562】

7日後、効力(%)を求める。100%は全てのハムシ幼虫が死んだことを意味し、0%は死んだハムシ幼虫がいなかったことを意味する。

【0563】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：16、38が、500 g/h a

50

の施用量で100%の効力を示した。

【0564】

ヨトウガ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験

溶媒： アセトン78.0重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物1重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が得られるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。

10

【0565】

トウモロコシ (Zea mays) の葉ディスクに、所望濃度の活性化合物製剤を噴霧し、乾燥後、アワヨトウ (Spodoptera frugiperda) のイモムシを付ける。

【0566】

7日後、効力(%)を求める。100%は全てのイモムシが死んだことを意味し、0%は死んだイモムシがいなかったことを意味する。

【0567】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：38が、500g/haの施用量で100%の効力を示した。

20

【0568】

ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験；OP-抵抗性

溶媒： アセトン78.0重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物1重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。

30

【0569】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉ディスクに、所望濃度の活性化合物製剤を噴霧する。

【0570】

6日後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニがなかったことを意味する。

【0571】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：117が、500g/haの施用量で90%の効力を示した。

40

【0572】

ワタアブラムシ (Aphis gossypii) - 噴霧試験

溶媒： ジメチルホルムアミド7重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物1重量部を指定の重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、その製剤を乳化剤含有水で希釈する。アンモニウム塩または／および浸透剤を加える必要がある場合、それらはそれぞれ、製剤溶液に対して1000ppmの濃度で加える。

【0573】

50

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) が重度に発生している棉植物 (*Gossypium hirsutum*) に、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧する。

【0574】

6日後、死亡率(%)を求める。100%は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだアブラムシがなかったことを意味する。

【0575】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：12が、4ppmの施用量で80%の効力を示した。

【0576】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注射試験

10

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な調製物を製造するため、活性化合物10mgを溶媒0.5mLと混和し、得られた濃厚液を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0577】

得られた活性化合物溶液1μLを、血を吸った雌ウシダニ成虫5匹 (*Boophilus microplus*) の腹部に注射する。動物をシャーレに移し、温度/湿度調節した部屋で保管する。

【0578】

7日後、受精卵の産卵によって効力を評価する。受精しているように外からは見えない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで温度/湿度調節した部屋で保管する。効力100%は受精卵を産卵するダニが全くないことを意味し、0%は全ての卵が受精卵であることを意味する。

20

【0579】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：52が、20μg/動物の施用量で100%の効力を示した。

【0580】

コーペリア・クルチセイ (*Cooperia curticei*) - 試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な調製物を製造するため、活性化合物10mgをジメチルスルホキシド0.5mLと混和し、得られた濃厚液を「リングル液」で希釈して所望の濃度とする。

30

【0581】

線虫幼虫 (*Cooperia curticei*) 約40匹を、所望の濃度の活性化合物調製物の入った容器に移し入れる。

【0582】

5日後、死亡率(%)を求める。100%は全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は死んだ幼虫が全くいなかったことを意味する。

【0583】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：56、65が、20ppmの施用量で90%の効力を示す。

【0584】

40

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：57、67、76が、20ppmの施用量で80%の効力を示した。

【0585】

ハエモンクス・コントルツス (*Haemonchus contortus*) - 試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な調製物を製造するため、活性化合物10mgをジメチルスルホキシド0.5mLと混和し、得られた濃厚液を「リングル液」で希釈して所望の濃度とする。

【0586】

紅色毛様線虫 (*Haemonchus contortus*) 幼虫約40匹を、所望の濃度の活性化合物調製物の入った容器に移し入れる。

50

【0587】

5日後、死亡率(%)を求める。100%は全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は死んだ幼虫が全くいなかったことを意味する。

【0588】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：65、67が、20ppmの施用量で80%の効力を示した。

【0589】

メロイドジン・インコグニタ (Meloidogyne incognita) - 試験
溶媒：アセトン125.0重量部

適切な活性化合物調製物を製造するため、活性化合物1重量部を指定量の溶媒と混和し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

10

【0590】

容器に、砂、活性化合物の溶液、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) の卵/幼虫懸濁液およびレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根においてこぶが発達する。

【0591】

14日後、こぶ形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%はこぶが全く観察されなかったことを意味し、0%は被処理植物でのこぶの数が未処理対照に相当することを意味する。

【0592】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：99、104が、20ppmの施用量で90%の効力を示した。

20

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		
A 0 1 P	7/02	(2006.01)	A 0 1 N	43/84 1 0 2
A 0 1 P	7/04	(2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 6 1 K	31/416	(2006.01)	A 0 1 P	7/04
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)	A 6 1 K	31/416
A 6 1 K	31/497	(2006.01)	A 6 1 K	31/4439
A 6 1 K	31/506	(2006.01)	A 6 1 K	31/497
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)	A 6 1 K	31/506
A 6 1 K	31/541	(2006.01)	A 6 1 K	31/5377
A 6 1 P	33/14	(2006.01)	A 6 1 K	31/541
			A 6 1 P	33/14

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也

(74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文

(72)発明者 ヤスケ, ペーター
ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギッシュ・グラートバッハ、カルミュンテナー・シュトラッセ・4 4
アー

(72)発明者 アールト, アレクサンダー
ドイツ国、5 0 8 5 9・ケルン、アム・ハイトシュタム・4 7

(72)発明者 セレソーガルベス, シルビア
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ペスタロッツィシュトラッセ・3 9アー

(72)発明者 フェールステ, アルント
ドイツ国、5 0 6 7 4・ケルン、モーツアルトシュトラッセ・3-5

(72)発明者 フェースライン, マルティン
ドイツ国、4 0 2 2 5・デュッセルドルフ、ビッツェルシュトラッセ・9

(72)発明者 フィッシャー, ライナー

- ドイツ国、40789・モンハイム、ネリーザクスーシュトラッセ・23
(72)発明者 ブレットシュナイダー、トーマス
ドイツ国、53797・ローマル、タールシュトラッセ・29ベー
(72)発明者 イルク、ケルシュティン
ドイツ国、50670・ケルン、ノイッサー・バール・32
(72)発明者 マルサム、オルガ
ドイツ国、51503・レスラート、フォア・デム・クロスターホーフ・19
(72)発明者 レーセル、ペーター
ドイツ国、51371・レーパークーゼン、アム・ショッカー・5

審査官 山本 昌広

- (56)参考文献 特表2016-530310 (JP, A)
特表2013-534530 (JP, A)
国際公開第2012/081916 (WO, A2)
国際公開第2013/191113 (WO, A1)
国際公開第2014/126580 (WO, A1)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D 401/00-403/14
A01N 1/00-65/48
A01P 1/00-23/00
A61K 31/00-31/80
A61P 1/00-43/00
CAplus/REGISTRY (STN)