

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4865695号
(P4865695)

(45) 発行日 平成24年2月1日(2012.2.1)

(24) 登録日 平成23年11月18日(2011.11.18)

(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 409/14 (2006.01)

C O 7 D 409/14

C O 7 D 405/14 (2006.01)

C O 7 D 405/14

C O 7 D 493/08 (2006.01)

C O 7 D 493/08

A

請求項の数 5 (全 189 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2007-501212 (P2007-501212)
 (86) (22) 出願日 平成17年3月2日(2005.3.2)
 (65) 公表番号 特表2007-526271 (P2007-526271A)
 (43) 公表日 平成19年9月13日(2007.9.13)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2005/002204
 (87) 国際公開番号 W02005/085234
 (87) 国際公開日 平成17年9月15日(2005.9.15)
 審査請求日 平成20年1月17日(2008.1.17)
 (31) 優先権主張番号 0404801.3
 (32) 優先日 平成16年3月3日(2004.3.3)
 (33) 優先権主張国 英国 (GB)
 (31) 優先権主張番号 0411078.9
 (32) 優先日 平成16年5月18日(2004.5.18)
 (33) 優先権主張国 英国 (GB)

(73) 特許権者 500584309
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アクチエンゲゼルシャフト
 スイス国, ツェーハー 4058 バーゼ
 ル, シュバルツバルトアレー 215
 (73) 特許権者 500371307
 シンジェンタ リミテッド
 イギリス国 サリー ジーユー2 7ワイ
 エイチ, ギルドフォード, サリー リサー
 チ パーク, プリーストリー ロード, ユ
 アロピーアン リージョナル センター
 (74) 代理人 100099759
 弁理士 青木 篤
 (74) 代理人 100077517
 弁理士 石田 敬

最終頁に続く

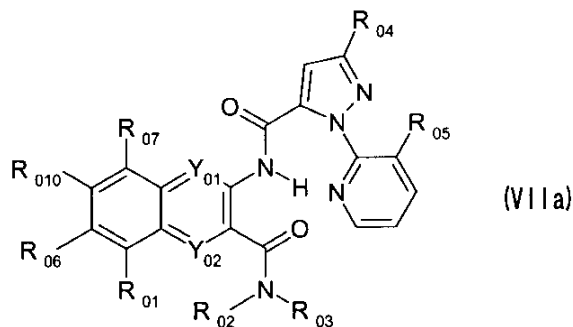
(54) 【発明の名称】 新規殺虫剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 (VIIa)

【化1】



10

(式中、

 R_{01} は、水素、アミノ又はニトロであり； R_{02} は、水素又は $C_1 - C_4$ アルキルであり； R_{03} は：

20

C₁ - C₄ アルキル、若しくは、シアノ、COOH、ニトロ、C₁ - C₄ アルコキシ
若しくはシクロプロピルにより 1 置換若しくは 2 置換された C₁ - C₄ アルキル；

C₂ - C₈ アルケニル、若しくは、ハロゲンにより置換された C₂ - C₈ アルケニル
；

C₁ - C₄ アルコキシ、C₃ - C₆ - アルキニル、シクロプロピル、シクロブチル、
シクロペンチル、シクロヘキシル、若しくは、C₁ - C₄ アルキル、ピリジル、フェニル
- C₂ - C₆ アルケニル、若しくはシクロプロピルにより置換されたシクロプロピル；

C₁ - C₄ アルキルにより置換されたシクロブチル；
シクロペンチルチオ - C₁ - C₄ アルキル、ベンジルオキシ、若しくは、ハロゲンに
より置換されたベンジルオキシ；

ベンジルチオ - C₁ - C₄ アルキル（ここで、ベンジル基は、ハロフェニルにより置
換された C₁ - C₄ アルキルチオフェニルにより置換されていてもよい）；

フェニルオキシ - C₁ - C₄ アルキル（ここで、フェニル基は、ハロゲンにより 1 置
換若しくは 2 置換されていてもよい）；

フェニル - C₁ - C₄ アルキル（ここで、フェニル基は、ハロゲン、ニトロ、ベンゾ
チアゾール - 2 - イルオキシ、C₁ - C₄ ハロアルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、及び C
1 - C₄ アルキルより選択される置換基で 1 置換若しくは 2 置換されていてもよい）；

3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] ジオキセピニル (dioxepinyl)、
若しくは、C₁ - C₄ アルコキシにより置換された 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフ
タレニル；

C₂ - C₆ アルケニルオキシ、若しくは、C₁ - C₄ アルキルにより置換されたイソ
オキサゾリル；

チアゾリル、C₁ - C₄ アルコキシカルボニル - C₁ - C₄ アルキル、ヒドロキシ、
ハロフェニルオキシ、C₁ - C₄ アルキル - シリル (C₁ - C₄ - アルキル)₃、若しく
は C₂ - C₆ アルキニルにより置換されたフェニル；

C₁ - C₄ アルコキシにより置換されたピリジル；又は
C₁ - C₆ アルキルチオ - C₁ - C₄ アルキル、C₂ - C₆ アルケニルチオ - C₁ -
C₄ アルキル、C₃ - C₆ アルキニルチオ - C₁ - C₄ アルキル、ジオキサラン - 2 - イ
ル - C₁ - C₄ アルキル、(C₁ - C₄ アルキル - ジオキサラン - 2 - イル) - C₁ - C
4 アルキル、トリアゾリル - C₁ - C₄ アルキル、チエニル - C₁ - C₄ アルキル、モル
ホリニル - C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルキルチオ - C₁ - C₄ アルキル、2, 3
- ジヒドロ - 1 H - イソインドリル、ハロゲンにより置換されたチアゾリル - C₁ - C₄
アルキル、C₁ - C₄ アルキルスルホニル - C₁ - C₄ アルキル、若しくはキノリルチオ
- C₁ - C₄ アルキル（ここで、キノリン基は、C₁ - C₄ ハロアルキルにより置換され
ていてもよい）であり；

R₀₄ は、C₁ - C₄ ハロアルキルであり；

R₀₅ は、ハロゲンであり；

R₀₅ 及び R₀₁₀ は各々、同一でも異なってもよく、水素、C₁ - C₆ アルキル、C
1 - C₆ アルコキシカルボニルオキシ、C₁ - C₆ アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキ
シ、シアノ、ハロゲン又は C₁ - C₆ アルコキシを表し；

R₀₇ は、水素、ニトロ又はハロゲンであり；

Y₀₁ は、C (R₀₈) であり、但し R₀₈ は、水素、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキル
、又はニトロであり；

Y₀₂ は、C (R₀₉) であり、但し R₀₉ は、水素、フェニル、ハロゲンにより置換
されたフェニル、又はハロゲンである)

の化合物。

【請求項 2】

昆虫及びダニから選択される害虫を防除するための殺害虫組成物であって、請求項 1 に
記載の式 I の少なくとも 1 つの化合物又は農薬的に利用され得るその塩を活性成分として
、少なくとも 1 つの補助剤と共に含んでなる殺虫組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 3】

昆虫及びダニから選択される害虫を防除するための方法であって、害虫又は害虫の生息環境に対して請求項 2 に記載の組成物を適用することを含む方法。

【請求項 4】

植物繁殖材料を害虫による攻撃から保護するための方法であって、植物繁殖材料又はその植え付け部位を、請求項 2 に記載の組成物で処理することを含んでなる、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

請求項 4 に記載の方法に従い処理された植物繁殖材料。

【発明の詳細な説明】

10

【技術分野】

【0001】

本発明は二環式ビスアミド誘導体、それらの調製のための方法、それらの化合物を含む組成物、及び昆虫または典型的にはダニ目を制御するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

殺虫作用を有するビスアミド誘導体は公知であり、そして例えば米国2003/0229050に発表されている。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

20

【0003】

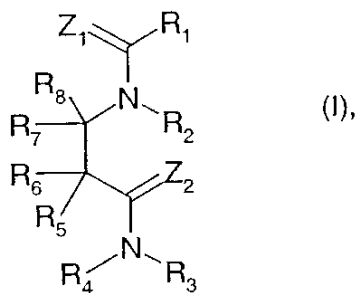
殺虫特質を有する新規の二環式ビスアミド誘導体をここに見出した。

【課題を解決するための手段】

【0004】

それに応じて、本発明は式 I の化合物に関し、

【化 1】



30

式中、Z₁は酸素原子；または硫黄原子であり；

Z₂は酸素原子；または硫黄原子であり；

40

R₁はアリールまたはヘテロアリール基であって、非置換であるか、または置換されており；

R₂は水素；または有機置換基であって；

R₃は水素；または有機置換基であって；

R₄は水素；または有機置換基であって；

或いはR₃及びR₄は一緒になって、それらに結合した窒素原子と一緒に環を形成し、それは非置換であるか、または置換されている；

【0005】

R₅は水素；或いは非置換であるか、または置換されたアルキル基であって；或いは、R₈と一緒に、またはR₆の原子であって、その原子を介してR₆がR₅を担持する式 I に示

50

す炭素原子に直接連結している原子に結合した一価の置換基と一緒にあって、一つの追加の結合を形成し；

【 0 0 0 6 】

R_6 及び R_7 は、一緒にあって、それらに結合した式 I に見られる 2 つの炭素原子と一緒に、二環式環系を形成し、該環系は炭素環式またはヘテロ環式であり、該環系は 4 つの置換基 $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ 、 $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$ 、 R_5 及び R_8 により式 I に見られる方法において置換され、そして該環系は任意に更に置換され；

【 0 0 0 7 】

そして R_8 は水素；或いは非置換であるか、または置換されたアルキル基であって；或いは、 R_5 または、 R_7 の原子であって、その原子を介して R_7 が R_8 を担持する式 I に示す炭素原子に直接連結している原子に結合した一価の置換基と一緒にあって、一つの追加の結合を形成し、ここでは遊離形態または塩形態にあり、適宜これらの化合物の遊離形態または塩形態にある互変異性体、これらの化合物及び互変異性体の調製方法及び使用、農業的に利用可能な形態にある遊離形態のいずれかの場合においてこれらの化合物及び互変異性体の中から選定される活性成分を有する殺虫組成物、これらの組成物の調製方法及び使用、これらの組成物により処理された植物の繁殖材料、これらの活性成分及び組成物による害虫の制御方法、これらの化合物の調製のための遊離形態または塩形態にある中間体、適宜中間体の遊離形態または塩形態にある互変異性体、並びにこれらの中間体の調製方法及び使用にある。

【 0 0 0 8 】

いくつかの場合において、式 I の化合物は、互変異性体として存在することができる。例えば、式 I の化合物中の置換基 $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ が $-N(R_2)-C(=O)-R_1$ であり、そして R_2 が水素である場合、式 I の対応化合物、即ち、 $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ が $-N(H)-C(=O)-R_1$ である化合物は、それぞれの互変異性体と均衡 (equilibrium) であることができ、ここでのそれぞれの置換基は、互変異性構造 $-N=C(OH)-R_1$ を有す。従って、上述及び後述の式 I の化合物は、例え後者が個々の場合において詳細に述べていなくても、適宜かかる互変異性体を含むものと理解される。

【 0 0 0 9 】

少なくとも 1 つの塩基中心を有する式 I の化合物は、例えば、酸付加塩、例えば鉱酸等の無機強酸（例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、ニトロース (nitro) 酸、リン酸 (phosphorus acid) またはハロゲン化水素酸）により、非置換であるか、または例えばハロゲンによって置換される C1-C4 アルカンカルボン酸等の有機強酸（例えば酢酸、飽和または不飽和ジカルボン酸等、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸またはフタル酸、ヒドロキシカルボン酸等、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸またはクエン酸、或いは安息香酸等）、或いは非置換であるか、または例えばハロゲンによって置換された C1-C4 アルカン-またはアリールスルホン酸等の有機スルホン酸（例えばメタン-または p-トルエンスルホン酸）により形成され得る。少なくとも 1 つの酸性基を有する式 I の化合物は、例えば、塩基との塩（例えば鉱塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属塩等、例えばナトリウム塩、カリウム塩またはマグネシウム塩）、或いはアンモニアまたは有機アミン（モルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-またはトリ-低級アルキルアミン等）との塩（例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-またはジメチルプロピルアミン、或いはモノ-、ジ-またはトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-またはトリエタノールアミン）を形成することができる。適宜、対応する内包塩を更に形成することができる。本発明の範囲内にある好適な態様は、農業的に都合のよい塩であるが；当該発明は農業使用に不都合を有す塩、例えば蜂または魚に毒性である塩、及び例え式 I または農業的に利用可能なそれらの塩の遊離化合物を単離もしくは精製するために使用される塩も包含する。遊離形態及びそれらの塩形態にある式 I の化合物の緊密な関係のせいで、本発明の目的である上記及び後述の式 I の遊離化合物またはそれらの塩は、適宜、式 I の対応の塩または遊離化合物を含むものとしてそれぞれ理解される。同一物は、同じように式 I の化合物の互変異性体及びそれらの塩に適用される。一般的に遊

10

20

30

40

50

離形態は個々の場合において好適である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0010】

好適には、本発明は式 I (1) に係る化合物 (2) に関し、

式中、 Z_1 は酸素原子；または硫黄原子であり；

Z_2 は酸素原子；または硫黄原子であり；

R_1 はフェニルまたはナフチル基であって、独立して1または2個の置換基Raによって置換され、そして任意に独立して1~3個の置換基Rbによって更に置換され；

【0011】

Raはシアノ；ニトロ；ハロゲン； C_1 - C_6 アルキル；ハロ- C_1 - C_6 アルキル； C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル； C_2 - C_6 アルケニル；ハロ- C_2 - C_6 アルケニル； C_2 - C_6 アルキニル；ハロ- C_2 - C_6 アルキニル； C_3 - C_6 シクロアルキル；ハロ- C_3 - C_6 シクロアルキル；ヒドロキシ； C_1 - C_6 アルコキシ；ハロ- C_1 - C_6 アルコキシ； C_3 - C_6 シクロアルコキシ；メルカプト； C_1 - C_6 アルキルチオ；ハロ- C_1 - C_6 アルキルチオ； C_1 - C_6 アルキルスルフィニル；ハロ- 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；ハロ- C_1 - C_6 アルキルスルホニル；アミノ； C_1 - C_6 アルキルアミノ；ハロ- C_1 - C_6 アルキルアミノ；ジ- C_1 - C_6 アルキルアミノ（ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、または一緒になって、そこに結合した窒素原子と一緒に、1個の窒素環原子及び2~12個の炭素環原子、並びに任意に1個の更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含む環を形成し、この環は非置換であるか、またはシアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシから成る群から選定された1~4個の置換基により独立して置換される）；ジ-（ハロ- C_1 - C_6 アルキル）-アミノ（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）； C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ；N-（ C_1 - C_6 アルキル）-N-（ C_3 - C_6 シクロアルキル）-アミノ；カルボキシ； C_1 - C_6 アルコキシカルボニル；ハロ- C_1 - C_6 アルコキシカルボニル；アミノカルボニル； C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル；ハロ- 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（ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、或いは一緒になって、それらに結合している窒素原子と一緒に、1個の窒素環原子及び2~12個の炭素環原子及び任意に1個の更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄、及び窒素原子から成る群から選定される）を含む環を形成し、この環は非置換であるか、またはシアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシから成る群から選定された1~4個の置換基によって独立して置換される）；ジ-（ハロ- C_1 - C_6 アルキル）-アミノカルボニル（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）； C_1 - C_6 アルキルカルボニル；ハロ- C_1 - C_6 アルキルカルボニル；またはトリ- C_1 - C_6 アルキルシリル（ここでの3個のアルキル基は同一もしくは相違する）であり；

【0012】

或いは、隣接した炭素原子に結合した2個の置換基Raは、一緒になって、 $-(CH_2-)_3$ ； $-(CH_2-)_4$ ； $-(CH_2-)_5$ ； $-(CH=CH-)_2$ ； $-OCH_2O-$ ； $-O-(CH_2-)_2O-$ ； $-OCF_2O-$ ； $-(CF_2-)_2O-$ ； $-O-(CF_2-)_2$ ；または $-O-(CF_2-)_2O-$ であり；

【0013】

Rbはハロゲン； 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 アルコキシ； C_1 - C_6 アルコキシカルボニル；またはフェニル、ベンジル、フェノキシまたは単環式もしくは二環式ヘテロアリール基であって、この基は非置換であるか、置換基Raから成る群から選定された1~4個の置換基によって独立して置換され；

【0014】

或いは R_1 は、単環式もしくは二環式ヘテロアリール基であって、非置換であるか、または1~4個の置換基Rcによって独立して置換され；

【0015】

Rcは置換基Ra；或いはフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシまたは単環式もしくは二環式ヘテロアリール基であって、この基は非置換であるか、または置換基Raから

10

20

30

40

50

成る群から選定された1~4個の置換基によって独立して置換され；

【0016】

R₂は水素；C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニルまたはC₃-C₆シクロアルキル基（この基は非置換であるか、または置換基Raから成る群から選定された1個以上の置換基によって独立して置換され）；基C(=O)Rd；または基C(=S)Rdであって；

【0017】

Rdは、置換基R₁；C₁-C₆アルキル；ハロ-C₁-C₆アルキル；C₁-C₆アルコキシ-C₁-C₆アルキル；CH₂R₁基；CH₂OR₁基；CH₂SR₁基；CH₂NHR₁基（当該基は、窒素原子において、C₁-C₆アルキルまたはハロ-C₁-C₆アルキル；C₂-C₆アルケニル；ハロ-C₂-C₆アルケニル；C₂-C₆アルキニル；ハロ-C₂-C₆アルキニル；C₃-C₆シクロアルキル；ハロ-C₃-C₆シクロアルキル；C₁-C₆アルコキシ；ハロ-C₁-C₆アルコキシ；C₃-C₆シクロアルコキシによって任意に更に置換され）；OR₁基；C₁-C₆アルキルチオ；ハロ-C₁-C₆アルキルチオ；SR基；C₁-C₆アルキルアミノ；ハロ-C₁-C₆アルキルアミノ；ジ-C₁-C₆アルキルアミノ（ここでの2つの基は同一もしくは相違し、または一緒になって、それらに結合する窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は1個の窒素環原子及び2~12個の炭素環原子及び任意に更に1個のヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、当該環は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁-C₄アルキル及びC₁-C₄アルコキシから成る群から選定される1~4個の置換基によって独立して置換される）；ジ-(ハロ-C₁-C₆アルキル)-アミノ（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）；C₃-C₆シクロアルキルアミノ；N-(C₁-C₆アルキル)-N-(C₃-C₆シクロアルキル)-アミノ；またはNHR₁基（当該基は任意にC₁-C₆アルキルまたはハロ-C₁-C₆アルキルにより更に置換される）であり；

【0018】

R₃は、水素；C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニルまたはC₃-C₆シクロアルキル基であって（当該基は非置換であるか、置換基Raから成る群から選定された1つ以上の置換によって独立して置換される）；C₁-C₆アルコキシ；ハロ-C₁-C₆アルコキシ；C₃-C₆シクロアルコキシ；C₁-C₆アルキルチオ；ハロ-C₁-C₆アルキルチオ；C₁-C₆アルキルアミノ；ハロ-C₁-C₆アルキルアミノ；ジ-C₁-C₆アルキルアミノ（ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、或いは一緒になって、それらが結合する窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は1個の窒素環原子及び2~12個の炭素環原子そして任意に更に1個のヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、当該環は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁-C₄アルキル及びC₁-C₄アルコキシから成る群から選定された1~4個の置換基によって独立して置換される）；ジ-(ハロ-C₁-C₆アルキル)-アミノ（ここで2個のハロアルキル基は同一もしくは相違する）；C₃-C₆シクロアルキルアミノ；N-(C₁-C₆アルキル)-N-(C₃-C₆シクロアルキル)-アミノ；C₁-C₆アルコキシカルボニル；ハロ-C₁-C₆アルコキシカルボニル；C₁-C₆アルキルカルボニルまたはハロ-C₁-C₈アルキルカルボニル；

【0019】

R₄は、水素；置換基R₁；置換基Re；C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニルまたはC₃-C₆シクロアルキル基であって（当該基は非置換であるか、置換基Ra、置換基Reおよびフェニル、ベンゾイル、フェノキシまたは単環式もしくは二環式ヘテロアリール基（当該基は非置換であるか、置換基Rcから成る群から選定される1~4個の置換基によって独立して置換される）から成る群から選定される1つ以上の置換によって独立して置換される）；CH₂OR₁基；CH₂SR₁基；CH₂NHR₁基（当該基は任意に窒素原子がC₁-C₆アルキルまたはハロ-C₁-C₆アルキルによって更に置換される）；C₁-C₆アルコキシ；ハロ-C₁-C₆アルコキシ；C₃-C₆シクロアルコキシ；OR₁基；C₁-C₆アルキルチオ；ハロ-C₁-C₆アルキルチオ；SR₁基；C₁-C₆アルキルスルフィニル；ハロ-C₁-C₆アルキルスルフィニル；C₁-C₆アルキルスルホニル；ハロ-C₁-C₆アルキルスルホニル；C₁-C₆アルキルアミノ；ハロ-C₁-C₆アルキルアミノ；ジ-C₁-C₆アルキルアミノ（ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、或いは一緒になって、それらが結合する窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は1個

10

20

30

40

50

の窒素環原子及び2～12個の炭素環原子及び任意に1つの更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、当該環は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシから成る群から選定される1～4個の置換によって独立して置換され；ジ-（ハロ- C_1 - C_6 アルキル）-アミノ（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）； C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ；N-（ C_1 - C_6 アルキル）-N-（ C_3 - C_6 シクロアルキル）-アミノ）； NHR_1 基（当該基は任意に窒素原子が C_1 - C_6 アルキルまたはハロ- C_1 - C_6 アルキルによって更に置換される）； $C(=O)Rd$ 基； $C(=O)Re$ 基； $C(=S)Rd$ 基；または $C(=S)Re$ 基であって；

【0020】

Reはカルボシクリルまたはヘテロシクリル基であり、当該基は単環式または二環式であり、且つ非芳香族であり、ここでの1または2個の環員基は、任意に $C(=O)$ 基、 $S(=O)$ 基及び $S(=O)_2$ 基から成る群から選定され、そして当該基は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシから成る群から選定される1～4個の置換によって独立して置換され；或いは R_3 及び R_4 は一緒になって、それらが結合する窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は1個の窒素環原子及び2～6個の炭素環原子を含み、そして任意に1個の更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、且つ当該環は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシから成る群から選定される1～4個の置換基によって独立して置換され；

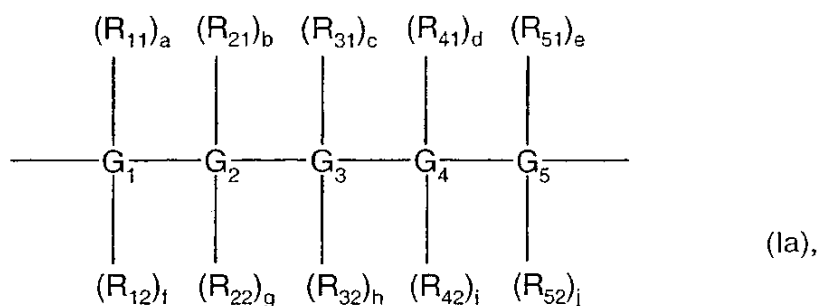
【0021】

R_5 は、水素； C_1 - C_6 アルキル；またはハロ- C_1 - C_6 アルキルであり；或いは本明細書において後に定義した意味の一つを有し；

【0022】

R_6 及び R_7 は、一緒になって式

【化2】



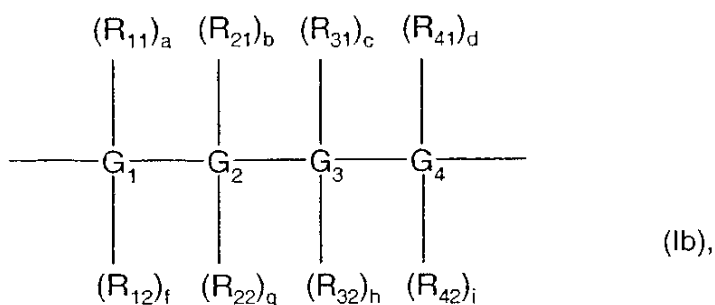
のいずれかの基であって、

ここでの G_1 は式 I に示す炭素原子に結合し、 R_5 を担持し；そしてここでの G_5 は式 I に示される炭素原子に結合し、 R_6 を担持し；

【0023】

或いは式

【化 3】



10

の基であって、

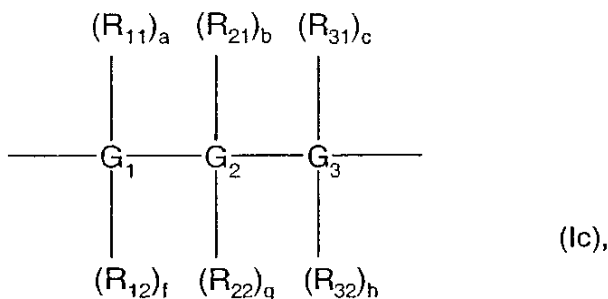
ここでの G_1 は式 I に示す炭素原子に結合し、 R_5 を担持し；そしてここでの G_4 は式 I に示される炭素原子に結合し、 R_8 を担保し；

【 0 0 2 4 】

或いは式

【化 4】

20



30

の基であって、

ここでの G_1 は式 I に示す炭素原子に結合し、 R_5 を担持し；そしてここでの G_3 は式 I に示す炭素原子に結合し、 R_8 を担持し；

【 0 0 2 5 】

ここでの式 1a、1b 及び 1c では、 a は 0 であり； f は 0 であり；及び G_1 は $C(=O)$ 基； $C(=S)$ 基；酸素原子；硫黄原子； $S(=O)$ 基；もしくは $S(=O)_2$ 基であって；または a は 0 であり； f は 1 であり；および G_1 は窒素原子であり；または a は 1 であり； f は 1 であり；及び G_1 は炭素原子である、のいずれかであり； b は 0 であり； g は 0 であり；及び G_2 は $C(=O)$ 基； $C(=S)$ 基；酸素原子；硫黄原子； $S(=O)$ 基；もしくは $S(=O)_2$ 基であって；または b は 0 であり； g は 1 であり；そして G_2 は窒素原子であり；または b は 1 であり； g は 1 であり；そして G_2 は炭素原子である、のいずれかであり；並びに c は 0 であり； h は 0 であり；そして G_3 は $C(=O)$ 基； $C(=S)$ 基；酸素原子；硫黄原子； $S(=O)$ 基；もしくは $S(=O)_2$ 基であって；または c は 0 であり； h は 1 であり；そして G_3 は窒素原子であり；または c は 1 であり； h は 1 であり；そして G_3 炭素原子である、のいずれかであり；

40

【 0 0 2 6 】

ここでの式 1a 及び 1b では、 d は 0 であり； i は 0 であり；そして G_4 は $C(=O)$ 基； $C(=S)$ 基；酸素原子；硫黄原子； $S(=O)$ 基；もしくは $S(=O)_2$ 基であって；または d は 0 であり； i は 1 であり；そして G_4 は窒素原子であり；または d は 1 であり； i は 1 であり；そして G_4 は炭素原子である、のいずれかであり；

50

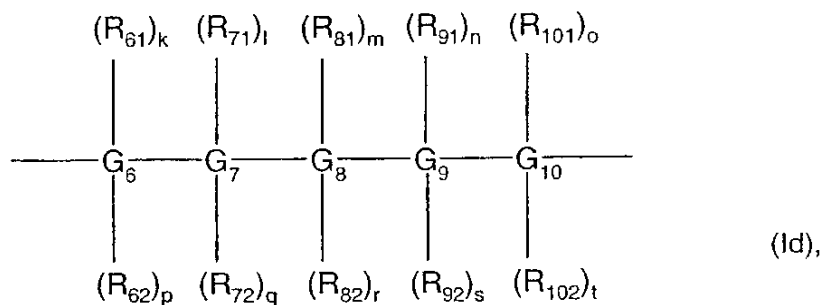
【 0 0 2 7 】

ここでの式1aでは、eは0であり；jは0であり；そしてG₅はC(=O)基；C(=S)基；酸素原子；硫黄原子；S(=O)基；もしくはS(=O)₂基であって；またはeは0であり；jは1であり；そしてG₅は窒素原子であり；またはeは1であり；jは1であり；そしてG₅は炭素原子である、のいずれかであり；

【 0 0 2 8 】

ここでの式1aでは、fは1であり；gは1であり；そしてR₁₂とR₂₂は一緒になって、式

【 化 5 】



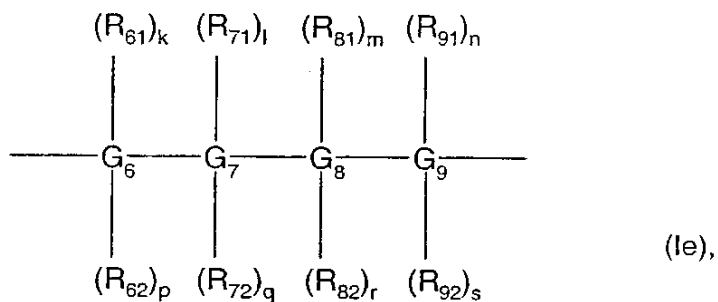
10

20

のいずれかの基である、のいずれかであり

ここでのG₆はG₁に結合し；そしてここでのG₁₀はG₂に結合し；或いは式

【 化 6 】



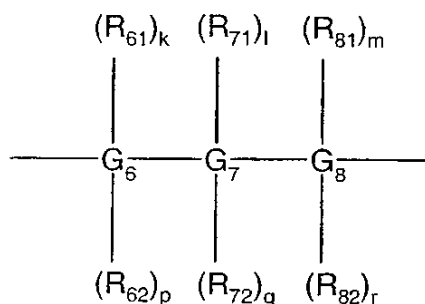
30

の基であって、

【 0 0 2 9 】

ここでのG₆はG₁に結合し；そしてここでのG₉はG₂に結合し；或いは式

【化 7】



(If),

10

の基であって、

【 0 0 3 0】

ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_8 は G_2 に結合する、のいずれかであり；或いは g は1であり； h は1であり；そして R_{22} と R_{32} は、一緒になって、式Idのいずれかの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_3 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_9 は G_3 に結合し；或いは式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_8 は G_3 に結合し；

20

【 0 0 3 1】

或いは h は1であり； i は1であり；そして R_{32} と R_{42} は、一緒になって、式Idの基のいずれかであり、ここでの G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_4 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_9 は G_4 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_8 は G_4 に結合し；

【 0 0 3 2】

或いは i は1であり； j は1であり；そして R_{42} と R_{52} は、一緒になって、式Idの基のいずれかであって、ここでの G_6 は G_4 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_5 に結合し；或いは式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_4 に結合し；そしてここでの G_9 は G_5 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_4 に結合し；そしてここでの G_8 は G_5 に結合し；ここでの式Ibでは、 f は1であり； g は1であり；そして R_{12} と R_{22} は、一緒になって、式Idの基のいずれかであり、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_2 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_9 は G_2 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_8 は G_2 に結合し；または g は1であり； h は1であり；そして R_{22} と R_{32} は一緒になって、式Idのいずれかの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_3 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_9 は G_3 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_8 は G_3 に結合し；または h は1であり； i は1であり；そして R_{32} と R_{42} は、一緒になって、式Idの基のいずれかであり、ここで G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_4 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_9 は G_4 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_3 に結合し；そしてここでの G_8 は G_4 に結合し；

30

40

【 0 0 3 3】

ここでの式Icでは、 f は1であり； g は1であり；そして R_{12} と R_{22} は一緒になって、式Idのいずれかの基である、のいずれかであり、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_2 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_9 は G_2 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_1 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_2 に結合し；

【 0 0 3 4】

或いは g は1であり； h は1であり；そして R_{22} と R_{32} は、一緒になって式Idの基のいずれか

50

であり、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_{10} は G_3 に結合し；または式Ieの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_9 は G_3 に結合し；または式Ifの基であって、ここでの G_6 は G_2 に結合し；そしてここでの G_8 は G_3 に結合し；

【0035】

ここでの式Ia、Ib及びIcでは、原子 G_1 及び G_2 は、一つの追加の結合によって連結され得、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_1 が窒素原子であるならば R_{12} 、そして G_1 が炭素原子であるならば R_{11} または R_{12} ）、及び第二の置換基（ G_2 が窒素原子であるならば R_{22} 、そして G_2 が炭素原子であるならば R_{21} または R_{22} ）が一緒になることによって表され；

【0036】

ここでの式Ia、Ib及びIcでは、原子 G_2 及び G_3 は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_2 が窒素原子であるならば R_{22} 、そして G_2 が炭素原子であるならば R_{21} または R_{22} ）、及び第二の置換基（ G_3 が窒素原子であるならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子であるならば R_{31} または R_{32} ）が一緒になることによって表され；

【0037】

ここでの式Ia及びIbでは、原子 G_3 及び G_4 は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_3 が窒素原子ならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子である場合 R_{31} または R_{32} ）、及び第二の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42} ）が一緒になることによって表され；

ここでの式Iaでは、原子 G_4 及び G_5 は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42} ）、そして第二の置換基（ G_5 が窒素原子であるならば R_{52} 、そして G_5 が炭素原子であるならば R_{51} または R_{52} ）が一緒になることによって表され；

【0038】

ここでの式Ia、Ib及びIcでは、原子 G_1 は、一つの追加の結合により R_5 を担持する式Iに見られる炭素原子と連結することができ、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_1 が窒素原子であるならば R_{12} 、そして G_1 が炭素原子であるならば R_{11} または R_{12} ）、及び第二の置換基（ R_5 ）が一緒になることによって表され；

【0039】

ここでの式Iaでは、原子 G_5 は、一つの追加の結合により R_8 を担持する式Iに見られる炭素原子と連結することができ、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_5 が窒素原子であるならば R_{52} であり、そして G_5 が炭素原子であるならば R_{51} または R_{52} であり）、及び第二の置換基（ R_8 ）が一緒になることによって表され；

【0040】

ここでの式Ibでは、原子 G_4 は、一つの追加の結合により R_8 を担持する式Iに見られる炭素原子と連結することができ、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば、 R_{41} または R_{42} ）、及び第二の置換基（ R_8 ）が一緒になることによって表され；

【0041】

ここでの式Icでは、原子 G_3 は、一つの追加の結合により R_8 を担持する式Iに見られる炭素原子と連結することができ、当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_3 が窒素原子であるならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子であるならば R_{31} または R_{32} ）、及び第二の置換基（ R_8 ）が一緒になることによって表され；

【0042】

ここでの式Iaでは、それらの個々の置換基は、置換基 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{31} 、 R_{32} 、 R_{41} 、 R_{42} 、 R_{51} 及び R_{52} から成る群から選定され、それらは一緒になって式Id、IeまたはIfの基を形成する2つの置換基とは異なり、且つ存在するならば、後に定義するような式Iaの任意の第一の置換基、及び存在するならば、後に定義するような式Iaの任意の第二の置換基と異なり、置換基Rfから成る群から独立して選定され；

【0043】

10

20

30

40

50

ここでの式Ibでは、それらのそれぞれの置換基は、置換基 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{31} 、 R_{32} 、 R_{41} 、及び R_{42} から成る群から選定され、それらは一緒になって式Id、IeまたはIfの基を形成する2つの置換基とは異なり、及び存在するならば、後に定義するような式Ibの任意の第一の置換基とは異なり、及び存在するならば、後に定義するような式Ibの任意の第二の置換基とは異なり、置換基Rfから成る群から独立して選定され；

【0044】

ここでの式Icでは、それらのそれぞれの置換基は、置換基 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{31} 、及び R_{32} から成る群から選定され、それらは一緒になって式Id、Ie、またはIfの基を形成する2つの置換基とは異なり、及び存在するならば、後に定義するような式Icの任意の第一の置換基とは異なり、及び存在するならば、後に定義するような式Icの任意の第二の置換基とは異なり、置換基Rfから成る群から独立して選定され；

10

【0045】

Rfは水素；または置換基Rgであり；置換基Rgの総数は、存在するならば、上限で5個の式Iaの基；4個の式Ibの基；そして3個の式Icの基を有するが；それらの総数は、式Ia、IbまたはIcの特定の基を、を上記上限よりも小さい数値に制限することができ、その数値はこの特定の基の中の置換基Rgによる置換のために利用できる位置の数と等しく；

【0046】

Rgは炭素原子に結合し、そして置換基Rg-cから成る群から選定され；または窒素原子に結合し、そして置換基Rg-nから成る群から選定される、のいずれかであり；

Rg-cは置換基Rcであり；

20

【0047】

Rg-nはシアノ；ニトロ； C_1 - C_6 アルキル；ハロ- C_1 - C_6 アルキル； C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル； C_2 - C_6 アルケニル；ハロ- C_2 - C_6 アルケニル； C_2 - C_6 アルキニル；ハロ- C_2 - C_6 アルキニル； C_3 - C_6 シクロアルキル；ハロ- C_3 - C_6 シクロアルキル； C_1 - C_6 アルコキシ；ハロ- C_1 - C_6 アルコキシ； C_3 - C_6 シクロアルコキシ； C_1 - C_6 アルキルチオ；ハロ- C_1 - C_6 アルキルチオ； C_1 - C_6 アルキルスルフィニル；ハロ- 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；ハロ- C_1 - C_6 アルキルスルホニル；アミノ； C_1 - C_6 アルキルアミノ；ハロ- C_1 - C_6 アルキルアミノ；ジ- C_1 - C_6 アルキルアミノであり、ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、或いは一緒になって、それらが結合する窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は、1個の窒素環原子及び2～12個の炭素環原子、並びに任意に1個の更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、当該環は非置換であるか、またはシアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシ；ジ-(ハロ- C_1 - C_6 アルキル)-アミノ（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）； C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ；N-(C_1 - C_6 アルキル)-N-(C_3 - C_6 シクロアルキル)-アミノ； C_1 - C_6 アルコキシカルボニル；ハロ- C_1 - C_6 アルコキシカルボニル；アミノカルボニル； C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル；ハロ- 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（ここでの2つのアルキル基は同一もしくは相違し、または一緒になって、それらに結合している窒素原子と一緒に環を形成し、当該環は1個の窒素環原子及び2～12個の炭素環原子そして任意に1個の更なるヘテロ環原子（1個の炭素環原子に置き換わり、そして酸素、硫黄及び窒素原子から成る群から選定される）を含み、当該環は非置換であるか、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル及び C_1 - C_4 アルコキシ；ジ-(ハロ- C_1 - C_6 アルキル)-アミノカルボニル（ここでの2つのハロアルキル基は同一もしくは相違する）； C_1 - C_6 アルキルカルボニル；ハロ- C_1 - C_6 アルキルカルボニル；トリ- C_1 - C_6 アルキルシリル（ここでの3つのアルキル基は同一もしくは相違する）；或いはフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシまたは単環式もしくは二環式ヘテロアリール基（当該基は非置換であるか、置換基Raから成る群から選定される1～4個の置換基によって独立して置換される）から成る群から選定される1～4個の置換基によって独立して置換され；

30

40

【0048】

式Id、Ie及びIfでは、kは0；pは0；そして G_6 はC(=O)基；C(=S)基；酸素原子；硫黄原子

50

; S(=O)基; もしくはS(=O)₂基であって; またはkは0; pは1; そしてG₆は窒素原子であり; またはkは1; pは1; そしてG₆は炭素原子である、のいずれかであり; lは0; qは0; そしてG₇はC(=O)基; C(=S)基; 酸素原子; 硫黄原子; S(=O)基; もしくはS(=O)₂基; またはlは0; qは1; そしてG₇は窒素原子; またはlは1; qは1; そしてG₇は炭素原子である、のいずれかであり; 並びにmは0; rは0; そしてG₈はC(=O)基; C(=S)基; 酸素原子; 硫黄原子; S(=O)基; もしくはS(=O)₂基であって; またはmは0; rは1; そしてG₈は窒素原子であり; またはmは1; rは1; そしてG₈は炭素原子である、のいずれかであり;

【0049】

式Id及びIeでは、nは0; sは0; そしてG₉はC(=O)基; C(=S)基; 酸素原子; 硫黄原子; S(=O)基; もしくはS(=O)₂基であって; またはnは0; sは1; そしてG₉は窒素原子; またはnは1; sは1; 及びG₉は炭素原子である、のいずれかであり;

10

【0050】

式Idでは、oは0; tは0; そしてG₁₀はC(=O)基; C(=S)基; 酸素原子; 硫黄原子; S(=O)基; もしくはS(=O)₂基であって; またはoは0; tは1; そしてG₁₀は窒素原子であり; またはoは1; tは1; そしてG₁₀は炭素原子である、のいずれかであり;

【0051】

式Id、Ie及びIfでは、原子G₆及びG₇は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合は、存在するならば、第一の置換基(G₆が窒素原子である場合はR₆₂、そしてG₆が炭素原子である場合はR₆₁またはR₆₂)、及び第二の置換基(G₇が窒素原子である場合はR₇₂、そしてG₇が炭素原子である場合はR₇₁またはR₇₂)が一緒になることによって表され;

20

【0052】

式Id、Ie及びIfでは、原子G₇及びG₈は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合は、存在するならば、第一の置換基(G₇が窒素原子であるならばR₇₂、そしてG₇が炭素原子であるならばR₇₁またはR₇₂)、及び第二の置換基(G₈が窒素原子ならばR₈₂、そしてG₈が炭素原子ならばR₈₁またはR₈₂)と一緒にすることによって表され;

【0053】

式Id及びIeでは、原子G₈及びG₉は一つの追加の結合によって連結され得、当該結合は、存在するならば、第一の置換基(G₈が窒素原子であるならばR₈₂、そしてG₈が炭素原子であるならばR₈₁またはR₈₂)、及び第二の置換基(G₉が窒素原子であるならばR₉₂、そしてG₉が炭素原子であるならばR₉₁またはR₉₂)が一緒になることによって表され;

30

【0054】

式Idでは原子G₉及びG₁₀は、一つの追加の結合によって連結され得、当該結合は、存在するならば、第一の置換基(G₉が窒素原子であるならばR₉₂、そしてG₉が炭素原子である場合はR₉₁またはR₉₂)、及び第二の置換基(G₁₀が窒素原子である場合はR₁₀₂、そしてG₁₀が炭素原子である場合はR₁₀₁またはR₁₀₂)と一緒にすることによって表され;

【0055】

式Id、Ie及びIfでは、原子G₆は一つの追加の結合によって式Ia、Ib及びIc中に見られる原子G₁(当該結合が存在するならば、第一の置換基(G₆が窒素原子であるならばR₆₂、そしてG₆が炭素原子であるならばR₆₁またはR₆₂)、及び第二の置換基(G₁が窒素原子であるならばR₁₂、そしてG₁が炭素原子であるならば、R₁またはR₁₂)が一緒になることによって表され); または一つの追加の結合によって式Ia、Ib及びIc中に見られる原子G₂(当該結合が存在するならば、第一の置換基(G₆が窒素原子であるならばR₆₂、そしてG₆が炭素原子であるならばR₆₁またはR₆₂)、及び第二の置換基(G₂が窒素原子であるならばR₂₂、そしてG₂が炭素原子であるならばR₂₁またはR₂₂)が一緒になることによって表され); または一つの追加の結合によって式Ia及びIbにおいて見られる原子G₃(当該結合が存在するならば、第一の置換基(G₆が窒素原子であるならばR₆₂、そしてG₆が炭素原子であるならばR₆₁またはR₆₂)、及び第二の置換基(G₃が窒素原子であるならばR₃₂、そしてG₃が炭素原子であるならばR₃₁またはR₃₂)が一緒になることによって表され); または一つの追加の結合によって式Iaにおいて見られる原子G₄(当該結合が存在するならば、第一の置換基(G₆が窒素原子であるならばR₆₂、そしてG₆が炭素原子であるならばR₆₁または

40

50

R_{62} ）、及び第二の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、および G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42} ）が一緒になることによって表され）のいずれかと連結され得；

【0056】

式Idでは、原子 G_{10} は、式Ia、Ib及びIcに見られる原子 G_2 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_{10} が窒素原子であるならば R_{102} 、そして G_{10} が炭素原子であるならば R_{101} または R_{102} ）、及び第二の置換基（ G_2 が窒素原子であるならば R_{22} 、そして G_2 が炭素原子であるならば R_{21} または R_{22} ）が一緒になることによって表される）；

【0057】

或いは、式Ia、Ib及びIcに見られる原子 G_3 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_{10} が窒素原子であるならば R_{102} 、そして G_{10} が炭素原子であるならば R_{101} または R_{102} ）、及び第二の置換基（ G_3 が窒素原子であるならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子であるならば、 R_{31} または R_{32} ）が一緒になることによって表される）；

【0058】

或いは式Ia及びIbに見られる原子 G_4 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_{10} が窒素原子であるならば R_{102} 、そして G_{10} が炭素原子であるならば R_{101} または R_{102} ）、及び第二の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42} ）が一緒になることによって表される）；

【0059】

或いは式Iaに見られる原子 G_5 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_{10} が窒素原子であるならば R_{102} 、そして G_{10} が炭素原子であるならば R_{101} または R_{102} ）、及び第二の置換基（ G_5 が窒素原子であるならば R_{52} 、そして G_5 が炭素原子であるならば R_{51} または R_{52} ）が一緒になることによって表される）、のいずれかと連結され得；

【0060】

式Ieでは、原子 G_9 は式Ia、Ib及びIcに見られる原子 G_2 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_9 が窒素原子であるならば R_{92} 、そして G_9 が炭素原子であるならば R_{91} または R_{92} ）、及び第二の置換基（ G_2 が窒素原子であるならば R_{22} 、そして G_2 が炭素原子であるならば R_{21} または R_{22} ）が一緒になることによって表される）；

【0061】

或いは式Ia、Ib及びIcに見られる原子 G_3 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_9 が窒素原子であるならば R_{92} 、そして G_9 が炭素原子であるならば R_{91} または R_{92} ）、及び第二の置換基（ G_3 が窒素原子であるならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子であるならば R_{31} または R_{32} ）が一緒になることによって表され）；

【0062】

或いは式Ia及びIbにおいて見られる原子 G_4 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_9 が窒素原子であるならば R_{92} 、そして G_9 が炭素原子であるならば R_{91} または R_{92} ）及び第二の置換基（ G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42} ）が一緒になることによって表される）；

【0063】

或いは式Iaにおいて見られる原子 G_5 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_9 が窒素原子であるならば R_{92} 、そして G_9 が炭素原子であるならば R_{91} または R_{92} ）、及び第二の置換基（ G_5 が窒素原子であるならば R_{52} 、そして G_5 が炭素原子であるならば R_{51} または R_{52} ）が一緒になることによって表される）、のいずれかと連結され得；

【0064】

式Ifでは、原子 G_8 は式Ia、Ib及びIcにおいて見られる原子 G_2 と、一つの追加の結合により（当該結合が存在するならば、第一の置換基（ G_8 が窒素原子であるならば R_{82} 、そして G_8 が炭素原子であるならば R_{81} または R_{82} ）、及び第二の置換基（ G_2 が窒素原子であるならば

10

20

30

40

50

ば R_{22} 、そして G_2 が炭素原子であるならば R_{21} または R_{22}) が一緒になることによって表される) ;

【 0 0 6 5 】

或いは式 Ia、Ib 及び Ic において見られる原子 G_3 と、一つの追加の結合により (当該結合が存在するならば第一の置換基 (G_8 が窒素原子であるならば R_{82} 、そして G_8 が炭素原子であるならば R_{81} または R_{82})、及び第二の置換基 (G_3 が窒素原子であるならば R_{32} 、そして G_3 が炭素原子であるならば R_{31} または R_{32}) が一緒になることによって表される) ;

【 0 0 6 6 】

或いは式 Ia 及び Ib においてみられる原子 G_4 と、一つの追加の結合により (当該結合が存在するならば、第一の置換基 (G_8 が窒素原子であるならば R_{82} 、そして G_8 が炭素原子であるならば R_{81} または R_{82})、及び第二の置換基 (G_4 が窒素原子であるならば R_{42} 、そして G_4 が炭素原子であるならば R_{41} または R_{42}) が一緒になることによって表される) ;

【 0 0 6 7 】

或いは式 Ia において見られる原子 G_5 と、一つの追加の結合により (当該結合が存在するならば、第一の置換基 (G_8 が窒素原子であるならば R_{82} 、そして G_8 が炭素原子であるならば R_{81} または R_{82})、及び第二の置換基 (G_5 が窒素原子であるならば R_{52} 、そして G_5 が炭素原子であるならば R_{51} または R_{52}) が一緒になることによって表される)、のいずれかと連結され得 ;

【 0 0 6 8 】

式 Id では、置換基 R_{61} 、 R_{62} 、 R_{71} 、 R_{72} 、 R_{81} 、 R_{82} 、 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{101} 及び R_{102} から成る群から選定されるそれらの個々の置換基は、存在するならば、式 Id に関して上記定義した任意の第一の置換基、及び存在するならば、式 Id に関して上記定義した任意の第二の置換基とは異なり、置換基 Rh から成る群から独立して選定され ;

【 0 0 6 9 】

式 Ie では、置換基 R_{61} 、 R_{62} 、 R_{71} 、 R_{72} 、 R_{81} 、 R_{82} 、 R_{91} 及び R_{92} から成る群から選定されるそれらの個々の置換基は、存在するならば式 Ie に関して上記定義した任意の第一の置換基、及び存在するならば、式 Ie に関して上記定義した任意の第二の置換基とは異なり、置換基 Ri から成る群から独立して選定され ;

【 0 0 7 0 】

式 If では、置換基 R_{61} 、 R_{62} 、 R_{71} 、 R_{72} 、 R_{81} 及び R_{82} から成る群から選定されるそれらの個々の置換基は、存在するならば式 If に関して上記定義した任意の第一の置換基、及び存在するならば、式 If に関して上記定義した任意の第二の置換基とは異なり、置換基 Rh から成る群から独立して選定され ;

【 0 0 7 1 】

Rh は水素 ; または置換基 Rj であり ; 置換基 Rj の総数は、存在するならば式 Id の基に関して上限で 6 個 ; 及び If の基に関して上限で 4 個を有するが ; 当該総数は、式 I または If の特定の基を、上記上限よりも小さい数値に制限することができ、その数値はこの特定の基の中の置換基 Rj による置換のために利用できる位置の数と等しく ;

【 0 0 7 2 】

Ri は水素 ; または置換基 Rk であり ; 置換基 Rk の総数は、存在するならば、上限で 5 個を有するが ; 当該総数は、式 Ie の特定の基を、上記上限よりも小さい数値に制限することができ、その数値はこの特定の基の中の置換基 Rk による置換のために利用できる基の数と等しく ;

【 0 0 7 3 】

Rj は炭素原子に結合し、且つ置換基 Rj-c から成る群から選定され ; 或いは窒素原子に結合し、且つ置換基 Rj-n から成る基から選定される、のいずれかであり ;

Rj-c は置換基 Rc であり ;

Rj-n は置換基 Rg-n であり ;

Rk は炭素原子に結合し、且つ置換基 Rk-c から成る群から選定され ; 或いは窒素原子に結合し、且つ置換基 Rk-n から成る群から選定される、のいずれかであり ;

10

20

30

40

50

【 0 0 7 4 】

或いは2つの置換基R_kは、その一方（原子G₆に結合し、且つG₆が窒素原子であるならばR₆₂、そしてG₆が炭素原子であるならばR₆₁またはR₆₂により表される）、及び他の一方（原子G₉に結合し、且つG₉が窒素原子であるならばR₉₂、及びG₉が炭素原子であるならばR₉₁またはR₉₂により表される）が一緒になって、-CH₂-；または-O-であり；

【 0 0 7 5 】

R_k-cは置換基R_cであり；

R_k-nは置換基R_g-nであり；

R₈は水素；C₁-C₆アルキル；もしくはハロ-C₁-C₆アルキルであり；または前記または後記で定義される1つの意味を有し；

或いはR₅及びR₈は、一緒になった結合であり；

【 0 0 7 6 】

但し、

(i) 酸素環原子が存在するならば、更なる酸素環原子があっても直接連結されず；

(ii) G₁、G₂、G₃、G₄、G₅、G₆、G₇、G₈、G₉及びG₁₀から成る群から選定される炭素環原子が存在するならば、任意の他の原子と3重結合により、または任意の他の2つの異なる原子と2重結合により直接連結されず；

(iii) 6を超えない変数G₁、G₂、G₃、G₄、G₅、G₆、G₇、G₈、G₉及びG₁₀は、存在するならば酸素原子、硫黄原子、(=O)基、S(=O)₂基及び窒素原子から成る群から選定され得、これらの変数の残りはそれぞれ、もしあるならば、炭素原子、C(=O)基及びC(=S)基から成る群から選定され、且つ前記6個の変数の3個までが酸素原子、硫黄原子、S(=O)基及びS(=O)₂基から成る群から選定され得；そして

(iv) 以後断わりのない限り、特定の発生での変数の意味(meaning)は、もしあるならば任意の他の発生での同一の変数の意味から独立して選定され得る。

【 0 0 7 7 】

他に断わりのない限り、上記及び下記で使用される一般的な用語は、以後当該意味を有する。

【 0 0 7 8 】

基自体として、並びに他の基及び化合物の構造要素（ハロアルキル等）としてのハロゲンは、例えば、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特にフッ素、塩素または臭素であるが、特に塩素または臭素である。

【 0 0 7 9 】

他に断わりのない限り、炭素含有基及び炭素含有化合物は、例えばそれぞれの場合において炭素原子を1～15個までを含み、好適には1～10個までを含み、特に1～8個までを含み、詳細には1～5個までを含み、特に1又は2個を含むことを含んで成る。

【 0 0 8 0 】

基自体として、並びに他の基及び化合物の構造要素（ハロシクロアルキル等）としてのシクロアルキルは、それぞれの場合において関連する基または化合物中に含まれる炭素原子数が十分に考慮され、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルである。

【 0 0 8 1 】

基自体として、並びに他の基及び化合物の構造要素（ハロアルキル等）としてのアルキルは、それぞれの場合において関連する基または化合物中に含まれる炭素原子が十分に考慮され、直鎖（例えばメチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチルもしくはヘキシル）または分岐している（例えばイソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチルもしくはイソヘキシル）のいずれかである。

【 0 0 8 2 】

基自体として、並びに他の基及び化合物の構造要素（ハロアルケニル等）としてのアルケニルは、それぞれの場合において関連する基または化合物中に含まれる炭素原子が十分に考慮され、直鎖または分岐し、そしてそれぞれの場合において2個以上または好適には1

10

20

30

40

50

個の炭素-炭素二重結合（これらの置換基の二重結合は、好適には少なくとも1つの飽和炭素原子によって化合物Iの残存部位から独立している）を含み、そして例えば、アリル、プロペン-2-イル、メタリル、ブタ-2-エン-1-イル、ブタ-3-エン-1-イルまたはペンタ-4-エン-1-イルである。

【0083】

基自体として、並びに他の基及び化合物の構造要素（ハロアルキニル等）としてのアルキニルは、それぞれの場合において関連する基または化合物中に含まれる炭素原子が十分に考慮され、直鎖または分岐し、そしてそれぞれの場合において2個以上または好適には1個の炭素-炭素三重結合（これらの置換基の三重結合は、好適には少なくとも1つの飽和炭素原子によって化合物Iの残存部位から独立している）を含み、そして例えば、プロパ

10

【0084】

アリールは、例えば、ナフチルまたは好適にはフェニルである。

【0085】

ヘテロアリールは、例えば、5または6個の環員を有す環、或いはそれぞれの場合に独立してお互い5または6個の環員を有する少なくとも2個の環の組合せから成る芳香族環骨格を有し、ここで例えば1~4個まで含まれる環員は、窒素、酸素及び硫黄から成る群から選定されるヘテロ原子であり、そして例えば、ピリジル、チエニル、ピラゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、フリル、オキサジアゾリル、インドリジニル、ピリミジル、キノリルまたはプテリジニルである。

20

【0086】

非-芳香族性ヘテロシクリルは、例えば、5または6個の環員を有する環、或いはそれぞれの場合に独立してお互い5または6個の環員を有する少なくとも2個の環の組合せから成る非-芳香族環骨格を有し、ここで例えば1~4個まで含まれる環員は、窒素、酸素及び硫黄から成る群から選定されるヘテロ原子であり、そして例えば、ピペリジル、ピロリニル、テトラヒドロフリルまたはクロマニル(chromanyl)である。

【0087】

ハロゲンで置換された炭素含有基及び化合物（ハロアルキル等）は、部分的にハロゲン化され、またはペルハロゲン化されて得、ここでのポリハロゲン化の場合、ハロゲン置換基は同一もしくは相違し得る。

30

【0088】

以下は、本発明の範囲内にある更に好適な態様である：

(3)式Iの(1)または(2)に係る化合物であって、式中 Z_1 は酸素原子である化合物；

(4)式Iの(1)~(3)のいずれか1つの化合物であって、式中 Z_2 は酸素原子である化合物；

(5)式Iの(1)~(4)のいずれか1つの化合物であって、式中 R_1 はフェニル、ピリジル、またはピラゾリル基であって、非置換であるか、または好適には置換されており；

詳細には、フェニル、ピリジルまたはピラゾリル基であって、ハロゲン、 C_1 - C_6 アルキル、ハロ- C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、ハロ- C_1 - C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1~3個の置換基（当該基は非置換であるか、または好適には置換されている）によって独立して置換され；

40

より詳細にはフェニル、ピリジルまたはピラゾリル基であって、ハロゲン、 C_1 - C_6 アルキル、ハロ- C_1 - C_6 アルキル、ハロ- C_1 - C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1~3個の置換基（当該基はハロゲン及び C_1 - C_6 アルキルから成る群から選定される1~3個の置換基によって独立して置換される）により独立して置換され；好適にはフェニルまたはピリジル基であって、 C_1 - C_6 アルキル及びハロ- C_1 - C_6 アルキルから成る群から選定される1~3個の置換基によって独立して置換され；

或いはピラゾリル基であって、ハロゲン、 C_1 - C_6 アルキル、ハロ- C_1 - C_6 アルキル、ハロ- C_1 - C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1~3個の置換基（当該基はハロゲン及び C_1 - C_6 アルキルから成る群から選定される1~3個の置換基によって独立して置換される）によって独立して置換され；

50

より好適にはピラゾリル基であって、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1～3個の置換基（当該基はハロゲン及び C_1-C_6 アルキルから成る群から選定される1～3個の置換基によって独立して置換される）によって独立して置換され；

詳細には、ピラゾール-3-イル基であって、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1～3個の置換基（当該基はハロゲン及び C_1-C_6 アルキルから成る群から選定された1～3個の置換基によって独立して置換される）によって独立して置換され；

より詳細には、ピラゾール-3-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルコキシ及びフェニルまたはピリジル基から成る群から選定される1～3個の置換基（当該置換基はハロゲン及び C_1-C_6 アルキルから成る群から選定される1～3個の置換基によって独立して置換される）によって独立して置換され；

10

好適にはピラゾール-3-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルコキシ及びピリジル基から成る群から選定される1～3個の置換基（当該基はハロゲンから成る基から選定される1～3個の置換基によって独立して置換される）によって独立して置換され；

より好適にはピラゾール-3-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキル、ハロ- C_1-C_6 アルコキシ及びピリジル基から成る群から選定される1～3個の置換基（当該基はハロゲンから成る基から選定される1または2個の置換によって独立して置換される）によって独立して置換され；

20

詳細にはピラゾール-5-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキルまたはハロ- C_1-C_6 アルコキシにより3位が置換され、そしてピリジル基によって1位が置換され、当該基はハロゲンから成る群から選定される1または2個の置換基によって独立して置換され；

より詳細にはピラゾール-5-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキルまたはハロ- C_1-C_6 アルコキシによって3位が置換され、そしてピリジル基によって1位が置換され、当該基はハロゲンによって3位が置換され；

好適にはピラゾール-5-イル基であって、ハロゲン、ハロ- C_1-C_6 アルキルまたはハロ- C_1-C_6 アルコキシによって3位が置換され、そしてピリジル基によって1位が置換され、当該基は塩素または臭素によって3位が置換され；

より好適にはピラゾール-5-イル基であって、ハロ- C_1-C_6 アルキルによって3位が置換され、そしてピリジル基によって1位が置換され、当該基は塩素または臭素によって置換され；

30

最適にはピラゾール-5-イル基であって、トリフルオロメチルによって3位が置換され、そしてピリジル基によって1位が置換され、当該基は塩素または臭素によって3位が置換され；

【0089】

(6) (1)～(5)のいずれかに記載の式Iの化合物であって、式中 R_2 は水素または C_1-C_6 アルキル；好適には水素であり；

【0090】

(7) (1)～(6)のいずれかに記載の式Iの化合物であって、式中 R_3 は水素または C_1-C_6 アルキル；好適には水素であり；

40

【0091】

(8) (1)～(7)のいずれかに記載の式Iの化合物であって、式中 R_4 は C_1-C_6 アルキル；好適にはメチルまたはイソプロピルであり；

【0092】

(9) (1)～(8)のいずれかに記載の式Iの化合物であって、式中 R_5 及び R_8 は、一緒になった結合であり；

【0093】

(10) (1)～(9)のいずれかに記載の式Iの化合物であって、式中 R_6 及び R_7 は、一緒になって、式Ibの基または式Icの基であり；

50

【 0 0 9 4 】

(11) (1) ~ (10)のいずれかに記載の式 I の化合物であって、式中、式 I に見られる、 R_6 及び R_7 に結合した 2 つの炭素原子は、芳香族環の 2 個の環員であり；

【 0 0 9 5 】

(12) (1) ~ (11)のいずれかに記載の式 I の化合物であって、式中 R_6 及び R_7 は、一緒になって、式 I に見られる、それらが結合する 2 つの炭素原子と一緒に、並びに R_5 と一緒に、及び R_8 と一緒に、式 T1 ~ T85 に見られる、または式 T1 ~ T71 に見られる二環式環系の一つを形成し、それぞれの環系は、2 つの置換基 - $N(R_2)$ - $C(=Z_1)$ - R_1 及び - $C(=Z_2)$ - $N(R_3)$ - R_4 によって置換され；

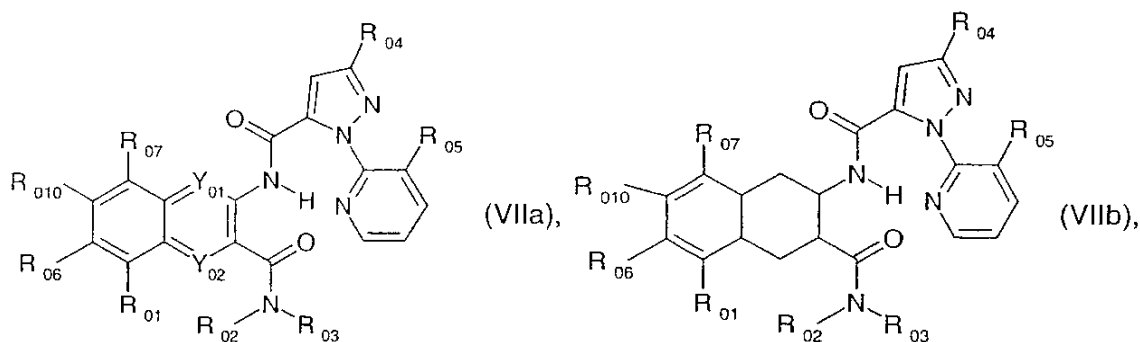
好適には一緒になって、式 I に見られる、それらが結合する 2 つの炭素原子と一緒に、並びに R_5 と一緒に、及び R_8 と一緒に、式 T1、T6、T7、T21、T37 及び T38 に見られる二環式環系の一つを形成し、それぞれの環系は 2 つの置換基 - $N(R_2)$ - $C(=Z_1)$ - R_1 及び - $C(=Z_2)$ - $N(R_3)$ - R_4 により置換され；

より好適には一緒になって、式 I に見られる、それらが結合する 2 つの炭素原子と一緒に、並びに R_5 と一緒に、及び R_8 と一緒に、式 T1 及び T7 に見られる、または式 T2、T22、T75、T76、T78、T79 及び T81 において見られる二環式環系の一つを形成し、それぞれの環系は 2 つの置換基 - $N(R_2)$ - $C(=Z_1)$ - R_1 及び - $C(=Z_2)$ - $N(R_3)$ - R_4 によって置換される。

【 0 0 9 6 】

更に好適な式 I の化合物のサブグループは、式 VIIa 及び VIIb の化合物によって表され

【 化 8 】



式中 R_{01} は水素；アミノまたはニトロであり；

R_{02} は水素または C_1 - C_4 アルキルであり；

R_{03} は C_1 - C_4 アルキル、シアノ、 $COOH$ 、ニトロ、 C_1 - C_4 アルコキシまたはシクロプロピルによって 1 置換または 2 置換された C_1 - C_4 アルキル；

C_2 - C_8 アルケニル、ハロゲンにより置換された C_2 - C_8 アルケニル；

C_1 - C_4 アルコキシ、 C_3 - C_6 -アルキニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、 C_1 - C_4 アルキル、ピリジル、フェニル- C_2 - C_6 アルケニルまたはシクロプロピルによって置換されたシクロプロピル；

C_1 - C_4 アルキルによって置換されたシクロブチル；

シクロペンチルチオ- C_1 - C_4 アルキル、ベンジルオキシ、ハロゲンによって置換されたベンジルオキシ；

ベンジルチオ- C_1 - C_4 アルキル（ベンジル基は、それ自体がハロフェニルによって置換された C_1 - C_4 アルキルチオフェニルにより置換され得る）；

フェニルオキシ- C_1 - C_4 アルキル（フェニル基はハロゲンによって 1 置換または 2 置換され得る）；

フェニル- C_1 - C_4 アルキル（フェニル基は、それ自体がハロゲン、ニトロ、ベンゾチアゾール-2-イルオキシ、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ及び C_1 - C_4 アルキルから選定され

る置換基によって1置換または2置換され得る) ;

3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピニル(dioxepinyl)、C₁-C₄アルコキシによって置換された1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレニル ;

C₂-C₆アルケニルオキシ、C₁-C₄アルキルによって置換されたイソオキサゾリル ;

チアゾリル、C₁-C₄アルコキシカルボニル-C₁-C₄アルキル、ヒドロキシ、ハロフェニルオキシ、C₁-C₄アルキル-シリル(C₁-C₄-アルキル)₃またはC₂-C₆アルキニルによって置換されたフェニル ;

C₁-C₄アルコキシによって置換されたピリジル ;

C₁-C₆アルキルチオ-C₁-C₄アルキル、C₂-C₆アルケニルチオ-C₁-C₄アルキル、C₃-C₆アルキニルチオ-C₁-C₄アルキル、ジオキサラン-2-イル-C₁-C₄アルキル、(C₁-C₄アルキル-ジオキサラン-2-イル)-C₁-C₄アルキル、トリアゾリル-C₁-C₄アルキル、チエニル-C₁-C₄アルキル、モルホリニル-C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルキルチオ-C₁-C₄アルキル、2,3-ジヒドロ-1H-イソインドリル、ハロ置換されたチアゾリル-C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルキルスルホニル-C₁-C₄アルキルまたはキノリルチオ-C₁-C₄アルキル(ここでのキノリン基はC₁-C₄ハロアルキルにより置換され得る)であり ;

R04はC₁-C₄ハロアルキルであり ;

R05はハロゲンであり ;

R05及びR010はそれぞれ、同一もしくは相違してよく、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシ、シアノ、ハロゲンまたはC₁-C₆アルコキシを表し ;

R07は水素、ニトロまたはハロゲンであり ;

Y01はC(R08)、硫黄、窒素または化学結合であり ;

R08は水素、ハロゲン、C₁-C₄アルキルまたはまたはニトロであり ;

Y02はC(R09)、化学結合、または窒素もしくは硫黄であり ; そしてR09は水素、フェニル、ハロゲンによって置換されたフェニル、またはハロゲンである。

【 0 0 9 7 】

式VIIaの好適な化合物は、式中

R01が水素であり ; R02が水素であり ; R03がC₁-C₄アルキル、好適にはメチルであり ; R04がC₁-C₄フルオロアルキル、好適にはトリフルオロアルキルであり ; R05がクロロであり ; R06がハロゲン、好適にはクロロであり ; R07は水素であり ; Z010は水素であり ; Y01はC(R08)であり ; R08はハロゲン、好適にはクロロであり ; Y02はC(R09)であり、及びR09は水素であるものである。

【 0 0 9 8 】

本発明の範囲内において特に好適には、実施例P3、P6及びP9~P11で述べる式Iの化合物である。

【 0 0 9 9 】

本発明の範囲内において個々に好適には、それぞれ化合物T1.1、T1.3、T6.1、T6.3、T7.1、T7.3、T21.3、T37.3及びT38.3である。

【 0 1 0 0 】

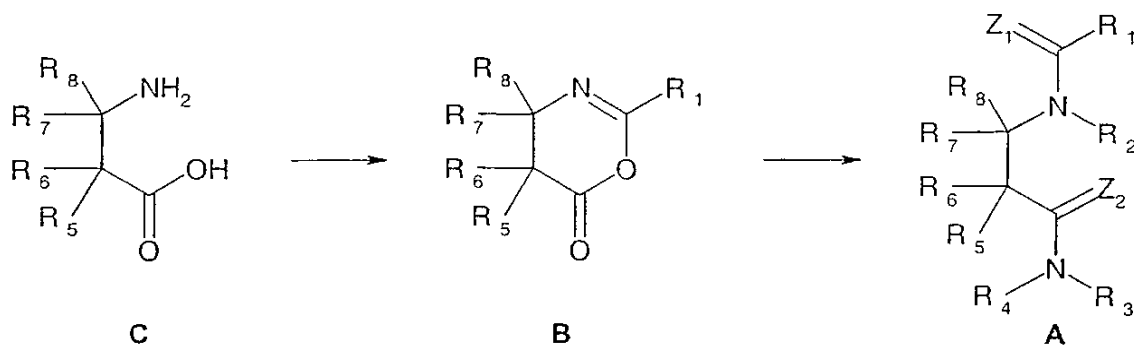
本発明の範囲内において更に個々に好適には、それぞれ化合物T2.1、T22.3、T75.1、T75.3、T76.1、T76.3、T78.1、T79.1及びT81.1である。

【 0 1 0 1 】

式Iの化合物を調製するための本発明に係る方法は、公知方法と同じように実施される。以下のセクションにおいて、置換基R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、Z₁及びZ₂は、断わりのなり限り、請求項1における式Iに定義される通りである。

【 0 1 0 2 】

【化9】



10

Z_1 及び Z_2 が酸素であり且つ R_1 が水素である式Aの化合物は、式 NHR_3R_4 のアミンにより式Bのベンゾオキサジノンの開環から作ることができる。かかるアミンは、公知のものか、或いは公知方法と同じように作ることができるものである。式Bのベンゾオキサジノンは、式Cのアミノ酸を、式 $\text{R}_1\text{-COOH}$ のカルボン酸及び塩化メタンスルホニル等の脱水剤で(任意にピリジンまたはトリエチルアミン等の塩基の存在中)処理することによって作成され得る。或いは式Bのベンゾオキサジノンは式Cのアミノ酸を塩基性条件下において(例えばピリジン中)、式 $\text{R}_1\text{-COCl}$ の酸塩化物で処理し、必要ならば第二の環化ステップ(脱水剤、例えば無水酢酸を用いて達成され得る)により得ることができる。式 $\text{R}_1\text{-COCl}$ の酸塩化物は、式 $\text{R}_1\text{-COOH}$ のカルボン酸から標準条件下(例えば塩化チオニルまたは塩化オキサリルでの処理による)で作成することができる。式 $\text{R}_1\text{-COOH}$ のカルボン酸は、公知化合物であるか、または公知方法と同じように作ることができるものである。

20

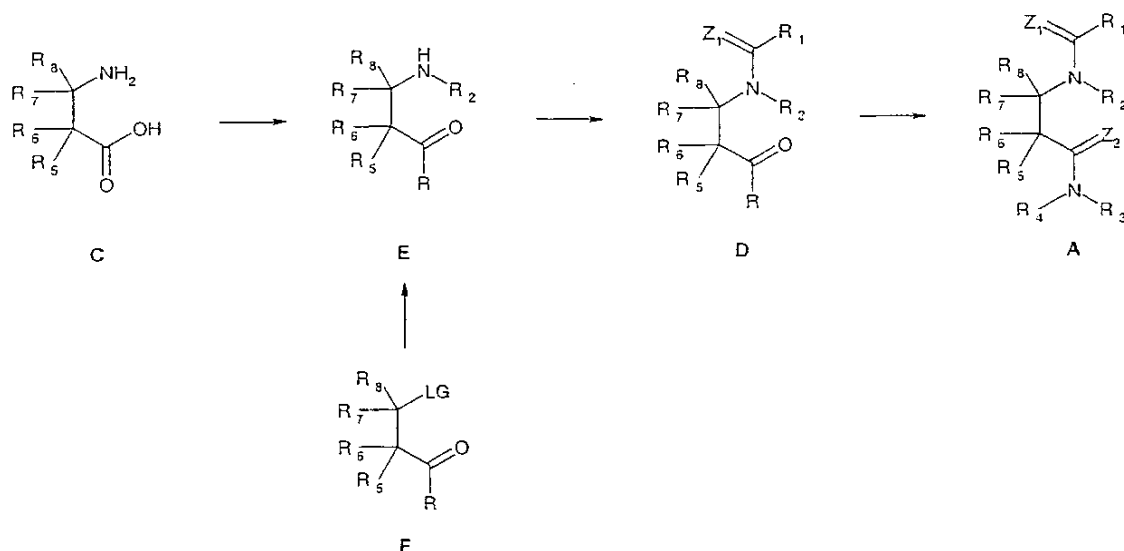
【0103】

Z_1 及び Z_2 が硫黄である式Aの化合物は、Lawesson試薬または五硫化リン等のチオ転移剤での処理により、 Z_1 及び Z_2 が酸素である式Aの化合物から作ることができる。

【0104】

【化10】

30



40

或いは、 Z_1 及び Z_2 が酸素である式Aの化合物は、 Z_1 が酸素であり且つ R が OH 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ アル

50

コキシまたは C_1 である式Dの化合物を、式 NHR_3R_4 のアミンで処理することにより作ることができる。かかるアシル化反応のための標準条件は以下の通りである：RがOHである場合、かかる反応はDCC(N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド)またはEDC(1-エチル-3-[3-ジメチルアミノ-プロピル]カルボジイミド塩酸塩)等のカップリング試薬の存在中で、任意にヒドロキシベンゾトリアゾールまたは4-(ジメチルアミノ)-ピリジン等の求核触媒の存在中で通常実施される。RがClである場合、かかる反応は、塩基性条件(例えばピリジンまたはトリエチルエミンの存在中)、この場合もやはり任意に求核触媒の存在中で通常実施される。エステル(Rが C_1 - C_4 アルコキシである)は、当該エステル及びアミンと一緒に熱工程で加熱することにより直接アミドへ変換させることも可能であり得る。

【0105】

10

Z_1 が酸素であり、且つRがClである式Dの酸塩化物は、 Z_1 が酸素であり、且つRがOHである式Dのカルボン酸から、標準条件下で作ることができる(塩化チオニルまたは塩化オキサリルでの処理等)。 Z_1 が酸素であり、且つRがOHである式Dのカルボン酸は、 Z_1 が酸素であり、且つRが C_1 - C_4 アルコキシである式Dのエステルから形成され得る。天然のアルコキシ基によるかかるエステル加水分解のための多くの方法が存在することは当業者に周知である。かかる転換を達成するために広く使用される方法の一つは、エタノール等の溶媒における水酸化ナトリウム等のアルカリでのエステル処理である。

【0106】

Z_1 が酸素であり、且つRが C_1 - C_4 アルコキシである式Dのエステルは、Rが C_1 - C_4 アルコキシである式Eの化合物を、上記標準条件下での式 R_1 -COOHまたは R_1 -COCl化合物によるアシル化によって処理することにより作成され得る。Rが C_1 - C_4 アルコキシである式Eの化合物は、酸性条件下でのアルコールによる連続処理、そしてN- R_2 結合の形成によって式Cの化合物から作ることができる。天然の置換基 R_2 による本結合を形成するための報告された方法が数多く存在することは当業者に公知である。例えば、還元的アミノ化は、アルデヒドまたはケトン、及びシアノボロ水素化ナトリウム等の還元剤によるアミンの処理により達成され得る。或いはアルキル化は、任意に塩基の存在下でハロゲン化アルキル等のアルキル化剤によるアミンの処置によって達成され得る。或いはアリール化は、適した触媒/リガンド系、しばしばパラジウム(0)複合体の存在中で、アミンをハロゲン化アリールまたはスルホネートで処理することにより達成され得る。

20

【0107】

30

或いは、Rが C_1 - C_4 アルコキシである式Eの化合物は、Rが C_1 - C_4 アルコキシであり、且つLGがフルオロ、クロロまたはスルホネート等の離脱基であって、式Fの化合物から式 R_2 -NH₂のアミンによる離脱基の求核置換を経由して作ることができる。かかる式Fの化合物及び式 R_2 -NH₂のアミドは、公知化合物であるか、または当業者にとって明確である公知方法によって作ることができるものである。

【0108】

Z_1 が硫黄であり、且つ Z_2 が酸素である式Aの化合物は、式 NHR_3R_4 のアミンとのカップリング前に、Lawesson試薬または五硫化リン等のチオ-転移試薬での処理によって、 Z_1 が酸素であり、且つRがOHまたは C_1 - C_4 アルコキシである式Dの化合物から作ることができる。

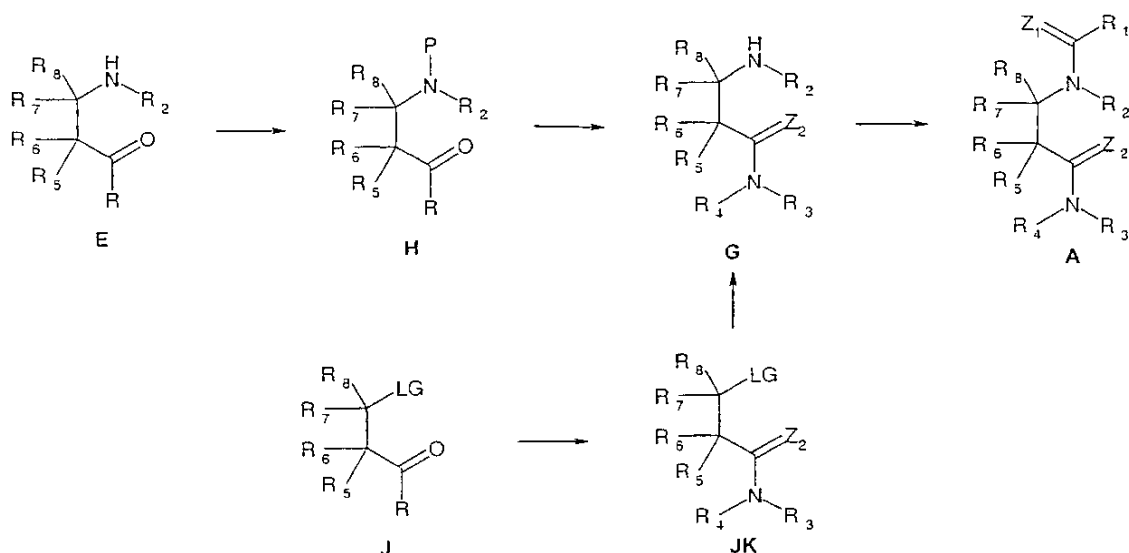
【0109】

40

或いは、RがOHであり Z_1 が酸素である式Dの化合物は、無水酢酸等の脱水剤での処理によって、式Bのベンゾオキサジノンへ脱水され得る。

【0110】

【化 1 1】



10

或いは、 Z_1 及び Z_2 が酸素である式Aの化合物は、上記の式 R_1 -COOHまたは式 R_1 -COClのカルボン酸の酸塩化物による、 Z_2 が酸素である式Gの化合物の処理によって作ることができる。 Z_2 が酸素である式Gの化合物は、Pが適宜保護基であり、且つRがOH、Clまたは C_1 - C_4 アルコキシである式Hの化合物から、式Dの化合物に関する上記の式 NHR_2R_3 のアミンとのアミノ結合形成、その後の標準条件下での保護基Pの除去によって形成され得る。RがOHまたは C_1 - C_4 アルコキシである式Hの化合物は、RがOHまたは C_1 - C_4 アルコキシである式Eの化合物中のアミン官能基の保護によって作ることができる。適切な保護基は、カルバメート(t-ブチルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル及びベンジルオキシカルボニル等)、トリアルキシルシリル基(t-ブチルジメチルシリル等)及びアシル基(アセチル等)を含む。かかる基の形成及び除去は文献で広く報告され、そして当業者に周知である。

20

【0 1 1 1】

30

式Hの化合物及び式Eの化合物に関するエステル(Rは C_1 - C_4 アルコキシ)は、エタノール等の溶媒中で水酸化ナトリウム等のアルカリで処理されることによって、酸(RはOH)に加水分解され得る。当該酸(RはOH)は、式Dの化合物のために上記したような塩化チオニルまたは塩化オキサリルでの処理によって酸塩化物(RはCl)へ変換され得る。

【0 1 1 2】

或いは、標準条件下(上記式Dの化合物について発表したような)において、RがOH、Clまたは C_1 - C_4 アルコキシである式Eの化合物を、式 NHR_3R_4 のアミンとのアミド結合形成により式Gの化合物へ直接変換することも可能であるだろう。

【0 1 1 3】

或いは、 Z_2 が酸素である式Gの化合物は、 Z_2 が酸素であり、且つLGがフルオロ、クロロまたはスルホネート等の離脱基である式JKの化合物から、式 R_2NH_2 の化合物を有する離脱基の転移により作成することができる。かかる反応は、通常塩基性条件で実施される。かかる式JKの化合物は、RがClまたはOHであり、且つLGが上記の通りの離脱基である式Jの化合物から、上記標準条件下でアミド結合形態を通して、作製され得る。かかる式J及び式Eの化合物は、公知化合物であるか、公知方法により当業者により作製され得る化合物のいずれかである。

40

【0 1 1 4】

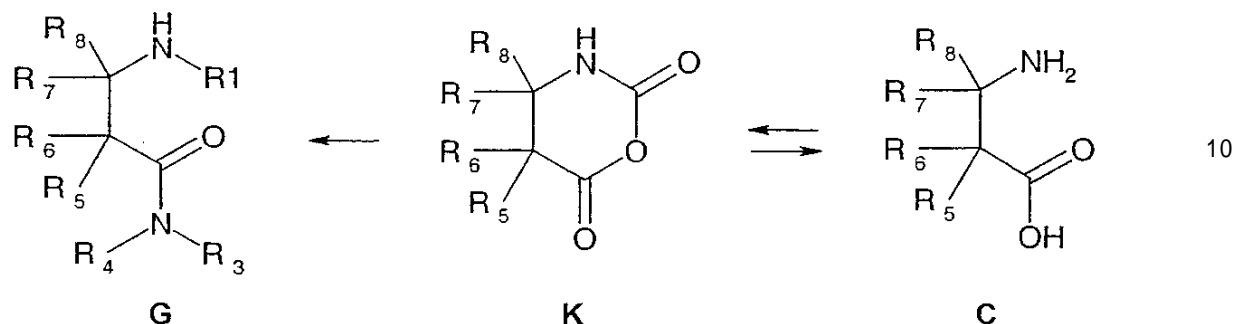
Z_1 が酸素であり、且つ Z_2 が硫黄である式A化合物は、 Z_2 が酸素であり、且つLGが離脱基である式JKの化合物、または Z_2 が酸素である式Gの化合物を、 Z_1 が酸素であり、且つ Z_2 が硫黄である式Aの化合物(上記の Z_1 が酸素であり、且つ Z_2 が酸素である式Aの化合物のよう

50

な)を合成する前に、Lawesson試薬または五硫化リン等のチオ-転移試薬での処理することにより作製され得る。

【0115】

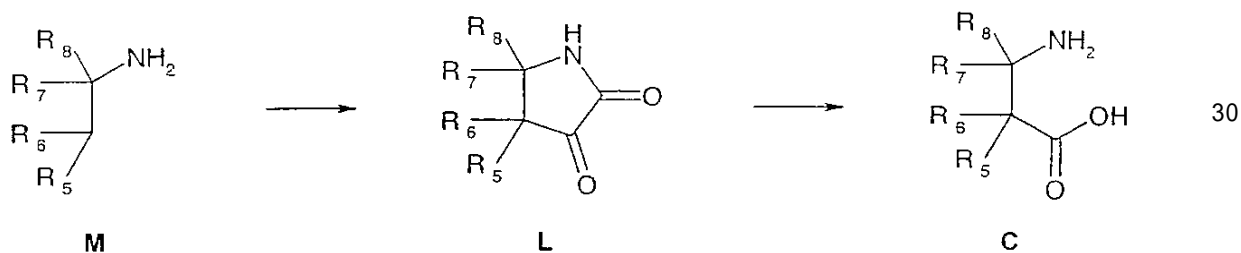
【化12】



式Cの化合物は公知であるか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。例えば式Cのアミノ酸は、式Kのイサト酸無水物の加水分解によって形成され得る。或いは、式Kのイサト酸無水物は、式 NHR_3R_4 のアミンと反応し、 R_1 が直接Hである、式Gの化合物を提供し得る。式Kのイサト酸無水物は公知化合物であるか、または当業者に明白な公知方法によって作製され得る(例えば作製される化合物は、ホスゲンまたはホスゲンの合成当価体(例えばカルボニルジイミダゾール)による式Cのアミノ酸の処理に由来する)。

【0116】

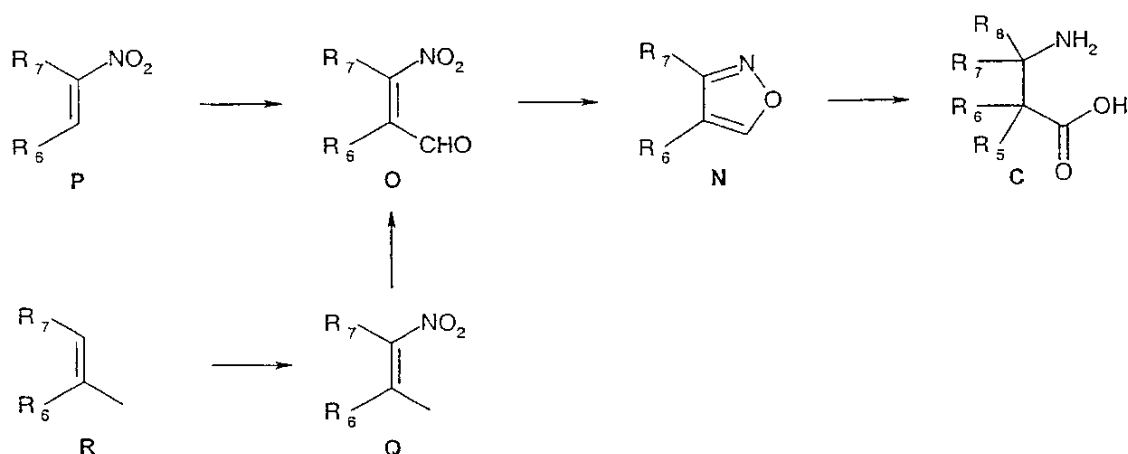
【化13】



或いは式Cの化合物は、塩基性条件下における過酸化水素による式Lのイサチンの処理から由来し得る。式Lのイサチンは、公知であるか、または当業者に公知な方法によって作製され得る(例えば R_5 と R_8 が一緒になって置換基 R_6 及び R_7 を担持している炭素原子間で一つの追加の結合を形成する式Mのアミノ化合物から、例えば塩化オキサリル(任意にLewis酸触媒の存在中)または多様な条件下における抱水クロラルとの処置によって派生し得る)。式Mのアミノ化合物は公知化合物であるか、または当業者に公知な方法によって作製され得る。

【0117】

【化14】



10

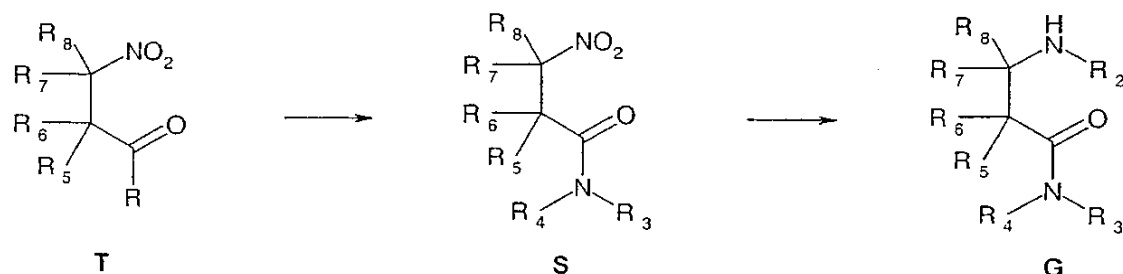
或いは、 R_5 及び R_8 が一緒になって、置換基 R_6 及び R_7 を担持している炭素結合間で追加の結合を形成する式Cの化合物は、水性塩基を有する式Nのイソオキサゾールの処理から派生し得る。式Nのイソオキサゾールは、酢酸中の亜鉛等の還元剤と処理することにより、式O
 のニトロアルデヒドから派生し得る。式Oのニトロアルデヒドは、公知のものであるか、
 または当業者に公知の方法によって作製され得、例えばそれらは塩基性条件下でのクロロホルムによる処理によって、引き続き水性強酸による処理によって、式Pのニトロ化合物
 から派生し得る。或いは、式Oのニトロアルデヒドは、式Qの1-ニトロ-2-メチル芳香族性
 化合物の酸化により派生し得る。かかる酸化を達成するための特に都合のよい方法は、化
 合物Qをジメチルホルムアミドジメチルアセタールと塩基性条件下で処理し、引き続き過
 ヨウ素酸ナトリウムと処理することを含む。式P及びQの化合物は、公知であるか、または
 当業者に公知の方法によって作製され得る。例えば式Qの化合物は、式Rの化合物からニ
 トロ化によって合成され得る(例えば硝酸及び硫酸の混合物による)。

20

【0118】

30

【化15】



40

R_2 が水素である式Gの化合物の代替的な合成は、式Sのニトロ化合物の還元によって達成
 され得る。酸性条件下でのスズまたは鉄による処理等の文献で報告されたかかる変換、ま
 たは炭素上でパラジウム等の貴金属により触媒される水素作用を達成するための多くの方
 法が存在する。式Sの化合物は、RがOH、Cl、または C_1 - C_4 アルコキシである式Tの化合物か
 ら、式 NHR_3R_4 のアミンによるアシル化を経由して、式Dの化合物に関して既に発表した標
 準条件下で派生し得る。同様にRが C_1 - C_4 アルコキシである式Tのエステルの、RがOHである
 式Tの酸への変換、RがClである式Tの酸塩化物への変換は、式Dの化合物に関して更に発表
 する。式Tの化合物は公知であるか、または当業者にとって公知の方法によって作製され

50

得る。

【0119】

いくつかの試薬及び反応条件は、所望される分子中で存在し得る所定の機能性に準拠しないと認識されるべきである。かかるケースでは、文献で報告され且つ当業者に周知の包括的に報告された標準的な保護/脱保護プロトコルを採用する必要があるだろう。

【0120】

更にいくつかのケースでは、所望される化合物の合成を完了させるために、本明細書で発表されていない更なる一般的な合成ステップを実行する必要があるだろう。当業者は所望される化合物の合成を、発表されたものと異なる順番でこれらの合成経路中のいくつかのステップを実行することによって達成することが可能であり得るということも認識する

10

【0121】

当業者は、更に標準的な官能基相互変換反応または置換反応を、本明細書で発表された化合物において実行し、既存置換基を導入し、または既存置換基で修飾することが可能であることを認識するであろう。

【0122】

反応物質は、好適には塩基の存在中で反応させることができる。適切な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アミド類、アルカリ金属 or アルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アセテート、アルカリ金属またはアルカリ土類金属カルボネート、アルカリ金属またはアルカリ土類金属ジアルキルアミドまたはアルカリ金属またはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミン、アルキレンジアミン、遊離またはN-アルキル化飽和または不飽和シクロアルキルアミン、塩基性ヘテロ環化合物、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。上記であり得るものの例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウム tert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウム ビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、ベンジルトリメチルアンモニウムヒドロキシド及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

20

30

【0123】

当該反応はおよそ-80 からおよそ+140 まで、好適にはおよそ-30 からおよそ+100 まで、多くの場合において室温からおよそ+80 までの範囲の温度で都合よく実施される。

【0124】

式B、Dの化合物及びZ2が硫黄である式Aの化合物(式AAの化合物)、及び適宜それらの互変異性体は、それぞれの場合において遊離形態または塩形態にあり、新規であり、そして本発明の対象でもある。

40

【0125】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法において調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、適宜酸または適宜イオン交換試薬による処理によって得られ、そして塩基を有す塩は、適宜塩基または適宜イオン交換試薬による処理によって得られる。

【0126】

式Iの化合物の塩は、慣用方法において、式Iの遊離化合物、酸付加塩へ、例えば適宜塩基性化合物または適宜イオン交換試薬による処理により変換され得、そして塩基を有す塩は、例えば適宜酸または適宜イオン交換試薬による処理によって変換され得る。

【0127】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法において、他の式Iの化合物の塩である酸付

50

加塩へ（例えば他の酸付加塩へ）、例えば適宜溶媒中で、ナトリウム、バリウムまたは銀等の適宜金属塩を有する塩酸塩等の無機酸の塩（例えば酢酸銀を有する酸との塩）を処理することによって変換され得、ここで例えば塩化銀を形成する無機塩は不溶性であるため、反応混合物から沈殿する。

【0128】

当該手順または反応条件により、塩形成特質を有する式Iの化合物は、遊離形態または塩形態で得ることができる。

【0129】

個々のケースにおいて遊離形態または塩形態にある式Iの化合物及び適宜それらの互変異性体は、分子中に発生する不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に依存して、及び/または分子中に発生する非-芳香族性二重結合の配置に依存して、可能性のある一つの異性体の形態、または例えば純粋な異性体の形態にあるそれらの混合物（対掌体及び/またはジアステレオマー等）、またはエナンチオマー混合物等の異性体混合物（例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物もしくはラセミ混合物）で存在することができ；本発明は、純粋な異性体及び更に可能性のある全ての異性体混合物にも関連し、そして個々のケースにおける立体化学的な詳説が特に述べられていない場合でも、本明細書の上記及び下記において、この意味で個々の場合について理解される。

【0130】

選定される出発原料及び手順によって得ることができる遊離形態または塩形態にある式Iのジアステレオマー混合物またはラセミ混合物は、公知の方法において、例えば分別晶出、蒸留及び/またはクロマトグラフィーによる成分の物理化学的差異に基づき、純粋なジアステレオマーまたはラセミ体に分割することができる。

【0131】

同様の方法において得ることができるラセミ化合物等のエナンチオマー混合物は、公知方法によって（例えば光学活性溶媒からの再結晶によって）、キラル吸着剤でのクロマトグラフィーによって（例えば、適宜微生物の補助を有す、アセチルセルロース上の高速液体クロマトグラフィー（HPLC））、含有化合物の形態を介す特異的、固定化酵素による開裂によって（例えば、一つのエナンチオマーのみを錯化する場合、キラルクラウンエーテルを使用する）、またはジアステレオマー塩への変換（例えば、塩基性の最終産物のラセミ化合物と、カルボン酸（例えばショウノウ酸、酒石酸またはリンゴ酸）、またはスルホン酸（例えばカンファースルホン酸）等の光学的に活性な酸との反応による）によって光学対掌体へ分割することができ、そして当該方法において得ることができるジアステレオマー混合物を、例えばそれらの異なる溶解性に基づく分別結晶によって分割して、ジアステレオマーを得る。ここでの所望されるエナンチオマーは、適宜試薬、例えば塩基性試薬の作用によって分割され得る。

【0132】

純粋なジアステレオマーまたはエナンチオマーは、適宜異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択性またはエナンチオ選択性合成の通常の公知方法によっても本発明に従い得ることができる（例えば適宜立体化学の出発原料によって本発明に係る方法を実施することによる）。

【0133】

それぞれの成分が異なる生物学的活性を有するならば、個々のケースにおいて、生物学的により有効な異性体、例えばエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または異性体混合物、例えばエナンチオマー混合物またはジアステレオマー混合物を単離または合成することは都合がよい。

【0134】

個々のケースにおいて遊離形態または塩形態にある式Iの化合物、及び適宜それらの互変異性体は、適宜水和物の形態で得ることもでき、及び/または、例えば固形で存在する化合物の結晶に使用され得る他の溶媒を含むことができる。

【0135】

10

20

30

40

50

本発明は、出発原料または中間体として当該方法の任意のレベルで得ることができる化合物から出発して、全部またはいくつかを欠くステップが実行され、或いは出発原料は、誘導体及び/または塩及び/またはラセミ化合物またはそれらの対掌体の形態で使用され、或いは出発原料は特に反応条件下で形成されるようなものであるような、方法のそれらの全態様に関する。

【0136】

特に有用であると発表された式Iの化合物またはそれらの塩化合物を導く、個々の場合において遊離形態または塩形態にあるそれらの出発原料及び中間体は、好適には本発明の方法において使用される。

【0137】

特に、当該発明は実施例P1からP11に発表された調製方法に関する。

【0138】

個々の場合において遊離形態または塩形態にある出発原料及び中間体は、式Iの化合物またはそれらの塩の調製のために本発明に従って使用され、そしてそれらは新規であり、それらの調製方法、及び式Iの化合物の調製のための出発原料及び中間体としてのそれらの使用は、本発明の対象でもあり；特に式II、IV及びVの化合物に適用される。

【0139】

本発明に係る式Iの化合物は、害虫制御の分野における、予防的及び/または治療的に価値のある活性成分であり、適用率がたとえ低くても非常に好ましい殺菌スペクトルを有し、そして温血種、魚及び植物に非常に耐性である。本発明に係る活性成分は正常の感受性の全て、または個々の発達段階に対して作用するが、更に昆虫またはダニ目等に代表される動物の疫病に抵抗性である。本発明に係る活性成分の殺虫または殺ダニの活性は、それ自体直接明示することができ（即ち、迅速またはほんの短時間経過後（例えば脱皮中）に起こる害虫の破滅において）、或いは、例えば減少した産卵及び/または孵化率において、少なくとも50～60%の破滅率（死亡率）に相等する良好な活性を間接的に明示することができる。

【0140】

上記動物の害虫の例は：

ダニ目からは、例えば、

アカラス シロ (*Acarus siro*)、アセリア シェルドーニ (*Aceria sheldoni*)、アキュラス シュレクテンダリ (*Aculus schlechtendali*)、アムブリオーマ (*Amblyomma*) spp.、アーガス (*Argas*) spp.、ブレビパルパス (*Brevipalpus*) spp.、ブリオビア プラエチオーサ (*Bryobia praetiosa*)、キャリピトリメラス (*Calipitrimerus*) spp.、コリオプテス (*Chorioptes*) spp.、ダーマニッサス ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、エオテトラニチュス カーピニ (*Eotetranychus carpini*)、エリオフィエス (*Eriophyes*) spp.、ヒアローマ (*Hyalomma*) spp.、イクソデス (*Ixodes*) spp.、オリゴニカス パラテンシス (*Olygonychus pratensis*)、オルニソドロス (*Ornithodoros*) spp.、パノニチュス (*Panonychus*) spp.、フィロコプトルタ オレイボーラ (*Phyllocoptura oleivora*)、ポリファーゴターソネムス ラータス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス (*Psoroptes*) spp.、リピセファラス (*Rhipicephalus*) spp.、リゾグリファス (*Rhizoglyphus*) spp.、サーコプテス (*Sarcoptes*) spp.、ターソネムス (*Tarsonemus*) spp. 及びテトラニチュス (*Tetranychus*) spp.；

シラミ目からは、例えば、

ハエマトピナス (*Haematopinus*) spp.、リノグナサス (*Linognathus*) spp.、ペジキュラス (*Pediculus*) spp.、ペムフィガス (*Pemphigus*) spp. 及びフィロキセラ (*Phylloxera*) spp.；

甲虫目からは、例えば、

アグリオテス (*Agriotes*) spp.、アンソノーマス (*Anthonomus*) spp.、アトマリア リネアリス (*Atomaria linearis*)、シャエトクネーマ チピアリス (*Chaetocnematibialis*)、コスモボライテス (*Cosmopolites*) spp.、キューキュリオ (*Curculio*) spp.、ダーメス

10

20

30

40

50

テス (*Dermestes*) spp.、ジアブロチカ (*Diabrotica*) spp.、(*Epilachna*) spp.、エレムナス (*Eremnus*) spp.、レプチノターサ デケムリネエータ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソロプトラス (*Lissorhoptrus*) spp.、メロロンタ (*Melolontha*) spp.、オリカエフィラス (*Orycaephilus*) spp.、オチオリンチュス (*Otiorhynchus*) spp.、フリクチヌス (*Phlyctinus*) spp.、ポピリア (*Popillia*) spp.、ブシリオデス (*Psylliodes*) spp.、リゾベルタ (*Rhizopertha*) spp.、スカラベイダエ (*Scarabeidae*)、シトフィラス (*Sitophilus*) spp.、シトトロガ (*Sitotroga*) spp.、テネブリオ (*Tenebrio*) spp.、トリボリウム (*Tribolium*) spp. 及びトロゴダーマ (*Trogoderma*) spp. ;

双翅目からは、例えば、

アエデス (*Aedes*) spp.、アンセリゴーナ ソッカータ (*Antherigona soccata*)、ビビオ
 ホーチュラニス (*Bibio hortulanus*)、キャリホラ エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス (*Ceratitis*) spp.、オビキンバエ (*Chrysomyia*) spp.、キューレックス (*Culex*) spp.、キューテレブラ (*Cuterebra*) spp.、ダーカス (*Dacus*) spp.、ドロソフィラ メラノガスター (*Drosophila melanogaster*)、ファニア (*Fannia*) spp.、ガストロフィラス (*Gastrophilus*) spp.、グロッシーナ (*Glossina*) spp.、ハイポデルマ (*Hypoderma*) spp.、ヒッポボスカ (*Hyppobosca*) spp.、リリオミザ (*Liriomyza*) spp.、ルシリア (*Lucilia*) spp.、メラナグロマイザ (*Melanagromyza*) spp.、ムスカ (*Musca*) spp.、オエストラス (*Oestrus*) spp.、オーセオリア (*Orseolia*) spp.、オスシネラ
 フリット (*Oscinella frit*)、ペゴミヤ ヒオスシアーミ (*Pegomyia hyoscyami*)、フォルビア (*Phorbia*) spp.、ラゴレチス ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、(*Sciara*) spp.、ストモキシス (*Stomoxys*) spp.、タバヌス (*Tabanus*) spp.、タニア (*Tannia*) spp. 及びチブラ (*Tipula*) spp. ;

異翅目からは、例えば、

シメックス (*Cimex*) spp.、ジスタンチエラ セオブローマ (*Distantiella theobroma*)、ジスダーカス (*Dysdercus*) spp.、ユーチスタス (*Euchistus*) spp.、ユーリガスター (*Eurygaster*) spp.、レプトコリサ (*Leptocorisa*) spp.、ネザラ (*Nezara*) spp.、ピエスマ (*Piesma*) spp.、ロドニウス (*Rhodnius*) spp.、サールバーゲラ シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スコチノファーラ (*Scotinophara*) spp. 及びトリアトーマ (*Triatoma*) spp. ;

同翅目からは、例えば、

アロイロスリクス フロコッサス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイローデス ブラシカ (*Aleyrodes brassicae*)、アオニジエラ (*Aonidiella*) spp.、アフィジダエ (*Aphididae*)、アフィス (*Aphis*) spp.、アスピジオタス (*Aspidiotus*) spp.、ベミシア タバシ (*Bemisia tabaci*)、セロプラスター (*Ceroplaster*) spp.、クリソムファラス アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、クリソムファラス ディクチオスパーミ (*Chrysomphalus dictyospermi*)、コッカス ヘスベリダム (*Coccus hesperidum*)、エムポアスカ (*Empoasca*) spp.、エリオソーマ ラニゲルム (*Eriosoma larigerum*)、(*Erythroneura*) spp.、ガスカルディア (*Gascardia*) spp.、ラオデルファクス (*Laodelphax*) spp.、レカニウム (*Lecanium corni*)、レピドサフエス (*Lepidosaphes*) spp.、マクロシフス (*Macrosiphus*) spp.、マイザス (*Myzus*) spp.、ネフォテティックス (*Nephotettix*) spp.、ニラパーバータ (*Nilaparvata*) spp.、パラトリア (*Paratoria*) spp.、ペムフィガス (*Pemphigus*) spp.、プラノコッカス (*Planococcus*) spp.、プソイダウラキャプシス (*Pseudaulacaspis*) spp.、シュードコッカス (*Pseudococcus*) spp.、ブシラ (*Psylla*) spp.、プルピナリア エティオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラスピジオタス (*Quadraspidotus*) spp.、ロパロジヒューム (*Rhopalosiphum*) spp.、サイッセチア (*Saissetia*) spp.、スカフォイデウス (*Scaphoideus*) spp.、スキザフィス (*Schizaphis*) spp.、シトピオン (*Sitobion*) spp.、トリアロイローデス パーポラリオラム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオーザ エリトレアエ (*Trioza erytreae*) 及びウナスピス シトリ (*Unaspis citri*) ;

膜翅目からは、例えば、

10

20

30

40

50

アクロミルメックス (*Acromyrmex*)、アッタ (*Atta*) spp.、セファス (*Cephus*) spp.、ジ
 プリオン (*Diprion*) spp.、ジプリオニダエ (*Diprionidae*)、ジルピニア ポリトーマ (*Gilpinia polytoma*)、
 ホプロキャンパ (*Hoplocampa*) spp.、(*Lasius*) spp.、モノモリ
 ウム ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリオン (*Neodiprion*) spp.、ソ
 レノプシス (*Solenopsis*) spp. 及びベスパ (*Vespa*) spp. ;

等翅目からは、例えば、

レチカリテルメス (*Reticulitermes*) spp. ;

鱗翅目からは、例えば、

アクレリス (*Accleris*) spp.、アドキソフィエス (*Adoxophyes*) spp.、アエゲリア (*Aeger*

ia) spp.、アグロチス (*Agrotis*) spp.、アラバマ アーギラセア (*Alabama argillaceae*)

、アミロイス (*Amylois*) spp.、アンチカルシア ジェムマタリス (*Anticarsia gemmat*

alis)、アーチップス (*Archips*) spp.、アージロタエニア (*Argyrotaenia*) spp.、オー

トグラファ (*Autographa*) spp.、ブッセオーラ フスカ (*Busseola fusca*)、キャドラ

コーテラ (*Cadra cautella*)、カーボジナ ニッポンネンシス (*Carposina nipponensis*

)、チロ (*Chilo*) spp.、コリストノイラ (*Choristoneura*) spp.、クリシア アンビグエ

ラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロクロシス (*Cnaphalocrocis*) spp.、クネファシア

(*Cnephasia*) spp.、コキリス (*Cochylis*) spp.、コレオフォラ (*Coleophora*) spp.、ク

ロシドロミア ビノタリス (*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア ロイコトレ

ータ (*Cryptophlebia leucotreta*)、サイディア (*Cydia*) spp.、ジアトラエ (*Diatraea*

) spp.、ジパロプシス カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス (*Earias*) spp

、エフェスチア (*Ephestia*) spp.、ユーコズマ (*Eucosma*) spp.、ユーポエシリア アン

ビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクティス (*Euproctis*) spp.、ユーキソア

(*Euxoa*) spp.、グラフォリタ (*Grapholita*) spp.、ヘジャ ヌビフェラナ (*Hedya nubif*

erana)、ヘリオジス (*Heliothis*) spp.、ヘルラ ウンダリス (*Hellula undalis*)、ハ

イファントリア キュネア (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア リコパーシセラ (*Keif*

eria lycopersicella)、ロイコプテラ サイトラ (*Leucoptera scitella*)、リソコレテ

イス (*Lithocollethis*) spp.、ロベシア ボトラーナ (*Lobesia botrana*)、リマントリ

ア (*Lymantria*) spp.、リオネティア (*Lyonetia*) spp.、マラコソマ (*Malacosoma*) spp.

、マメストラ ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、マンジュカ セクスタ (*Manduca se*

xta)、オペロフテラ (*Operophtera*) spp.、オストリニア ヌビラリス (*Ostrinia nubil*

alis)、パメネ (*Pammene*) spp.、パндеミス (*Pandemis*) spp.、パノリス フラメア (*P*

anolis flammea)、ペクチノフォラ ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、フト

リマエア オーパーキュレラ (*Phthorimaea operculella*)、ピエリス ラーパエ (*Pieri*

s rapae)、ピエリス (*Pieris*) spp.、プルテラ キシロステラ (*Plutella xylostella*)

、プレイス (*Prays*) spp.、スキルポファーガ (*Scirpophaga*) spp.、セサミア (*Sesamia*

) spp.、スパーガノジス (*Sparganothis*) spp.、スポドプテラ (*Spodoptera*) spp.、シナ

ンセドン (*Synanthedon*) spp.、タウメトポエ (*Thaumetopoea*) spp.、トートリックス (*T*

ortrix) spp.、トリコプルシア ニー (*Trichoplusia ni*) 及びイボノモイタ (*Yponomeut*

a) spp. ;

食毛目からは、例えば、

ダマリネア (*Damalinea*) spp. 及びトリコデクテス (*Trichodectes*) spp. ;

直翅目からは、例えば、

ブラッタ (*Blatta*) spp.、ブラテラ (*Blattella*) spp.、グリロタルパ (*Gryllotalpa*) sp

p.、ロイコファエア マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロカスタ (*Locusta*) spp.、ペ

リプラネタ (*Periplaneta*) spp. 及びスキストサーカ (*Schistocerca*) spp. ;

チャタテムシ目からは、例えば、

リボセリス (*Liposcelis*) spp. ;

ノミ目からは、例えば、

セラトフィラス (*Ceratophyllus*) spp.、クテノセファリデス (*Ctenocephalides*) spp. 及

びキセノプシラ ケオプシス (*Xenopsylla cheopis*) ;

10

20

30

40

50

総翅目からは、例えば、

フランクリニエラ (*Frankliniella*) spp.、ヘルシノスリップス (*Hercinothrips*) spp.、スキルトスリップス アウランチ (*Scirtothrips aurantii*)、タエニオスリップス (*Taeniothrips*) spp.、スリップス パルミ (*Thrips palmi*) 及びスリップス タバシ (*Thrips tabaci*) ;

並びにシミ目からは、例えば、

レピスマ サッカリーナ (*Lepisma saccharina*)、である。

【 0 1 4 1 】

本発明に係る活性成分は、上記タイプの害虫、詳細には植物に発生する、特に農業、園芸及び林業における有用植物及び観葉植物、或いはかかる植物の果実、花、葉、茎、塊茎または根等の器官に発生する害虫を制御する、即ち、抑制または破壊するために使用することができ、そしていくつかのケースにおいては、これらの害虫に対して保護されてから時間が経過した時点で形成される植物でさえ使用することができる。

10

【 0 1 4 2 】

適切な標的農作物には特に以下が含まれる。穀類 (例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシおよびソルガム) ; ビート (例えば、テンサイおよび飼料用ビート) ; 果実、例えば、ナシ状果、石果、または小果樹の実 (例えば、リンゴ、西洋ナシ、プラム、ピーチ、アーモンド、チェリー、およびベリー (例えば、イチゴ、ラズベリーおよびブラックベリー)) ; 豆植物 (例えば、マメ、レンズマメ、エンドウマメ、またはダイズ) ; 油脂植物 (ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、トウゴマ、ココアまたはラッカセイ) ; ウリ類 (例えば、カボチャ、キュウリ、およびメロン) ; 繊維植物 (例えば、綿花、アマ、アサ、およびジュート) ; 柑橘類果実 (例えば、オレンジ、レモン、グレープフルーツ、またはタンジェリン) ; 野菜 (例えば、ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ポテト、またはパプリカ) ; クスノキ科 (例えば、アボカド、シナモン、またはカンファー)、ならびにタバコ、ナッツ、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、バナナ、天然のゴムの木、および観賞植物。

20

【 0 1 4 3 】

本発明に係る活性成分は、特に、綿花、野菜、トウモロコシ、イネ及び大豆作物中の *Aphis craccivora*、*Diabrotica balteata*、*Heliothis virescens*、*Myzus persicae*、*Plutella maculipennis* 及び *Spodoptera littoralis* を制御するために適している。

30

【 0 1 4 4 】

用語 "農作物" とは、慣用の育種方法または遺伝子操作方法の結果として、プロモキシニルのような除草剤または多くの分類の除草剤 (例えば、HPPD阻害剤、ALS阻害剤、例えばグリメスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、EPSPS(5-エノール-ピロビル-シキメート-3-ホスフェート-シンターゼ) 阻害剤、GS(グルタミンシンターゼ) 阻害剤等) に対して耐性を示してきた農作物も含むと理解される。慣用方法である育種(突然変異)によってイミダゾリノン系、例えばイマザモックスに対して耐性を示してきた農作物の例は、Clearfield(商標) summer rape (Canola) である。遺伝子操作方法によって除草剤または多くの分類の除草剤に対して耐性を示してきた農作物の例は、スリホサート耐性及びグルホシネート耐性トウモロコシ変種を含み、RoundupReady(商標)、Herculex I(商標) 及びLibertyLink(商標) の商品名で商業的に入手可能である。

40

【 0 1 4 5 】

用語 "農作物" は、組換えDNA技術 (毒素生産バクテリア、特にバチルス属のものから由来する、1つ以上の選択的に作用する毒素を合成することを可能にする公知技術等) を用いることによって形質転換した農作物植物も含むと理解される。

【 0 1 4 6 】

かかるトランスジェニック植物によって発現させることができる毒素は、例えば、殺虫タンパク質、例えばバチルス・セレウス、または *Bacillus popilliae* 由来の殺虫タンパク質 ; 或いは - 内毒素 (例えばCry I A(b)、Cry I A(c)、Cry I F、Cry I F(a2)、Cry I I A(b)、Cry

50

III A, CryIII B(b1)もしくはCry9c)、または植物性の殺虫タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3もしくはVIP3A)等のパチルス・チューリングシス由来の殺虫タンパク質;或いはバクテリアコロニー形成線虫(例えば光棒状体発光、異種棒状体nematophilus等のPhotorhabdus spp.またはXenorhabdus spp.)の殺虫タンパク質;サソリ毒素、クモ類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫特異的神経毒素等の動物により産生される毒素;放線菌毒素等の真菌、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはスノードロップレクチン等の植物レクチンによって産生される毒素;凝集素;トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテイナーゼ阻害剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン(luffin)、サボリンまたはブリオジン(bryodin)等のリボース不活性化タンパク質(RIP);3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼ、イオンチャネルブロッカー(ナトリウムまたはカルシウムチャネルブロッカー等)、幼弱ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼ等のステロイド代謝酵素を含む。

【0147】

本発明の明細書では、 α -内毒素(例えばCryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIII A, CryIII B(b1)もしくはCry9c)、または植物性の殺虫タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3もしくはVIP3A)、特にハイブリッド毒素、トランケート毒素及び修飾毒素によるものと理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新規の組合せによる組換え技術によって産生される(例えばWO02/15701を参照)。修飾毒素の場合は、1つ以上の天然毒素のアミノ酸が置換される。かかるアミノ酸置換では、好適には非天然に存在するプロテアーゼ認識配列は、毒素中に挿入される。例えば、CryIII A055の場合は、カテプシン-D-認識配列がCryIII A毒素に挿入される(WO03/018810参照)。

【0148】

かかる毒素またはかかる毒素を合成することができるトランスジェニック植物の例は、例えば、EP-A-0374753、WO93/07278、WO95/34656、EP-A-0427529、EP-A-451878及びWO 03/052073に発表されている。

【0149】

かかるトランスジェニック植物の調製方法は、一般的に当業者に公知であり、そして例えば、上記刊行物に発表されている。CryI-タイプのデオキシリボ核酸及びそれらの調製物は、例えば、WO95/34656、EP-A-0367474、EP-A-0401979及びWO 90/13651によって公知となっている。

【0150】

かかるトランスジェニック植物中に含有される毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。かかる虫は任意の虫の分類群において発生し得るが、特に鞘翅目(甲虫類)、双翅目の昆虫(双翅目:Diptera)及びチョウ(鱗翅目)において通常見出される。

【0151】

殺虫剤の抵抗性をコードする1つ以上の遺伝子を含み、且つ1つ以上の毒性を発現するトランスジェニック植物は公知であり、そしてそれらのうちのいくつかは、商業的に入手できる。かかる植物の例は:YieldGard(商標)(CryIA(b)毒素を発現するトウモロコシ変種);YieldGardRootworm(商標)(CryIII B(b1)毒素を発現するトウモロコシ変種);YieldGard Plus(商標)(CryIA(b)及びCryIII B(b1)毒素を発現するトウモロコシ変種);Starlink(商標)(Cry9(c)毒素を発現するトウモロコシ変種);Herculex I(商標)(CryIF(a2)毒素及び酵素ホスフィノスリシン(phosphinothricine)N-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現し、除草剤アンモニウムグルフォシネートに対する耐性を達成するトウモロコシ変種);NuCOTN33B(商標)(CryIA(c)毒素を発現する綿花変種);BoliGard I(商標)(綿花変種CryIA(c)毒素を発現する綿花変種);BoliGardII(商標)(CryIA(c)及びCryIIA(b)毒素を発現する綿花変種);VIPCOT(商標)(VIP毒素を発現する綿花変種);NewLeaf(

商標) (CryIII A毒素を発現するポテト変種) ; NatureGard(商標) 及びProtecta(商標) である。

【 0 1 5 2 】

かかるトランスジェニック農作物の更なる例 :

【 0 1 5 3 】

1 . Bt11 トウモロコシ (Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, 仏, 登録番号C/FR/96/05/10) 。遺伝子修飾したズイー・メイスは、アワノメイガ (European corn borer : *Ostrinia nubilalis* 及び *Sesamia nonagrioides*) による攻撃に対して、トランケートCry I A(b) 毒素のトランスジェニック発現によって抵抗性を与えられた。Bt11 トウモロコシは、更に酵素PATをトランスジェニック的に発現し、除草剤アンモニウムグルフォシネートに対する耐性を達成する。

10

【 0 1 5 4 】

2 . Bt176 トウモロコシ (Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, 仏, 登録番号C/FR/96/05/10) 。遺伝子修飾したズイー・メイスは、アワノメイガ (European corn borer : *Ostrinia nubilalis* 及び *Sesamia nonagrioides*) による攻撃に対して、Cry I A(b) 毒素のトランスジェニック発現によって抵抗性を与えられた。

【 0 1 5 5 】

3 . MIR604 トウモロコシ (Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, 仏, 登録番号C/FR/96/05/10) 。トウモロコシは、修飾されたCryIII A毒素のトランスジェニック発現により挿入抵抗性を示した。当該毒素は、カテプシン-D-プロテアーゼ認識配列の挿入により修飾されたCry3A055である。かかるトランスジェニックトウモロコシ植物の調製はWO 03/018810に発表されている。

20

【 0 1 5 6 】

4 . MON 863 トウモロコシ (Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, ベルギー, 登録番号C/DE/02/9) 。MON 863はCryIII B(b1) 毒素を発現し、且つ所定の甲虫類の昆虫に抵抗性を有す。

【 0 1 5 7 】

5 . IPC531 綿花 (Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, ベルギー, 登録番号C/ES/96/02) 。

【 0 1 5 8 】

6 . 1507 トウモロコシ (Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, ベルギー, 登録番号C/NU00/10) 。所定の鱗翅目昆虫に対する抵抗性を達成するタンパク質Cry I F、及び除草剤アンモニウムグルフォシネートに対する耐性を達成するPATタンパク質を発現する遺伝子修飾したトウモロコシ。

30

【 0 1 5 9 】

7 . NK603 × MON 810 トウモロコシ (Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, ベルギー, 登録番号C/GB/02/M3/03) 。遺伝子修飾した変種NK603 及びMON 810を交配させることにより慣用的に育種したハイブリッドトウモロコシ変種から成る。NK603 × MON 810 トウモロコシは、トランスジェニック的にグリホサートを含む除草剤Roundup(商標) に対する耐性を与えるアグロバクテリウム (*Agrobacterium*) sp. 株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS、及び更に *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* から得られるCry I A(b) 毒素を発現し、アワノメイガを含む所定の鱗翅目に対する耐性をもたらす。

40

【 0 1 6 0 】

虫抵抗性植物であるトランスジェニック農作物は、BATS(Zentrum fur Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, スイス) レポート2003, (<http://bats.ch>) にも発表されている。

【 0 1 6 1 】

用語"農作物"とは組換え例えば、いわゆる"病原性関連タンパク質"(PRP、例えばEP-A-0392225を参照) のような選択的作用を有す抗病原性物質を合成することを可能にする、組

50

換えDNA技術の使用によって形質転換された農作物植物も含むと理解される。かかる抗病原性物質及びかかる抗病原性物質を合成することができるトランスジェニック植物の例は、例えばEP-A-0392225、W095/33818、及びEP-A-0353191により公知である。かかるトランスジェニック植物を産生するための方法は、一般的に当業者に公知であり、そして例えば上記刊行物中に発表されている。

【0162】

かかるトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質は、例えば、イオンチャンネルブロッカー（ナトリウム及びカルシウムチャンネルブロッカー等であり、例えばウィルス性KP1、KP4またはKP6毒素）；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる"病原性関連タンパク質"(PRP；例えばEP-A-0392225参照)；微生物により産生される抗病原性物質（例えばペプチド抗生物質またはヘテロ環式抗生物質(例えばW095/33818参照)または植物病原菌防御に関与するタンパク質もしくはポリペプチド因子(W003/000906に発表されたようないわゆる"植物疾患抵抗性遺伝子")）を含む。

10

【0163】

本発明に係る活性成分の他の応用分野は、上記タイプの害虫に対する貯蔵製品及び在庫品の保護、並びに木材、布地、床または建物の仕上げ剤等の材料保護、及び衛生領域、特にヒト、家畜及び多産の家畜の保護である。

【0164】

従って本発明は、例えば、乳化可能な濃縮物、懸濁濃縮物、直接的にスプレー可能であるか、もしくは希釈可能である溶液、広げることができるペースト、希釈乳化物、湿潤性粉末、分散可能な粉末、湿潤性粉末、ダスト、顆粒、またはポリマー物質中でカプセルされた等の殺虫組成物に関し、少なくとも1つの本発明にかかる活性成分を含み、そしてそれらは意図した目的及び一般的な環境に適合するように選定される。

20

【0165】

活性成分は、純粋な型の、固体の活性成分におけるこれらの組成物中で、例えば、特定の粒子サイズにおいて、または好ましくは、製剤技術において慣用的である少なくとも1種の補助剤、例えば、増量剤、例えば、溶媒もしくは固体キャリア、または界面活性化合物（界面活性剤）と一緒に使用される。

【0166】

適切な溶媒の例は、水素化化されていないか、または部分的に水素化された芳香族性炭化水素、好ましくは、 $C_8 \sim C_{12}$ のアルキルベンゼン、例えば、キシレン混合物、アルキル化ナフタレンまたはテトラヒドロナフタレン、脂肪族または環状脂肪族炭化水素、例えば、パラフィンまたはシクロヘキサン、アルコール、例えば、エタノール、プロパノール、またはブタノール、グリコールおよびそれらのエーテルおよびエステル、例えば、プロピレングリコール、ジプロピレングリコールエーテル、エチレングリコール、またはエチレングリコールモノメチルエーテルもしくはエチレングリコールモノエチルエーテル、ケトン、例えば、シクロヘキサノン、イソフォロン、またはジアセトンアルコール、強力な極性溶媒、例えば、N-メチルピロリド-2-オン、ジメチルスルホキシド、またはN,N-ジメチルホルムアミド、水、エポキシド化されていないかまたはエポキシド化されている植物油、例えば、エポキシド化されていないかまたはエポキシド化されているナタネ油、ヒマシ油、ココナッツ油、またはダイズ油、およびシリコンオイル。

30

40

【0167】

例えば、ダストおよび分散可能な粉末のために使用される固体キャリアは、概して、セライト、タルク、カオリン、モンモリロナイト、またはアタパルガイトなどの天然の岩石粉末である。高度に分散性のケイ酸または高度に分散性の吸着ポリマーもまた、物理的特性を改善するために加えられ得る。顆粒状の吸着キャリアは、多孔性型、例えば、軽石、破碎レンガ、海泡石、またはベントナイトであり、および非吸着性物質は、方解石または砂である。無機または有機の性質の多数の顆粒状材料、特にドロマイトまたは粉碎植物残渣が、さらに使用され得る。

50

【 0 1 6 8 】

界面活性化合物は、製剤化される活性化合物の性質に依存して、良好な乳化、分散、および湿潤特性を有する、非イオン性、カチオン性、および／またはアニオン性の界面活性剤、または界面活性剤混合物である。以下に列挙される界面活性剤は、単に例示と見なされる；製剤業界において慣用的であり、かつ本発明に従って適切である多くの他の界面活性剤が、関連する文献に記載されている。

【 0 1 6 9 】

非イオン性界面活性剤は、特に、約 3 ～ 約 3 0 個のグリコールエーテル基および（シクロ）脂肪族炭化水素ラジカル中約 8 ～ 約 2 0 個の炭素原子またはアルキルフェノールのアルキル基中の約 6 ～ 約 1 8 炭素原子を含み得る、脂肪族性またはシクロ環状アルコール、飽和または不飽和脂肪酸、およびアルキルフェノールのポリグリコールエーテル誘導体である。さらに適切な物質は、水溶性ポリエチレンオキサイド付加物であり、これは、アルキル鎖中に 1 ～ 約 1 0 個の炭素原子を有するプロピレングリコール、エチレンジアミノポリプロピレングリコール、またはアルキルポリプロピレングリコール上に、約 2 0 ～ 約 2 5 0 個のエチレングリコールエーテル基および約 1 0 ～ 約 1 0 0 個のプロピレングリコールエーテル基を含む。この言及した化合物は、通常、プロピレングリコール単位あたり、1 ～ 約 5 個のエチレングリコール単位を含む。例としては、ノニルフェノキシポリエトキシエタノール、ヒマシ油ポリグリコールエーテル、ポリプロピレングリコール／ポリエチレンオキサイド付加物、トリブチルフェノキシポリエトキシエタノール、ポリエチレングリコールまたはオクチルフェノキシポリエトキシエタノールである。他の物質は、ポリオキシエチレンソルビタンの脂肪酸エステル、例えば、ポリオキシエチレンソルビタントリオレートである。

【 0 1 7 0 】

カチオン性界面活性剤は、特に、約 8 ～ 約 2 2 個の C 原子を有する少なくとも 1 つのアルキルラジカルを置換基として含み、かつさらなる置換基として、（非ハロゲン化またはハロゲン化された）低級アルキルまたはヒドロキシアルキルまたはベンジルラジカルを一般的に含む、四級アンモニウム塩である。この塩は好適には、ハライド、メチル - サルフェート、またはエチル - サルフェートの型である。例としては、ステアリル - トリメチル - アンモニウムクロライドおよびベンジル - ビス - （ 2 - クロロエチル ） - エチル - アンモニウムブロマイドである。

【 0 1 7 1 】

適切なアニオン性界面活性剤の例は、水溶性石鹼または水溶性合成界面活性化合物である。適切な石鹼の例は、約 1 0 ～ 約 2 2 個の炭素原子を有する高級脂肪酸のアルカリ金属、アルカリ土類金属、または（置換または非置換の）アンモニウム塩であり、例えば、オレイン酸またはステアリン酸のナトリウム塩またはカリウム塩、あるいは例えば、ココナッツオイルまたはトール油から得られ得る天然に存在する脂肪酸混合物のナトリウム塩またはカリウム塩；さらにまた、脂肪酸メチル - タウリン塩から作られるものである。しかし、合成界面活性剤、特に、脂肪スルホネート、脂肪サルフェート、スルホン化ベンズイミダゾール誘導体、またはアルキルアリールスルホネートがより頻繁に使用される。脂肪スルホネートおよび脂肪サルフェートは、概して、アルカリ金属、アルカリ土類金属、または（置換または非置換の）アンモニウム塩として存在し、且つそれらは一般的に、約 8 ～ 約 2 2 個の C 原子のアルキルラジカルを有し、アルキルはまた、アシルラジカルのアルキル部分を含みと理解され；例としては、リグニンスルホン酸、ドデシル硫酸エステル、または天然に存在する脂肪酸から調製された脂肪アルコール硫酸混合物の、ナトリウム塩またはカルシウム塩であってよい。これらはまた、脂肪アルコール／エチレンオキサイド付加物の硫酸エステル及びスルホン酸の塩を含む。スルホン化ベンズイミダゾール誘導体は、好ましくは、2 個のスルホニル基および約 8 ～ 約 2 2 個の炭素原子を有する脂肪酸ラジカルを含む。アルキルアリールスルホン酸は、例えば、デシルベンゼンスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、またはナフタレンスルホン酸／ホルムアルデヒド縮合生成物の、ナトリウム塩、カルシウム塩、またはトリエタノールアンモニウム塩である。更に

適切なリン酸塩、例えば、p - ノニルフェノール / (4 - 1 4) エチレンオキサイド付加物またはリン脂質の、リン酸エステルの塩も使用され得る。

【 0 1 7 2 】

本発明の組成物は、概して、0 . 0 0 0 1 ~ 9 9 . 9 9 9 9 %、特に0 . 1 ~ 9 5 %の活性化化合物、および0 . 0 0 0 1 ~ 9 9 . 9 9 9 9 %、特に5 ~ 9 9 . 9 %の少なくとも1種の固体または液体の補助剤を含み、これは、概して、界面活性剤が、組成物の0 ~ 25 %、特に0 . 1 ~ 2 0 %であることが可能である(%は各々の場合において重量パーセントである)。濃縮組成物は、市販の製品としてより好ましいが、エンドユーザは、概して、顕著により低濃度の活性化化合物を含む希釈組成物を使用する。

【 0 1 7 3 】

本発明の活性組成物は、他の殺虫剂的に、または農薬的に活性な成分を付加することにより、大幅に広げることができ、且つ一般的な環境に適用させることができる。ここでの適切な活性成分への付加物は、例えば以下の分類の代表的な活性成分である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼弱ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシルウレア、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びパチルス・チューリンゲンシス調製物。

【 0 1 7 4 】

特に適切な混合パートナーの例は、以下の群Mから選定される化合物を含む：

【 0 1 7 5 】

群M：特に適切な式 I の化合物の混合パートナーは以下である：

アザメシフォス；クロルフェンビンフォス；シベルメスリン、シベルメスリン高 - シス；シロマジン；ジアフェンチウロン；ジアジノン；ジクロルボス；ジクロトフォス；ジシクラニル；フェノキシカルブ；フルアズロン；フラチオカルブ；イサゾフォス；イオドフェンフォス；キノプレン；ルフェヌロン；メタクリフォス；メチダチオン；モノクロトフォス；ホスファミドン；プロフェノフォス；ジオフェノラン；パチルス・チューリンゲンシス株 G C 9 1 から、または株 N C T C 1 1 8 2 1 から入手可能な化合物；ピメトロジン；プロモプロピレート；メトプレン；ジスルフोटン；キナルフォス；タウフルバリネート；チオシクラム；チオメトン；アルジカルブ；アジンフォス - メチル；ベンフラカルブ；ピフェンスリン；ブプロフェジン；カルボフラン；ジブチルアミノチオ；カータップ；クロルフルアズロン；クロルピリフォス；サイフルスリン； - サイハロスリン； - サイパーメスリン； - サイパーメスリン；メスリン；ジフルベンズロン；エンドスルファン；エチオフェンカルブ；フェニトロチオン；フェノブカルブ；フェンバレレート；フォルモチオン；メチオカルブ；ヘプテノフォス；イミダクロプリド；チアメトキサム；クロチアニジン；イソピロカルブ；メタミドフォス；メトミル；メピンフォス；パラチオン；パラチオン - メチル；フォサロン；ピリミカルブ；プロボキスル；テフルベンズロン；テルブフォス；トリアザメート；フェノブカルブ；テブフェノジド；フィプロニル； - サイフルスリン；シラフルオフエン；フェンピルオキシメート；ピリダベン；フェナザキン；ピリプロキシフェン；ピリミジフェン；ニテンピラム；アセトアミプリド；エマメクチン；エマメクチン - ベンゾエート；スピノサッド；昆虫に対して活性である植物抽出物；線虫を含み、かつ昆虫に対して活性である調製物；枯草菌から入手可能な調製物；真菌を含み、かつ昆虫に対して活性である調製物；ウイルスを含み、かつ昆虫に対して活性である調製物；クロルフェナピル；アセフェート；アクリナスリン；アラニカルブ；アルファメスリン；アミトラズ；A Z 6 0 5 4 1；アジンフォス A；アジンフォス M；アゾシクロチン；ベンジオカルブ；ベンスルタップ； - サイフルスリン；B P M C；プロフェンプロクス；プロモフォス A；ブフェンカルブ；ブトカルボキシシン；ブチルピリダベン；カゾサフォス；カーバリル；カーボフェノチオン；クロエトカーブ；クロルエトキシフォス；クロルメフォス；シス - レスメスリン；クロサイスリン；クロフェンテジン；シアノフォス；シクロプロスリン；シヘキサチン；デメトン M；デメトン S；デメトン - S - メチル；ジクロフェンチオン；ジクリフォス；ジエチオン；ジメトエート；ジメチルビンフォス

10

20

30

40

50

; ジオキサチオン ; エディフェンフォス ; エスフェンヴァレレート ; エチオン ; エトフェ
 ンプロクス ; エトプロフォス ; エトリムフォス ; フェナミフォス ; フェンブタチンオキサ
 イド ; フェノチオカルブ ; フェンプロパスリン ; フェンピラド ; フェンチオン ; フルアジ
 ナム ; フルシクロクスロン ; フルサイスリネート ; フルフェノクスロン ; フルフェンプロ
 クス ; フォノフォス ; フォスチアゼート ; フブフェンプロクス ; H C H ; ヘキサフルムロ
 ン ; ヘキシチアゾックス ; I K I - 2 2 0 ; イプロベンフォス ; イソフェンフォス ; イソ
 キサチオン ; イパーメクチン ; マラチオン ; メカルバム ; メスルフェンフォス ; メタルデ
 ヒド ; メトルカルブ ; ミルベメクチン ; モキシデクチン ; ナレド ; N C 1 8 4 ; オメソエ
 ート ; オキサミル ; オキシデメトン M ; オキシデプロフォス ; パーメスリン ; フェントエ
 ート ; フォレート ; フォスメット ; フォキシム ; ピリミフォス M ; ピリミフォス E ; プロ
 メカルブ ; プロパフォス ; プロチオフォス ; プロソエート ; ピラクロフォス ; ピラダフェ
 ンチオン ; ピレスメスリン ; ピレスラム ; テブフェノジド ; サリチオン ; セブフォス ; ス
 ルフォテブ ; スルプロフォス ; テブフェンピラド ; テブピリムフォス ; テフルスリン ; テ
 メフォス ; テルバム ; テトラクロルピンフォス ; チアクロプリド ; チアフェノックス ; チ
 オジカルブ ; チオファノックス ; チオナジン ; スリングエンシン ; トラロメスリン ; トリ
 アラセン ; トリアゾフォス ; トリアズロン ; トリクロルフォン ; トリフムロン ; トリメタ
 カルブ ; バミドチオン ; キシリルカルブ ; Y I 5 3 0 1 / 5 3 0 2 ; ゼータメスリン ;
 D P X - M P 0 6 2 - インドキサカルブ ; メトキシフェノジド ; ビフェナゼート ; X M C
 (3 , 5 - キシリルメチルカルバメート) ; または真菌病原体 *Metarhizium anisopliae*。
 【 0 1 7 6 】

10

20

群Mの1つのメンバーを有する以下の式Iの化合物の混合物は、好適である(以下の表で
 挙げる "M" は、群Mから選定される1つのメンバーを意味する)。

【表 1】

T1.1 + M; T38.3 + M; T37.3 + M; T20.1 + M; T1.3 + M; T1.121 + M; T2.1 + M; T2.3 + M;
 T6.1 + M; T6.3 + M; T7.1 + M; T7.3 + M; T21.3 + M; T22.3 + M; T46.1 + M; T46.3 + M;
 T50.1 + M; T50.3 + M; T51.1 + M; T51.3 + M; T52.1 + M; T52.3 + M; T53.1 + M; T53.3 + M;
 T72.1 + M; T72.3 + M; T72.207 + M; T72.273 + M; T73.1 + M; T73.3 + M; T73.207 + M;
 T73.273 + M; T74.1 + M; T74.3 + M; T75.1 + M; T75.3 + M; T76.1 + M; T76.3 + M; T77.1 +
 M; T77.3 + M; T78.1 + M; T78.3 + M; T79.1 + M; T80.3 + M; T81.1 + M; T81.3 + M; T82.1 +
 M; T83.3 + M; T84.3 + M and T85.3 + M; P2.001 + M; P2.002 + M; P2.003 + M; P2.004 + M;
 P2.005 + M; P2.006 + M; P2.007 + M; P2.008 + M; P2.009 + M; P2.010 + M; P2.011 + M;
 P2.012 + M; P2.013 + M; P2.014 + M; P2.015 + M; P2.016 + M; P2.017 + M; P2.018 + M;
 P2.019 + M; P2.020 + M; P2.021 + M; P2.022 + M; P2.023 + M; P2.024 + M; P2.025 + M;
 P2.026 + M; P2.027 + M; P2.028 + M; P2.029 + M; P2.030 + M; P2.031 + M; P2.032 + M;
 P2.033 + M; P2.034 + M; P2.035 + M; P2.036 + M; P2.037 + M; P2.038 + M; P2.039 + M;
 P2.040 + M; P2.041 + M; P2.042 + M; P2.043 + M; P2.044 + M; P2.045 + M; P2.046 + M;
 P2.047 + M; P2.048 + M; P2.049 + M; P2.050 + M; P2.051 + M; P2.052 + M; P2.053 + M;
 P2.054 + M; P2.055 + M; P2.056 + M; P2.057 + M; P2.058 + M; P2.059 + M; P2.060 + M;
 P2.061 + M; P2.062 + M; P2.063 + M; P2.064 + M; P2.065 + M; P2.066 + M; P2.067 + M;
 P2.068 + M; P2.069 + M; P2.070 + M; P2.071 + M; P2.072 + M; P2.073 + M; P2.074 + M;
 P2.075 + M; P2.076 + M; P2.077 + M; P2.078 + M; P2.079 + M; P2.080 + M; P2.081 + M;
 P2.082 + M; P2.083 + M; P2.084 + M; P2.085 + M; P2.086 + M; P2.087 + M; P2.088 + M;
 P2.089 + M; P2.090 + M; P2.091 + M; P2.092 + M; P2.093 + M; P2.094 + M; P2.095 + M;
 P2.096 + M; P2.097 + M; P2.098 + M; P2.099 + M; P2.100 + M; P2.101 + M; P2.102 + M;
 P2.103 + M; P2.104 + M; P2.105 + M; P2.106 + M; P2.107 + M; P2.108 + M; P2.109 + M;
 P2.110 + M; P2.111 + M; P2.112 + M; P2.113 + M; P2.114 + M; P2.115 + M; P2.116 + M;
 P2.117 + M; P2.118 + M; P2.119 + M; P2.120 + M; P2.121 + M; P2.122 + M; P2.123 + M;
 P2.124 + M; P2.125 + M; P2.126 + M; P2.127 + M; P2.128 + M; P2.129 + M; P2.130 + M;
 P2.131 + M; P2.132 + M; P2.133 + M; P2.134 + M; P2.135 + M; P2.136 + M; P2.137 + M;
 P2.138 + M; P2.139 + M; P2.140 + M; P2.141 + M; P2.142 + M; P2.143 + M; P2.144 + M;
 P2.145 + M; P2.146 + M; P2.147 + M; P2.148 + M; P2.149 + M; P2.150 + M; P2.151 + M;
 P2.152 + M; P2.153 + M; P2.154 + M; P2.155 + M; P2.156 + M; P2.157 + M; P2.158 + M;
 P2.159 + M; P2.160 + M; P2.161 + M; P2.162 + M; P2.163 + M; P2.164 + M and P2.165 +
 M.

10

20

30

40

【0177】

当該組成物は安定化剤等の固体または液体の補助剤、例えば非エポキシ化またはエポキシ化された植物油(例えばエポキシ化されたココナツ油、ナタネ油または大豆油)、消泡剤(例えばシリコン油、保存剤、粘性調節剤、結合剤及び/または粘着付与剤)、肥料または特別な効果を得るための他の活性成分(例えば例えば、殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤または除草剤)を更に含むことができる。

【0178】

本発明に係る組成物は、それ自体公知の様式で、補助剤の非存在下で調製される。例えば、固体の活性成分を、粉碎し、ふるいかけ、および/または圧縮することによって調製

50

され、ならびに少なくとも1種の補助剤の存在下で、例えば、活性成分を、1以上の補助剤とともに密接に混合および/または粉碎することによって調製される。当該組成物を調製するためのこれらの方法及びこれらの組成物を調製するための式Iの化合物の使用は、本発明の対象でもある。

【0179】

本発明はまた、当該組成物の適用の方法、すなわち、言及された型の害虫を制御する方法、例えば、意図される目的および一般的に環境に適するように選択される、スプレー、噴霧、ダスティング、ブラッシング、ドレッシング、分散、または流し込みに関し、ならびに、言及された型の害虫を制御するための組成物の使用に関する。典型的な濃度の割合は、0.1~1000ppm、好適には0.1~500ppmの活性成分である。ヘクタールあたりの適用の割合は、一般的には、1~2000gの活性成分/ヘクタール、特に10~1000g/ha、好適には20~600g/haである。

10

【0180】

農作物保護の領域における適用の好適な方法は、植物の葉への適用（茎葉散布）である。適用の頻度および速度は、問題の害虫による蔓延の脅威に適合するように選択することができる。或いは、活性成分は、根系を経由して、植物の場所に液体組成物が浸透されるとき、または固体型の活性成分が植物の場所に、例えば、土壌に、例えば、顆粒型（土壌適用）で取り込まれるときに、によって植物に到達することができる（全身作用）。水稲作物の場合、このような顆粒は、水田に測定した量で適用してもよい。

20

【0181】

本発明に係る組成物はまた、植物繁殖物質、例えば、種子、例えば、果実、塊茎、または穀粒、または切り枝を、上記タイプの害虫に対して保護するために適切である。繁殖物質は、植え付けの前に本発明の組成物で処理することができ、例えば、種子は、種まきの前に処理することができる。或いは、当該活性成分は、液体組成物中に穀粒を浸透させることによって、または固体組成物の層を適用することによって、穀粒（被覆）に適用され得る。この組成物はまた、繁殖物質が植え付けされるとき、植え付け部位に適用され得、例えば、種まきの間に種まきの畝間に適用され得る。本発明はまた、植物繁殖物質を処理するこのような方法、およびそのように処理された植物繁殖物質に関する。

【0182】

以下の実施例は、本発明を例証することを意図する。これらは本発明を制限しない。温度は摂氏温度で与えられる。略語"M.P."は"融点"を意味する。

30

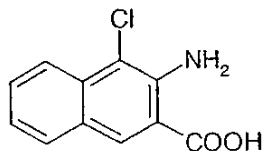
【実施例】

【0183】

調製例

実施例 P1

【化16】



40

1.9g(14.7mmol)のN-クロロスクインイミドと10mgの2,2'-アゾイソ酪酸ニトリル(butyric nitrile)を100 mlのテトラクロロメタン中の2.5g(13.3mmol)の2-アミノ-3-カルボキシナフタレンの懸濁物に付加する。当該反応混合物を18時間室温で攪拌し、250 mlの水性塩化ナトリウム水溶液で処理し、そして酢酸エチルで抽出する(3×250ml)：T組合せた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過し、そしてろ液を真空中で濃縮した。標題の化合物が茶色の固形で得られる[¹H-NMR (CDCl₃) : 8.53 (s,1H), 7.98 (d,1H), 7.73 (d,1H), 7.5

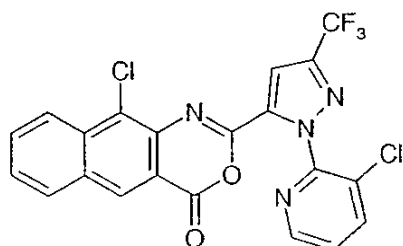
50

5 (t, 1H), 7.25 (t, 1H)]。

【 0 1 8 4 】

実施例 P2

【 化 1 7 】



10

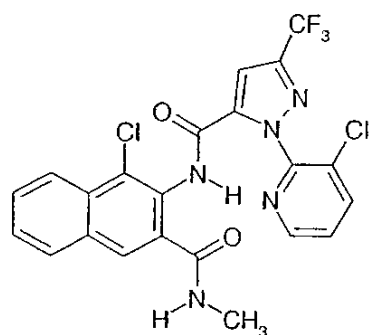
窒素環境中で0.5ml (5.75mmol)の塩化オキサリルを、室温で撹拌しながら2 mlのジクロロメタン中の295 mg (1.0mmol)の5-カルボキシ-1-(3-クロロピリド-2-イル)-3-トリフルオロメチル-ピラゾールの懸濁物中に滴下付加する。当該反応混合物を1時間撹拌し、その後、20 mlのジクロロメタンと0.38 mlのトリエチルアミンの混合物中の実施例P1の0.25 g (1mmol)の標題の化合物の溶液へ滴下付加する。その後、当該反応混合物を3時間撹拌する。更に0.7mlのトリエチルアミンを付加し、引き続き0.22ml (2.8mmol)のメタンスルホン酸クロライドの単一部分を付加する。その後、当該反応混合物を18時間撹拌し、真空中で濃縮し、そして残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し[シリカゲル；ヘキサン/酢酸エチル(3：1)]、標題の化合物を得る[¹H-NMR(CDCl₃)：8.78 (s, 1 H), 8.61 (m, 1 H), 8.30 (m, 2H), 8.03 (dd, 1 H), 7.78 (m, 1 H), 7.67 (m, 1 H), 7.56 (m, 2H); MS(エレクトロスプレー)：477, 479, 481((M+H)⁺)]。

20

【 0 1 8 5 】

実施例 P3

【 化 1 8 】



(T1.1)

30

40

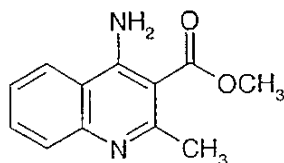
窒素環境下で無水テトラヒドロフラン中の1 mlのメチルアミンの溶液(2.0 M)を、撹拌しながら5mlの無水テトラヒドロフラン中の実施例 P2の標題の化合物の0.07 g (0.15mmol)の溶液へ付加する。当該反応混合物を50 °に1時間加熱し、室温に冷却し、真空中で濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し[シリカゲル；ヘキサン，引き続きヘキサン/酢酸エチル(3：1)による]、標題の化合物T1.1を得る[¹H-NMR(DMSO-d₆)：10.80 (s, 1 H), 8.53 (d, 1 H), 8.45 (br s, 1 H), 8.21 (m, 2H), 8.08 (m, 2H), 7.87 (s, 1 H), 7.78 (t, 1 H), 7.70 (t, 1 H), 7.64 (dd, 1 H), 2.70 (d, 3H); MS (エレクトロスプレー)：508, 510, 512((M+H)⁺)]。

50

【 0 1 8 6 】

実施例 P4

【 化 1 9 】



10

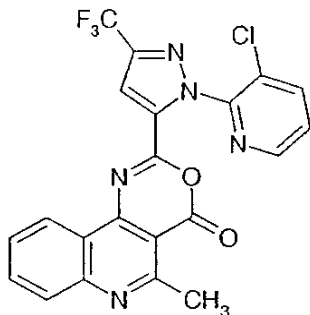
0.91 ml (8.46mmol)のメチルアセトアセテート及び1.98 ml (16.9mmol)の四塩化スズを20mlのトルエン中の1 g (8.46mmol)の1-アミノ-2-シアノベンゼン溶液に付加する。反応混合物を加熱し2時間還流し、室温に冷却し、そして真空中で濃縮する。残渣を250mlの水溶性炭酸ナトリウム溶液に懸濁させて、そして当該懸濁物を30分間攪拌し、一晩置き、その後、酢酸エチルで抽出する(3×250ml)。組合せた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させて、ろ過し、ろ液を真空中で濃縮し、そして黄色の固形残渣をジエチルエーテルで粉末化する。黄色の粉末状の標題の化合物が得られる[¹H-NMR (CDCl₃) : 7.88 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.06(brs, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.82 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー) : 217((M+H) +)]。

20

【 0 1 8 7 】

実施例 P5

【 化 2 0 】



30

窒素環境中で4滴のN,N-ジメチルホルムアミドとその後0.08 ml (0.93mmol)の塩化オキサリルを室温で攪拌しながら10 mlのジクロロメタン中の250 mg (0.86mmol)の5-カルボキシ-1-(3-クロロピリド-2-イル)-3-トリフルオロメチル-ピラゾールの懸濁物に滴下付加する。反応混合物を1時間攪拌して、溶媒を真空中で除去し、残渣を3回トルエンで共蒸発し、その後、3 mlのトルエンで懸濁して、懸濁物"A"を得る。105 mg (0.858mmol)の4-ジメチルアミノピリジンを3 mlのトルエン中の185 mg (0.858mmol)の実施例 P4の標題の化合物の懸濁物に付加して、懸濁物"B"を得る。懸濁物"A"を懸濁物"B"に付加し、反応フラスコ中の懸濁物"A"を完全に移動させるために、懸濁物"A"を含む容器をトルエンと数滴のN,N-ジメチルホルムアミドの少量の混合物ですすいだ。反応混合物を還流で3時間加熱し、その後、室温に冷却する。黄色の沈殿をろ過し、ジエチルエーテルで洗浄する。ろ液を10 mlの水で洗浄し、そして当該水を酢酸エチルで(2×50ml)逆抽出(back-extracted)する。組合せた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥してろ過し、ろ液を真空中で濃縮し、そして残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し[シリカゲル ; ヘキサン/酢酸エチル(1:2)

40

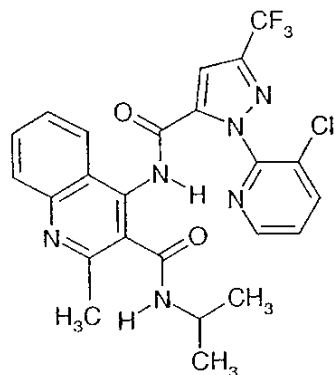
50

]、標題の化合物を得る[$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 8.66 (d, 1 H), 8.09 (d, 1 H), 8.03 (d, 1 H), 7.86 (t, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.67 (d, 1 H), 7.45 (m, 1 H), 7.40 (dd, 1 H), 3.09 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー) : 458 ((M+H)+)]。

【 0 1 8 8 】

実施例 P6

【化 2 1 】



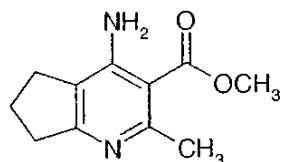
(T38.3)

0.022 ml (0.262mmol)のイソプロピルアミンを撹拌しながら、1 mlの無水テトラヒドロフラン中の40 mg (0.087mmol)の実施例 P5の標題の化合物の懸濁物に付加する。当該反応混合物を60 ° に90分間加熱し、室温に冷却し、そして真空中で濃縮し、そして残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し[シリカゲル; メタノール/ジクロロメタン(1:9)]、標題の化合物T38.3を得る[$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 11.17 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.71 (t, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.36 (m, 1H), 6.31 (d, 1H), 4.23 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.16 (d, 6H); MS (エレクトロスプレー) : 517 ((M+H)+)]。

【 0 1 8 9 】

実施例 P7

【化 2 2 】

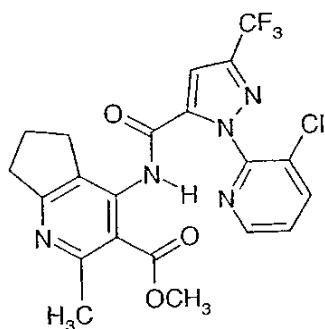


1-アミノ-2-シアノ-シクロペンタ-1-エンから出発して、標題の化合物を実施例 P4に発表した手順と同様の方法で調製することができる[$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 5.77 (br s, 2H), 3.90 (s, 3H), 2.97 (m, 2H), 2.70 (m, 2H), 2.15 (m, 2H); MS (エレクトロスプレー) : 207 ((M+H)+)]。

【 0 1 9 0 】

実施例 P8

【化 2 3】



10

窒素環境中において、4滴のN,N-ジメチルホルムアミドとその後0.16ml (1.86mmol)の塩化オキサリルを室温で撹拌しながら、20 mlのジクロロメタン中の0.5 g(1.72mmol)の5-カルボキシ-1-(3-クロロピリド-2-イル)-3-トリフルオロメチル-ピラゾールの懸濁物に滴下付加する。反応混合物を90分間撹拌し、溶媒を真空中で除去して、残渣をトルエンと3回共蒸発させて、その後、10 mlのテトラヒドロフラン中に溶解させて、溶液"A"を得る。0.24 ml (1.72mmol)のトリエチルアミンを10 mlのテトラヒドロフラン中の195 mg (0.95mmol)の実施例 P7の標題の化合物の懸濁物に付加して、懸濁物"B"を与える。5 mlの溶液"A"を30分かけて懸濁物"B"に滴下付加する。反応混合物を2.5時間撹拌し、10 mlの水性炭酸水素ナトリウムで処理し、酢酸エチルで抽出する(2×40ml)。組合せた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させて、ろ過し、ろ液を真空中で濃縮して、そして残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し(シリカゲル；酢酸エチル)、標題の化合物を得る[¹H-NMR(CDCl₃): 10.15 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.22 (s, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.99 (m, 2H), 2.75 (m, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.06 (m, 2H); MS (エレクトロスプレー): 480((M+H)⁺)]。

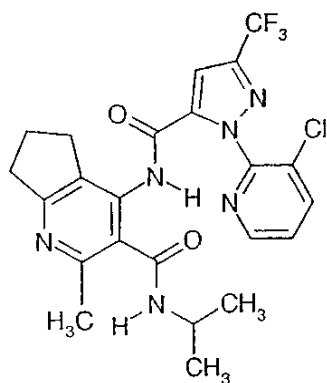
20

【 0 1 9 1】

実施例 P9

30

【化 2 4】



(T37.3)

40

0.04 ml (0.47mmol)のイソプロピルアミンを室温で撹拌しながら、ヘキサン中の0.24 mlのトリメチルアンモニウム溶液(2.0 M)及び3 mlのジクロロメタンの混合物へ付加する。反応混合物を40分間撹拌する。3mlのジクロロメタン中の110 mg (0.22mmol)の実施例 P8の標題の化合物の溶液を付加し、そして反応混合物を加熱して、6時間還流し、室温に冷却し、そして一晩置き、その後、20mlの水を注ぐ。混合物をジクロロメタンで抽出する(2

50

× 30ml)。組合せた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過し、ろ液を真空で濃縮し、そして残渣をクロマトグラフィーにより精製して[シリカゲル；酢酸エチル/ヘキサン (2:1)、その後ニートの酢酸エチル]、標題の化合物T37.3を得る[¹H-NMR(CDCl₃) : 10.69 (s, 1 H), 8.49 (d, 1 H), 7.88 (d, 1 H), 7.70 (s, 1 H), 7.42 (m, 1 H), 5.89 (d, 1 H), 4.24 (m, 1 H), 2.87 (t, 2H), 2.57 (t, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.02 (m, 2H), 1.19 (d, 6H); MS (エレクトロスプレー) : 507((M+H) +)]。

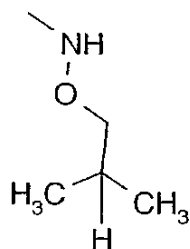
【 0 1 9 2 】

実施例 P10

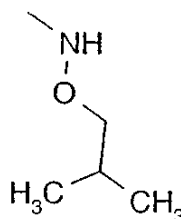
表 P1及びP2に挙げた化合物は、実施例P1～P9に発表した手順と同様の方法において調製することができる。融点は である。以下の構造式では、炭素原子に結合した第3の水素原子は、描写していない。

10

【化 2 5 】



は以下のように描かれる：



20

【 0 1 9 3 】

【表 2】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T1.3		IR: 1657, 1536, 1538, 1540 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 8.43 (d, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.59 (t, 2H), 7.33 (m, 2H), 7.22 (m, 1H), 6.19 (d, 1H), 4.19 (m, 1H), 1.18 (d, 6H).	
T1.121		IR: 1657, 1522, 1524, 1526 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.95 (s, 1H), 8.43 (dd, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.35 (m, 3H), 7.16 (t, 1H), 2.77 (s, 3H), 2.71 (s, 3H).	
T2.1		IR: 1657, 1584, 1586, 1588, 1590 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.82 (s, 1H), 8.52 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.89 (m, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.64 (dd, 1H), 2.69 (d, 3H).	

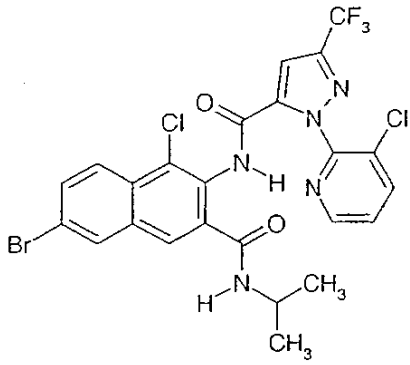
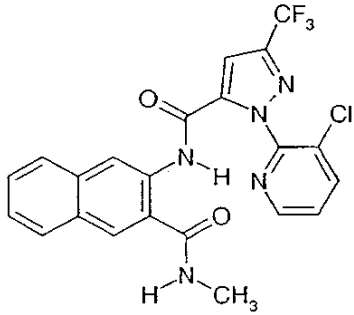
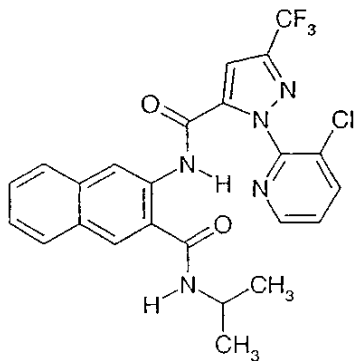
10

20

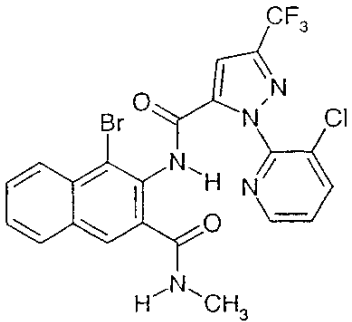
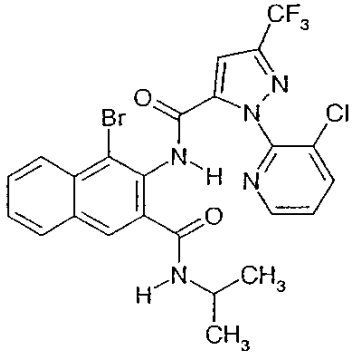
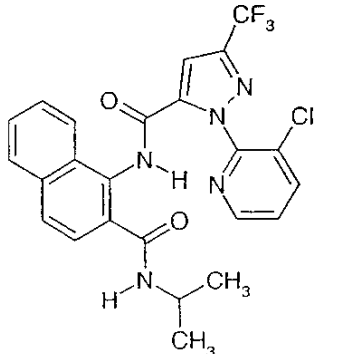
30

40

【表 3】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T2.3		イソクトマス°レ-: 614, 616, 618 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.80 (s, 1H), 8.50 (dd, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.32 (d, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.88 (m, 1H), 7.63 (dd, 1H), 3.92 (m, 1H), 1.06 (d, 6H).	10
T6.1		イソクトマス°レ-: 474, 476 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 12.75 (s, 1H), 9.13 (d, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.55 (m, 3H), 2.89 (d, 3H).	20
T6.3		イソクトマス°レ-: 502, 504 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 12.55 (s, 1H), 8.90 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.55 (m, 3H), 4.21 (m, 1H), 1.23 (d, 6H).	30
				40

【表 4】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T7.1		IR: 552, 554, 556 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.80 (s, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.20 (m, 2H), 8.11 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.64 (m, 2H), 2.70 (d, 3H).	
T7.3		IR: 580, 582, 584 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.65 (s, 1H), 8.43 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.20 (m, 1H), 1.17 (d, 6H).	
T21.3		IR: 502, 504 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.97 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.84 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.11 (d, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.23 (m, 1H), 1.19 (d, 6H).	

10

20

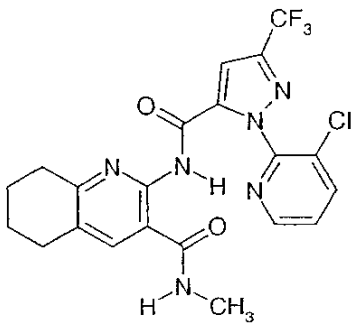
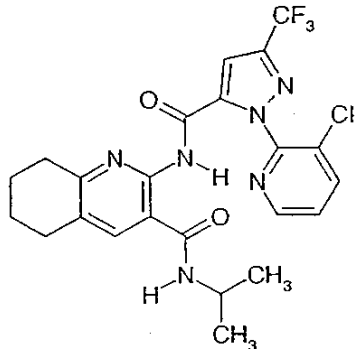
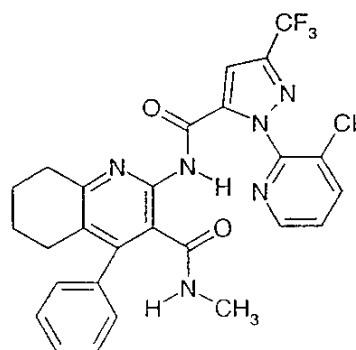
30

40

【表 5】

40

【表 6】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T50.1				145 – 147
T50.3				143 – 145
T51.1				165 – 168

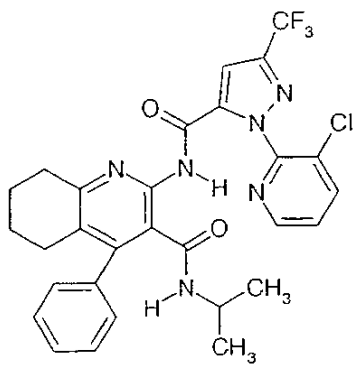
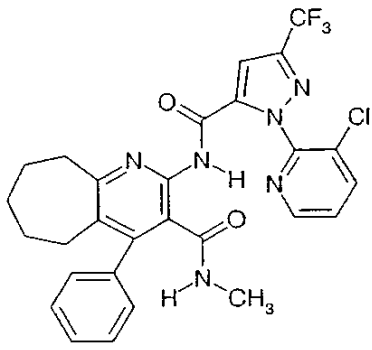
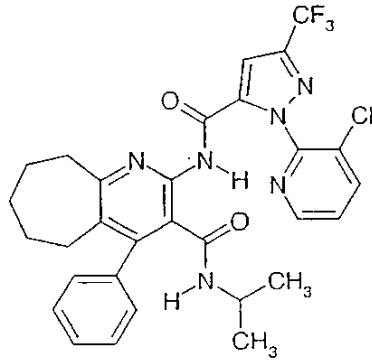
10

20

30

40

【表 7】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T51.3				146 – 148
T52.1				211 – 213
T52.3				269 – 270

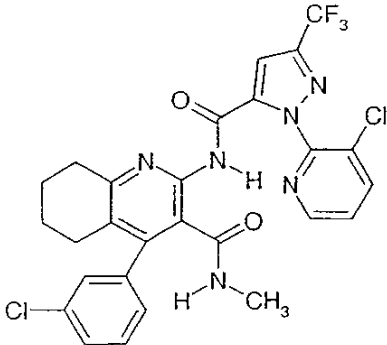
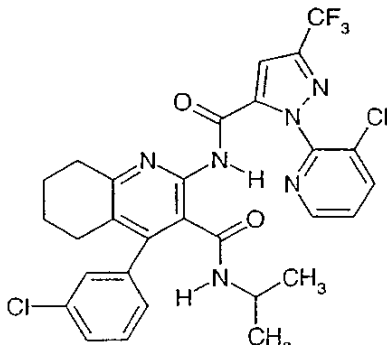
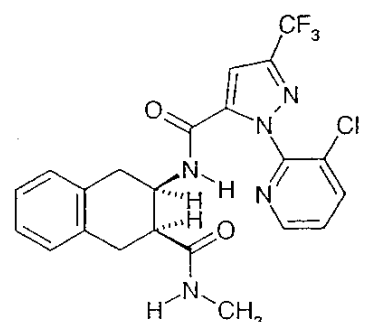
10

20

30

40

【表 8】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T53.1				183 - 185
T53.3				259 - 260
T72.1				226 - 228

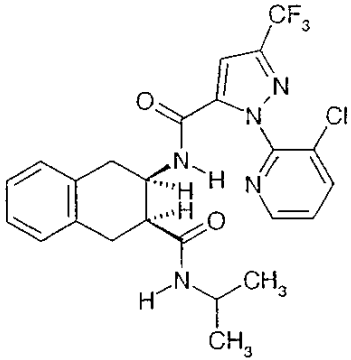
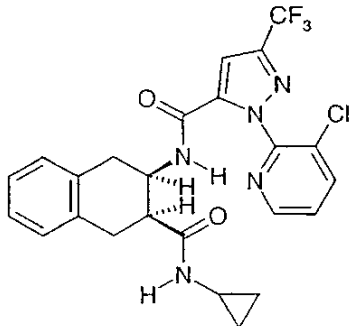
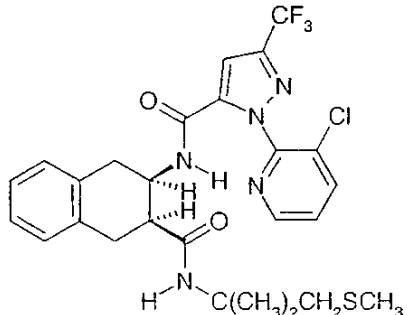
10

20

30

40

【表 9】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T72.3				229 – 232
T72.207				230 – 233
T72.273				184 – 186

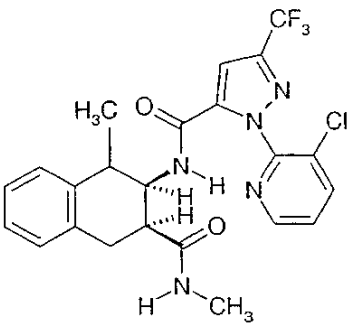
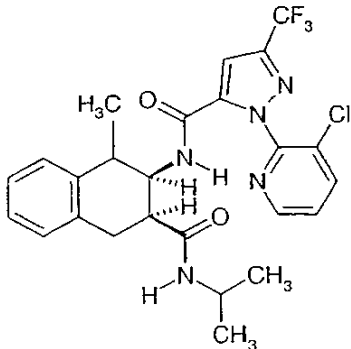
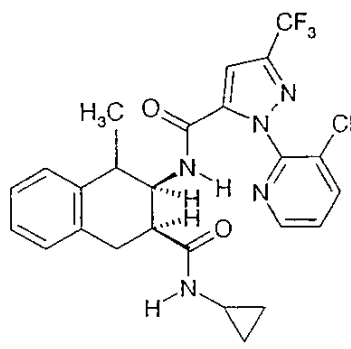
10

20

30

40

【表 10】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T73.1				205 - 207
T73.3				223 - 225
T73.207				192 - 194

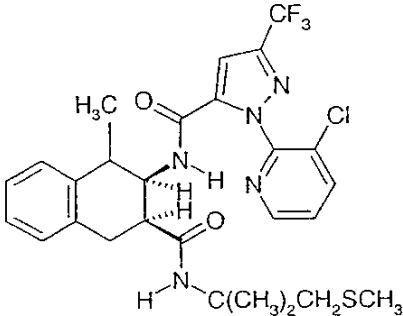
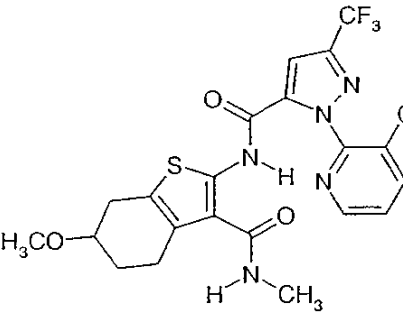
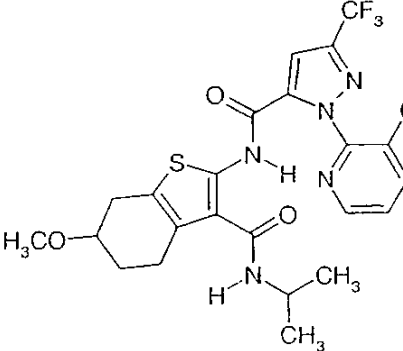
10

20

30

40

【表 1 1】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T73.273		イレクトロスプレー: 580 ((M+H) ⁺).		
T74.1				133 - 135
T74.3				206 - 207

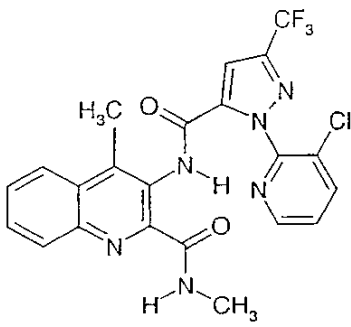
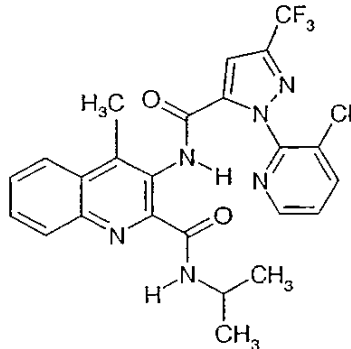
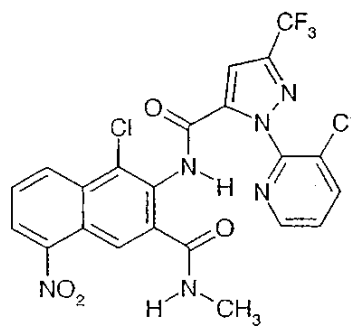
10

20

30

40

【表 1 2】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T75.1		IR: 1650 (C=O), 1550 (C=O), 1450 (N-H), 1350 (N-H), 1250 (N-H), 1150 (N-H), 1050 (N-H), 1000 (N-H), 950 (N-H), 900 (N-H), 850 (N-H), 800 (N-H), 750 (N-H), 700 (N-H), 650 (N-H), 600 (N-H), 550 (N-H), 500 (N-H), 450 (N-H), 400 (N-H), 350 (N-H), 300 (N-H), 250 (N-H), 200 (N-H), 150 (N-H), 100 (N-H). MS: 489 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.97 (s, 1H), 8.50 (br s, 1H), 8.49 (dd, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.41 (m, 1H), 3.09 (d, 3H), 2.52 (s, 3H).	
T75.3		IR: 1650 (C=O), 1550 (C=O), 1450 (N-H), 1350 (N-H), 1250 (N-H), 1150 (N-H), 1050 (N-H), 1000 (N-H), 950 (N-H), 900 (N-H), 850 (N-H), 800 (N-H), 750 (N-H), 700 (N-H), 650 (N-H), 600 (N-H), 550 (N-H), 500 (N-H), 450 (N-H), 400 (N-H), 350 (N-H), 300 (N-H), 250 (N-H), 200 (N-H), 150 (N-H), 100 (N-H). MS: 517 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 12.06 (s, 1H), 8.49 (dd, 1H), 8.33 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.41 (m, 1H), 4.30 (m, 1H), 2.52 (s, 3H), 1.35 (d, 6H).	
T76.1			CDCl ₃ : 8.47 (d, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.13 (d, 1H), 8.08 (m, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.48 (m, 1H), 2.93 (d, 3H).	

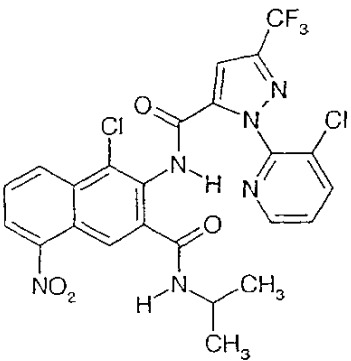
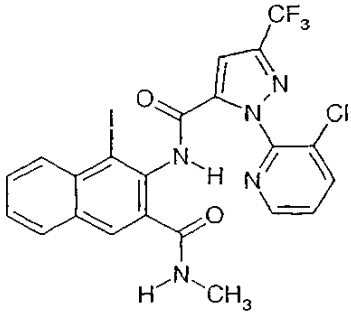
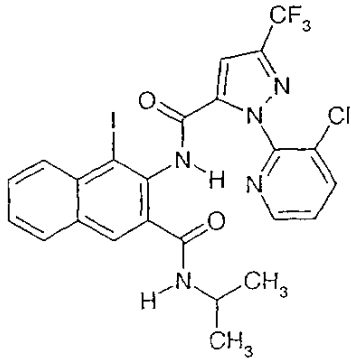
10

20

30

40

【表 13】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T76.3		IR: 1650 (C=O), 1550 (C=O), 1500 (NO ₂), 1450 (C=O), 1380 (C=O), 1350 (C=O), 1300 (C=O), 1250 (C=O), 1200 (C=O), 1150 (C=O), 1100 (C=O), 1050 (C=O), 1000 (C=O), 950 (C=O), 900 (C=O), 850 (C=O), 800 (C=O), 750 (C=O), 700 (C=O), 650 (C=O), 600 (C=O), 550 (C=O), 500 (C=O), 450 (C=O), 400 (C=O), 350 (C=O), 300 (C=O), 250 (C=O), 200 (C=O), 150 (C=O), 100 (C=O), 50 (C=O). 581 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.95 (s, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.47 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 1.11 (d, 6H).	10
T77.1		IR: 1650 (C=O), 1550 (C=O), 1500 (NO ₂), 1450 (C=O), 1380 (C=O), 1350 (C=O), 1300 (C=O), 1250 (C=O), 1200 (C=O), 1150 (C=O), 1100 (C=O), 1050 (C=O), 1000 (C=O), 950 (C=O), 900 (C=O), 850 (C=O), 800 (C=O), 750 (C=O), 700 (C=O), 650 (C=O), 600 (C=O), 550 (C=O), 500 (C=O), 450 (C=O), 400 (C=O), 350 (C=O), 300 (C=O), 250 (C=O), 200 (C=O), 150 (C=O), 100 (C=O), 50 (C=O). 600 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.29 (s, 1H), 8.47 (dd, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 6.26 (m, 1H), 2.96 (d, 3H).	20
T77.3		IR: 1650 (C=O), 1550 (C=O), 1500 (NO ₂), 1450 (C=O), 1380 (C=O), 1350 (C=O), 1300 (C=O), 1250 (C=O), 1200 (C=O), 1150 (C=O), 1100 (C=O), 1050 (C=O), 1000 (C=O), 950 (C=O), 900 (C=O), 850 (C=O), 800 (C=O), 750 (C=O), 700 (C=O), 650 (C=O), 600 (C=O), 550 (C=O), 500 (C=O), 450 (C=O), 400 (C=O), 350 (C=O), 300 (C=O), 250 (C=O), 200 (C=O), 150 (C=O), 100 (C=O), 50 (C=O). 628 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.61 (s, 1H), 8.45 (dd, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.36 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 6.10 (d, 1H), 4.20 (m, 1H), 1.16 (d, 6H).	30

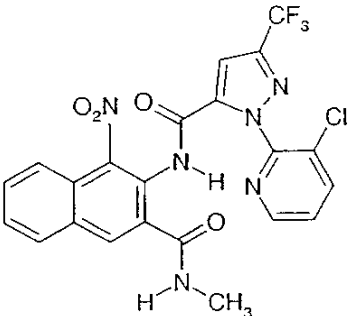
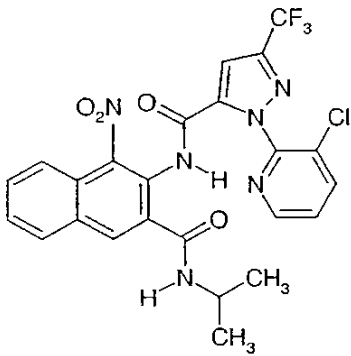
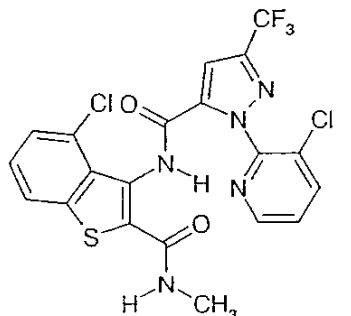
10

20

30

40

【表 1 4】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T78.1		IR: 1677 cm ⁻¹ 519 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.82 (br s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 6.58 (br s, 1H), 2.98 (d, 3H).	
T78.3		IR: 1677 cm ⁻¹ 547 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.02 (br s, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.40 (m, 1H), 6.20 (br s, 1H), 4.27 (m, 1H), 1.27 (d, 6H).	
T79.1		IR: 1677 cm ⁻¹ 514 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 9.15 (s, 1H), 8.53 (dd, 1H), 8.22 (dd, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.47 (m, 2H), 2.77 (s, 3H).	

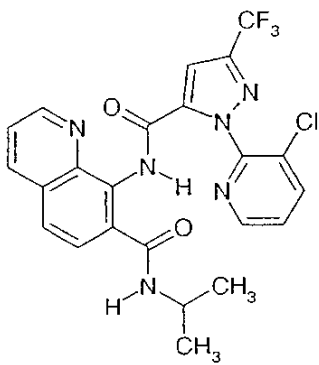
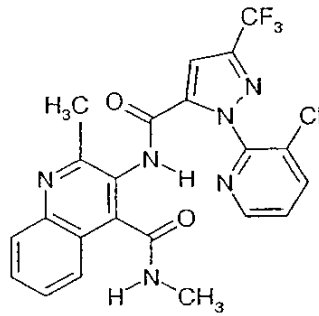
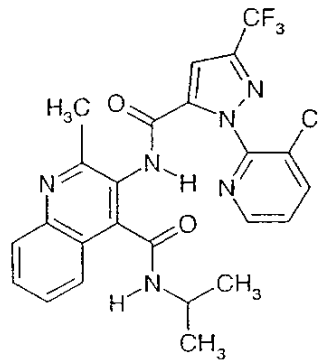
10

20

30

40

【表 15】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T80.3		イソトリスルホレート: 503, 505 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.10 (s, 1H), 8.87 (d, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.58 (m, 2H), 7.49 (m, 2H), 7.38 (m, 1H), 6.01 (d, 1H), 4.17 (m, 1H), 1.14 (d, 6H).	10
T81.1		イソトリスルホレート: 489 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.20 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.76 (t, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.41 (m, 1H), 6.45 (m, 1H), 3.04 (d, 3H), 1.94 (s, 3H).	20
T81.3		イソトリスルホレート: 517 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.49 (s, 1H), 8.44 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.39 (m, 1H), 6.29 (d, 1H), 4.28 (m, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.18 (d, 6H).	30

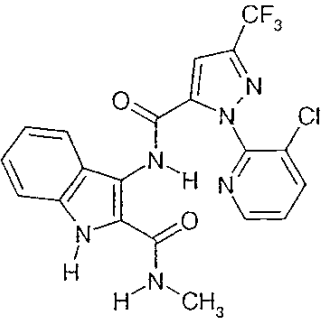
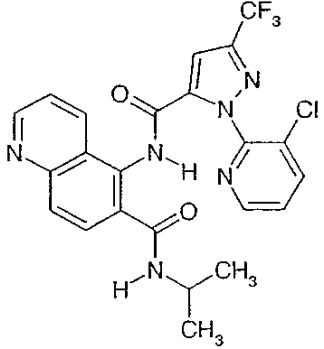
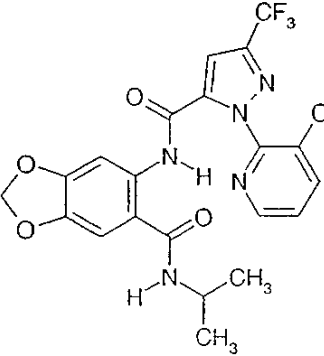
10

20

30

40

【表 16】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T82.1		IR: 1677, 1577 463 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 11.58 (s, 1H), 10.65 (s, 1H), 8.57 (dd, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.03 (t, 1H), 2.82 (s, 3H).	
T83.3		IR: 1677, 1577 503, 505 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.22 (s, 1H), 8.90 (m, 1H), 8.44 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.40 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.25 (m, 1H), 1.22 (d, 6H).	
T84.3		IR: 1677, 1577 496, 498 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 13.48 (s, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.02 (m, 2H), 7.56 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.00 (s, 2H), 4.28 (m, 1H), 1.26 (d, 6H).	

10

20

30

40

【表 17】

化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T85.3				220 – 224
T88.3				261-263
T88.1				264-266

10

20

30

40

【表 18】

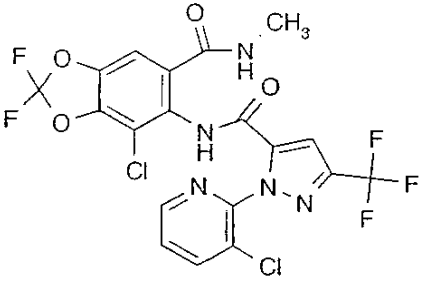
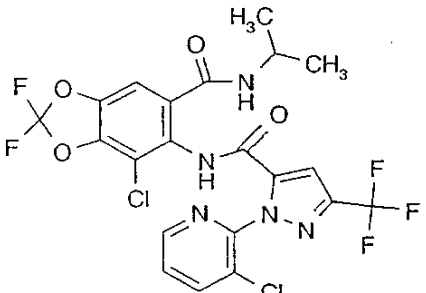
化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T89.1				274-276
T90.1				242-244
T90.3				256-258

10

20

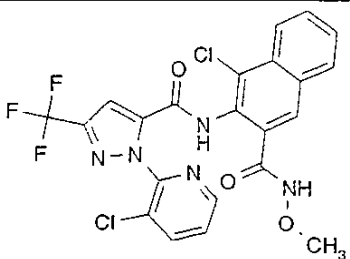
30

【表 19】

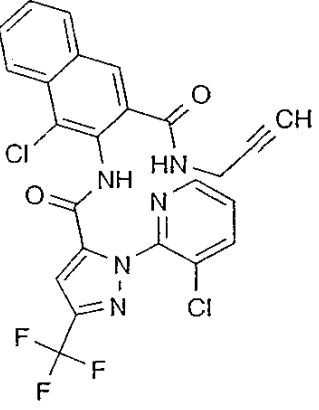
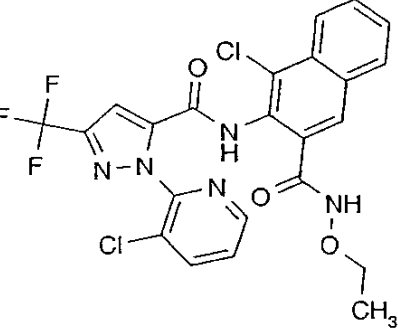
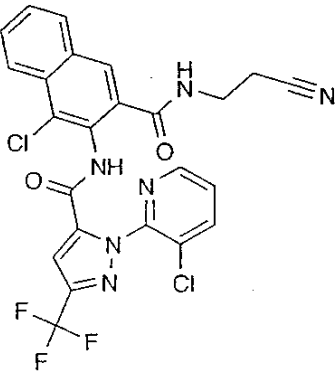
化合物	構造	MS	¹ H-NMR	M. P.
T91.1				265-267
T91.3				251-253

【 0 1 9 4 】

【表 20】

化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\nu}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.001		524 (M+H)+

【表 2 1】

化合物Nr.	構造	Phys. データ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.002		532 ((M+H)+)
P2.003		538 ((M+H)+)
P2.004		547 ((M+H)+)

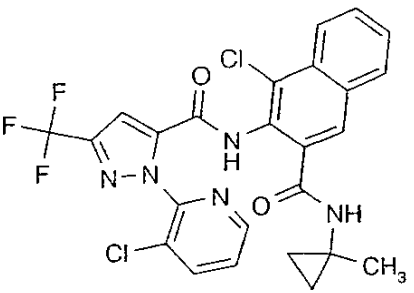
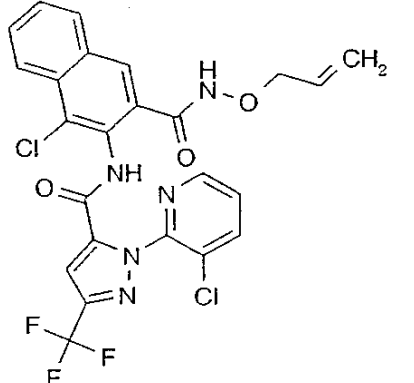
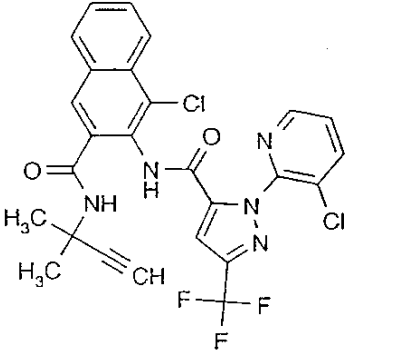
10

20

30

40

【表 2 2】

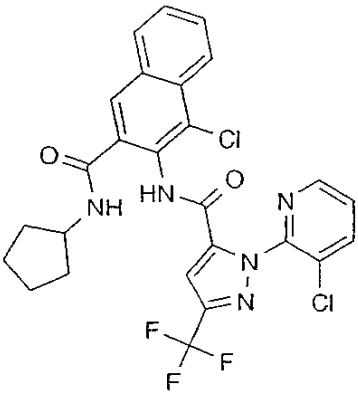
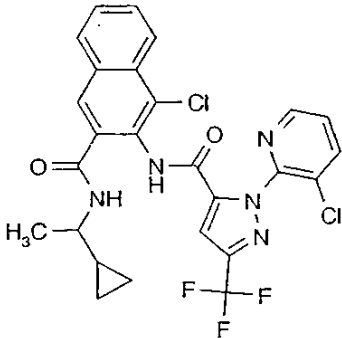
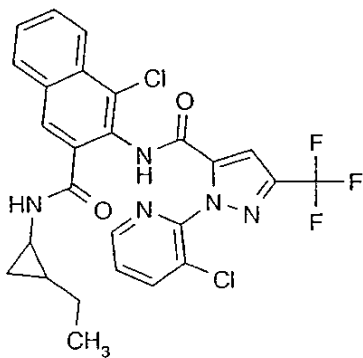
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.005		548 ((M+H)+)
P2.006		550 ((M+H)+)
P2.007		560 ((M+H)+)

10

20

30

【表 2 3】

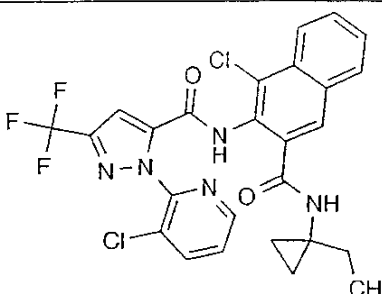
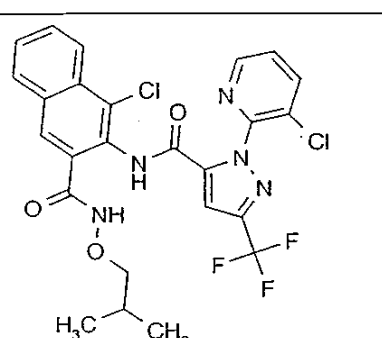
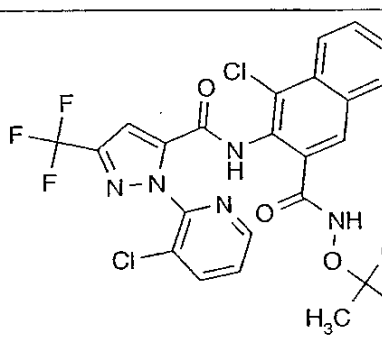
化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - η (MS., NMR, M.P in °C)
P2.008		562 ((M+H)+)
P2.009		562 ((M+H)+)
P2.010		562 ((M+H)+)

10

20

30

【表 2 4】

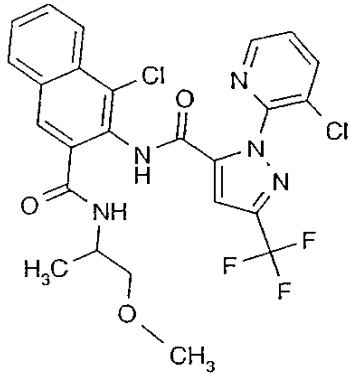
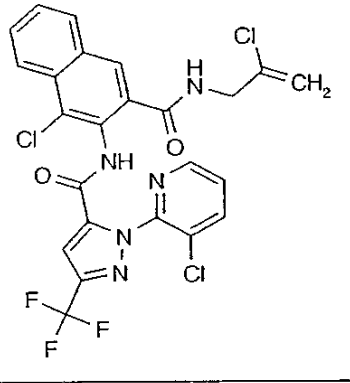
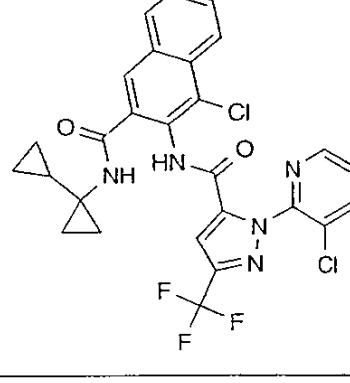
化合物 Nr.	構造	Phys. \bar{f} - \bar{t} (MS., NMR, M.P in °C)
P2.011		562 ((M+H)+)
P2.012		566 ((M+H)+)
P2.013		566 ((M+H)+)

10

20

30

【表 2 5】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\nu}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.014		566 ((M+H)+)
P2.015		568 ((M+H)+)
P2.016		574 ((M+H)+)

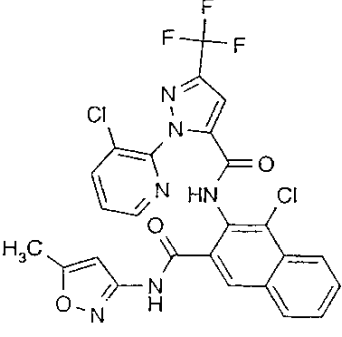
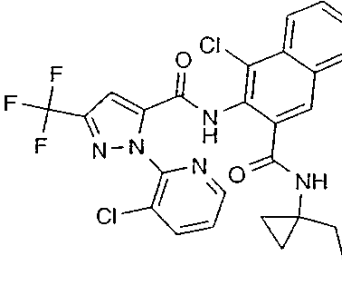
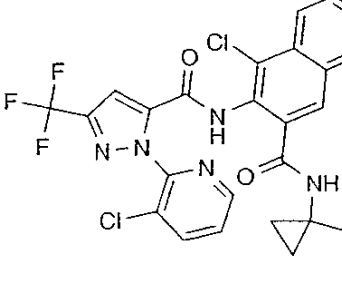
10

20

30

40

【表 2 6】

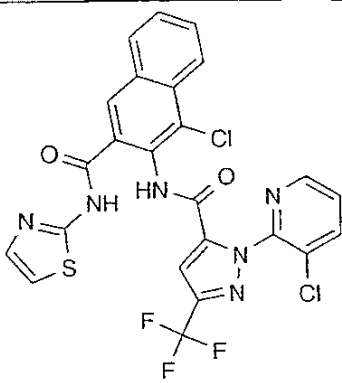
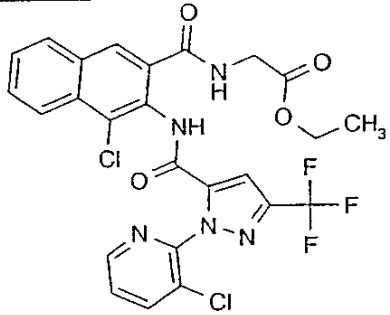
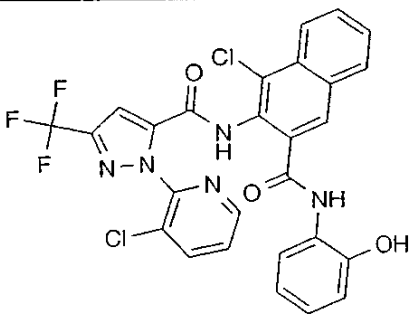
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.017		575 ((M+H)+)
P2.018		576 ((M+H)+)
P2.019		576 ((M+H)+)

10

20

30

【表 2 7】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.020		577 ((M+H)+)
P2.021		580 ((M+H)+)
P2.022		586 ((M+H)+)

10

20

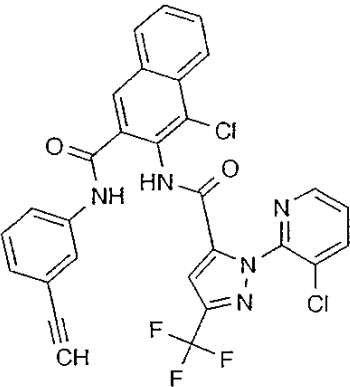
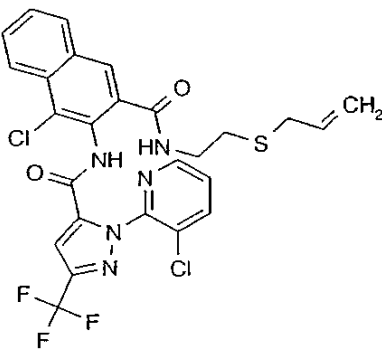
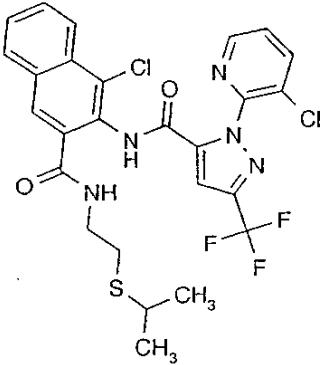
30

10

20

30

【表 2 9】

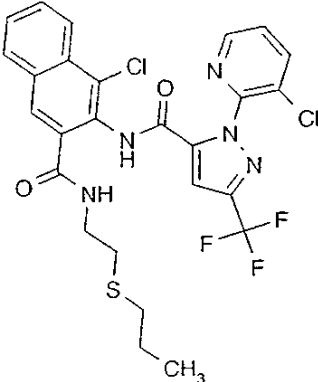
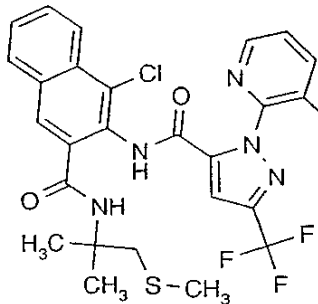
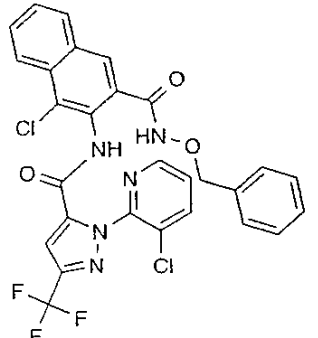
化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\tau}$ - \bar{t} (MS., NMR, M.P in °C)
P2.026		594 ((M+H)+)
P2.027		594 ((M+H)+)
P2.028		596 ((M+H)+)

10

20

30

【表 3 0】

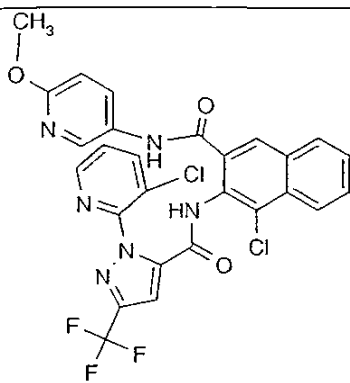
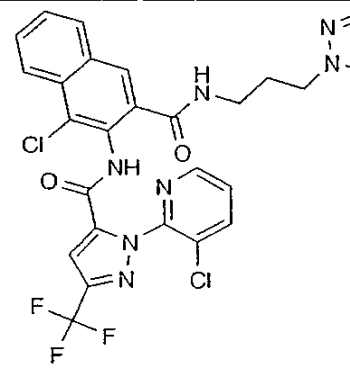
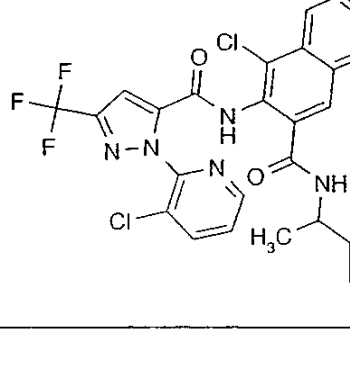
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.029		596 ((M+H)+)
P2.030 (T1.273)		596 ((M+H)+)
P2.031		600 ((M+H)+)

10

20

30

【表 3 1】

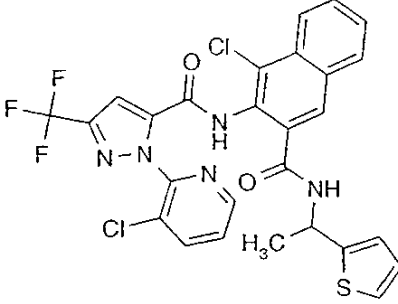
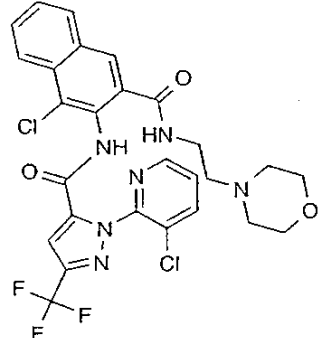
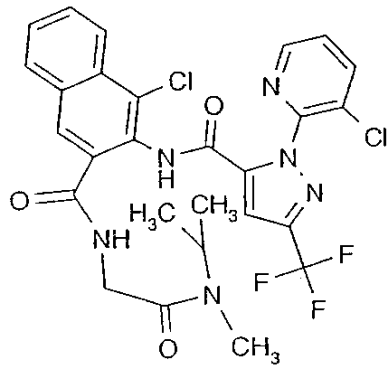
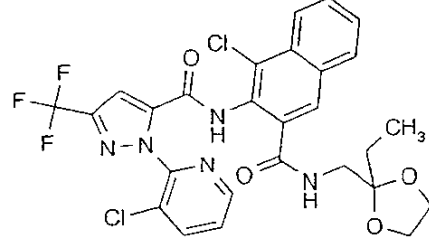
化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}^{\circ}-\delta$ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.032		601 ((M+H)+)
P2.033		603 ((M+H)+)
P2.034		604 ((M+H)+)

10

20

30

【表 3 2】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.035		604 ((M+H)+)
P2.036		607 ((M+H)+)
P2.037		607 ((M+H)+)
P2.038		608 ((M+H)+)

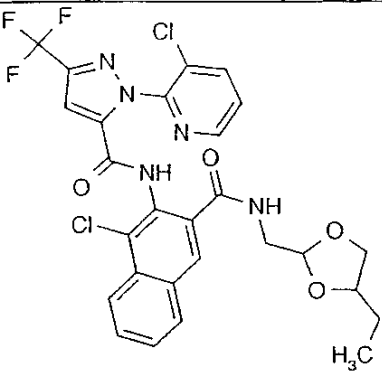
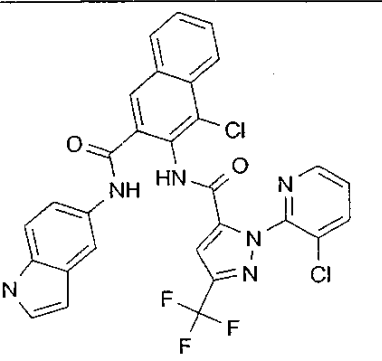
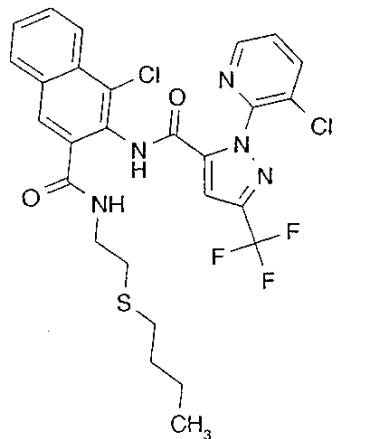
10

20

30

40

【表 3 3】

化合物 Nr.	構造	Phys. 値 - 値 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.039		608 ((M+H)+)
P2.040		609 ((M+H)+)
P2.041		610 ((M+H)+)

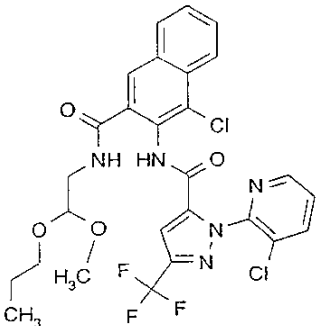
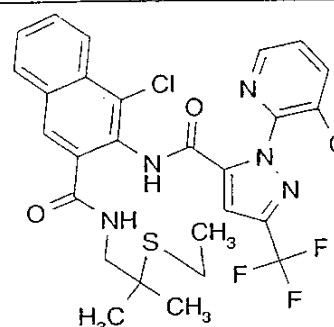
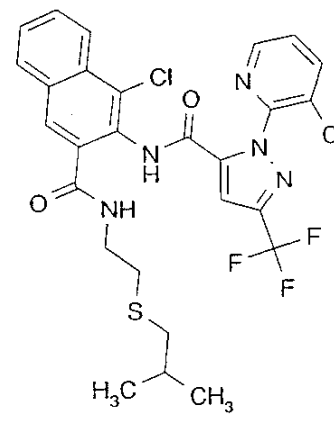
10

20

30

40

【表 3 4】

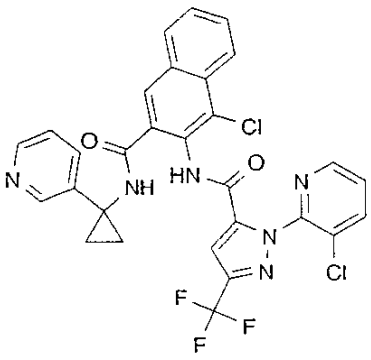
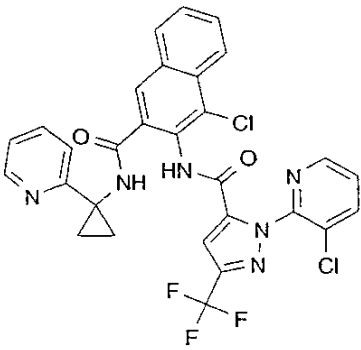
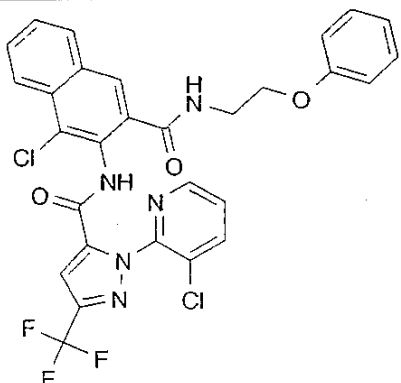
化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{m}^+ - \bar{q}$ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.042		610 ((M+H)+)
P2.043		610 ((M+H)+)
P2.044		610 ((M+H)+)

10

20

30

【表 3 5】

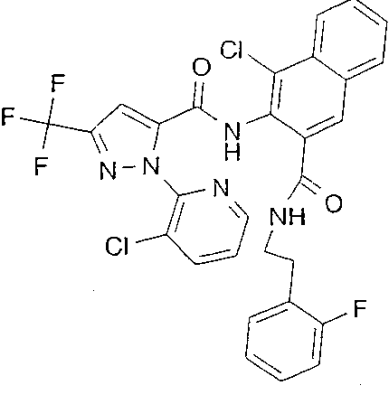
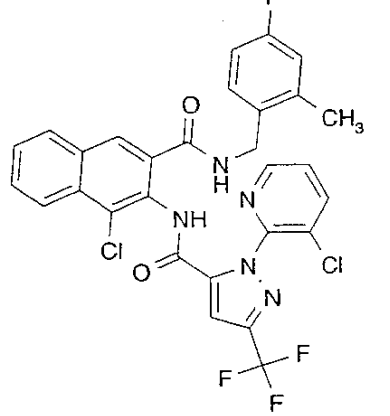
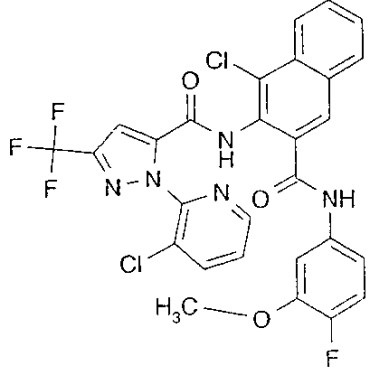
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.045		611 ((M+H)+)
P2.046		611 ((M+H)+)
P2.047		614 ((M+H)+)

10

20

30

【表 3 6】

化合物 Nr.	構造	Phys. 値 - 々 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.048		616 ((M+H)+)
P2.049		616 ((M+H)+)
P2.050		618 ((M+H)+)

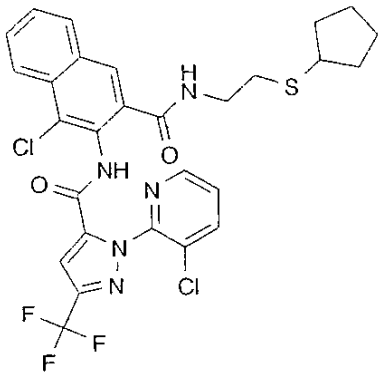
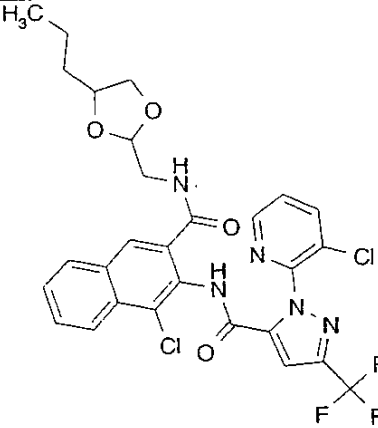
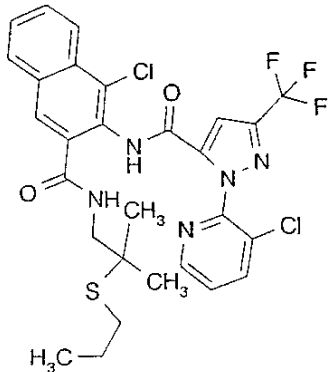
10

20

30

40

【表 3 7】

化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.051		622 ((M+H)+)
P2.052		622 ((M+H)+)
P2.053		624 ((M+H)+)

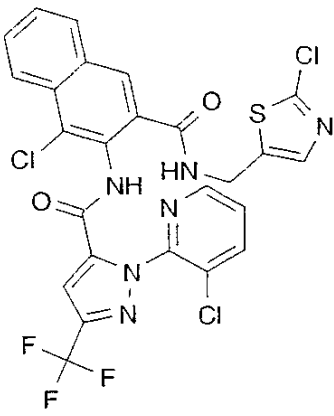
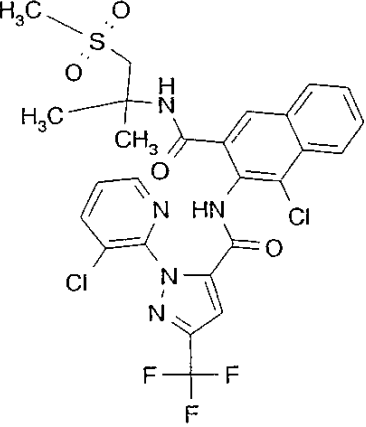
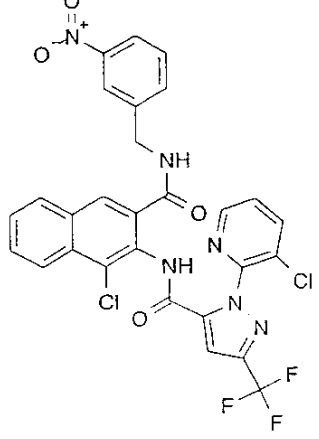
10

20

30

40

【表 3 8】

化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.054		625 ((M+H)+)
P2.055		628 ((M+H)+)
P2.056		629 ((M+H)+)

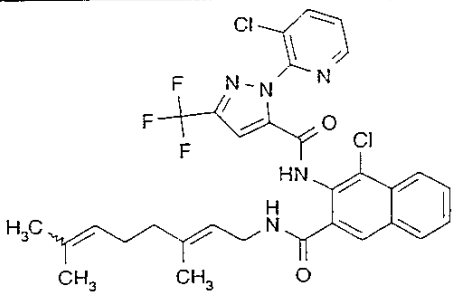
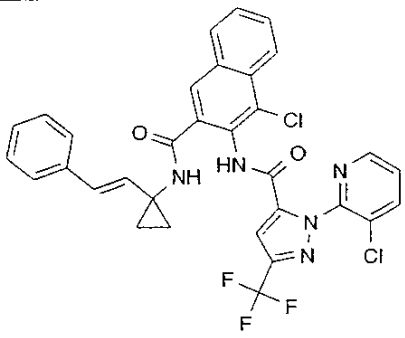
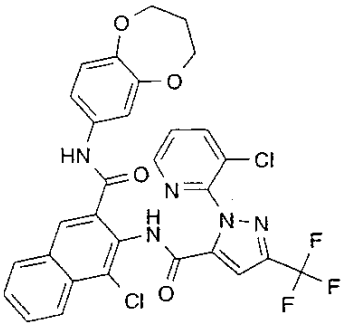
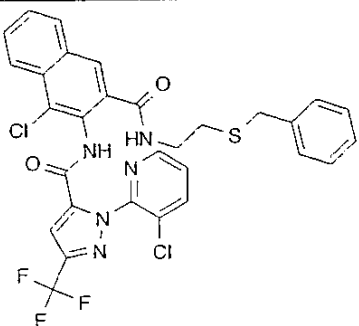
10

20

30

40

【表 3 9】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.057		630 ((M+H)+)
P2.058		636 ((M+H)+)
P2.059		642 ((M+H)+)
P2.060		644 ((M+H)+)

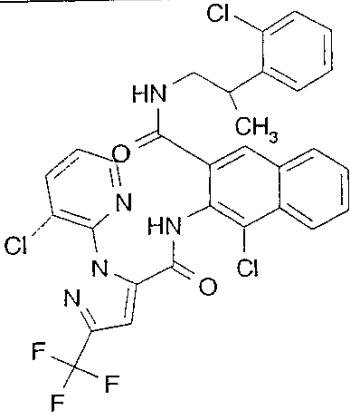
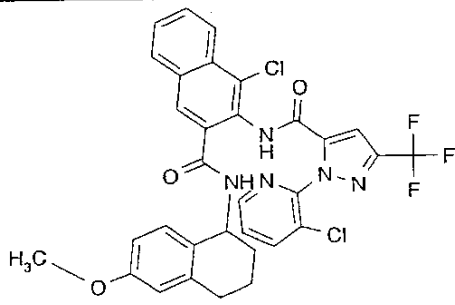
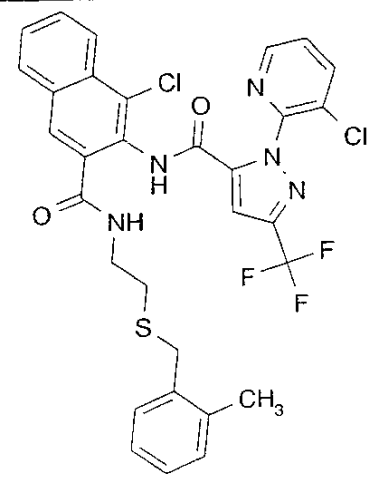
10

20

30

40

【表 4 0】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.061		646 ((M+H)+)
P2.062		654 ((M+H)+)
P2.063		658 ((M+H)+)

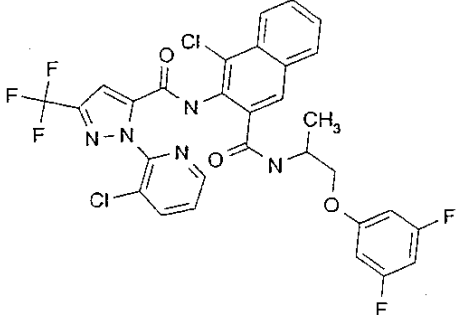
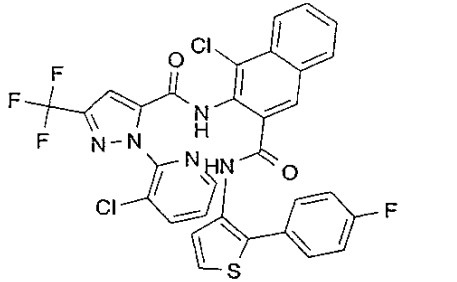
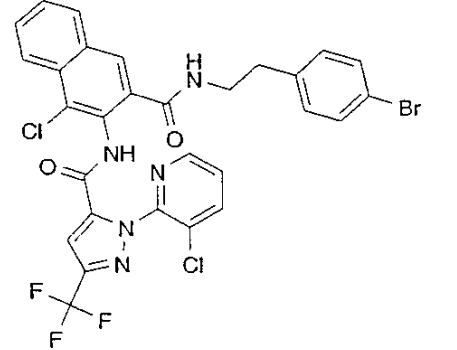
10

20

30

40

【表 4 1】

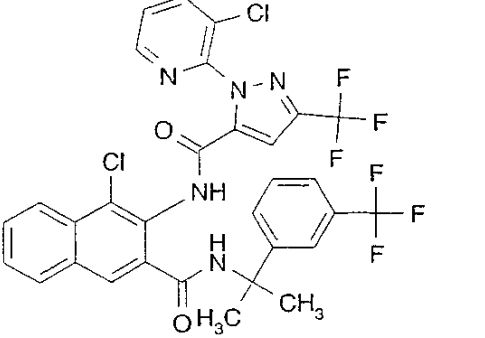
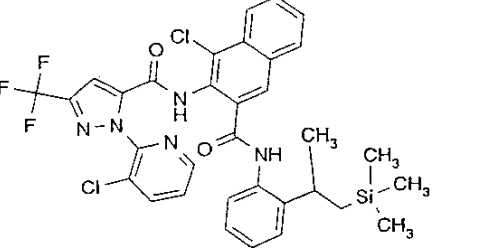
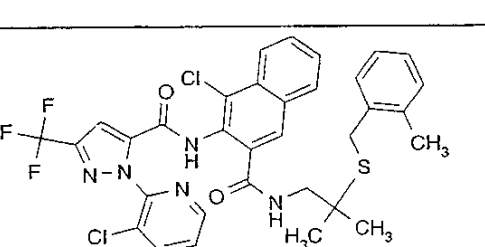
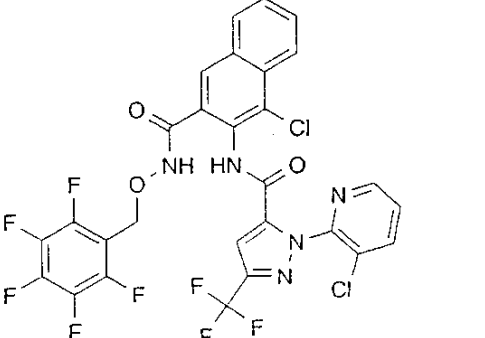
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.064		664 ((M+H)+)
P2.065		670 ((M+H)+)
P2.066		676 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 2】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.067		680 ((M+H)+)
P2.068		684 ((M+H)+)
P2.069		686 ((M+H)+)
P2.070		690 ((M+H)+)

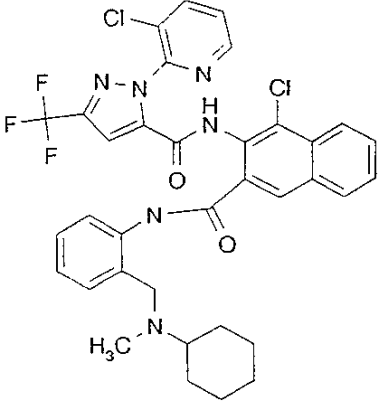
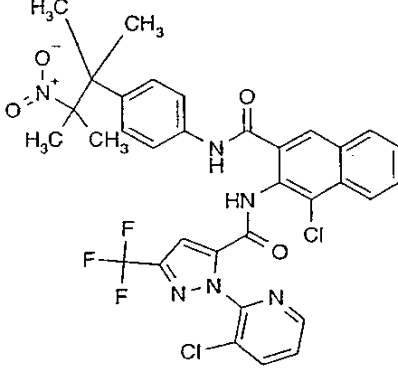
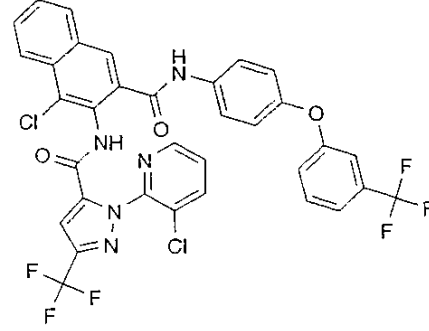
10

20

30

40

【表 4 3】

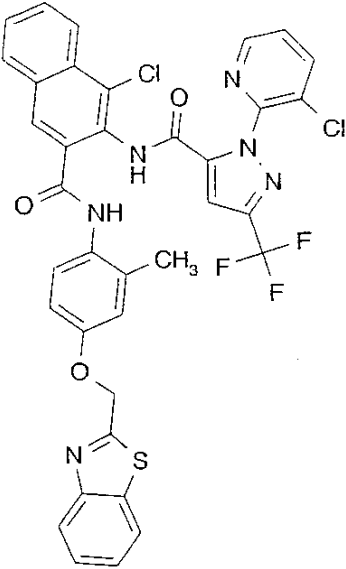
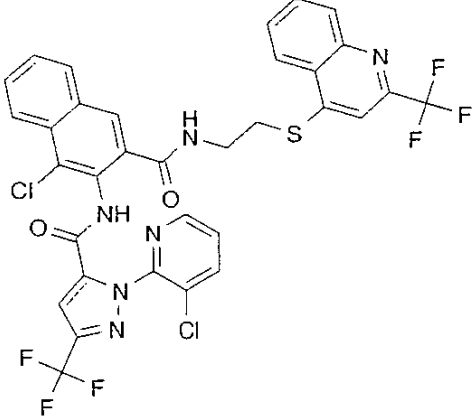
化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{m}^+ - \bar{z}$ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.071		695 ((M+H)+)
P2.072		699 ((M+H)+)
P2.073		730 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 4】

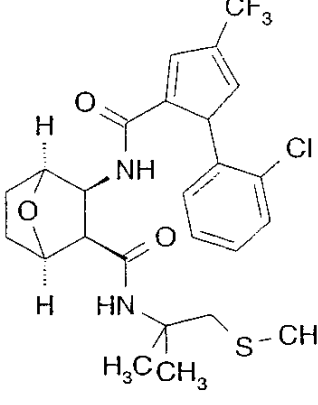
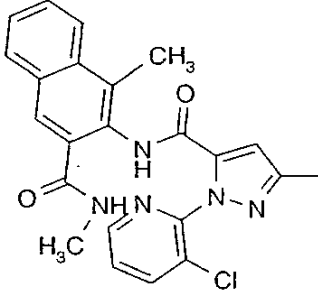
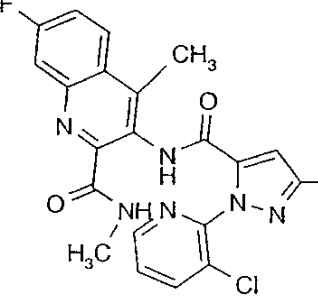
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.074		747 ((M+H)+)
P2.075		749 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 5】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.076 (T85.273)		459 ((M+H)+) oil
P2.077 (T8.1)		488 ((M+H)+)
P2.078		507 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 6】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.079		522 ((M+H)+)
P2.080		524 ((M+H)+)
P2.081 (T5.1)		533 ((M+H)+)
P2.082		535 ((M+H)+)

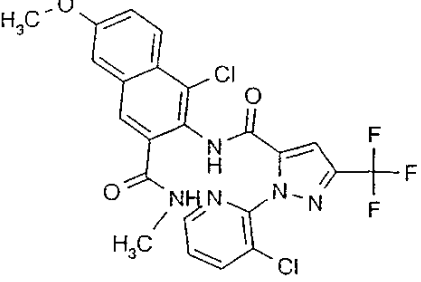
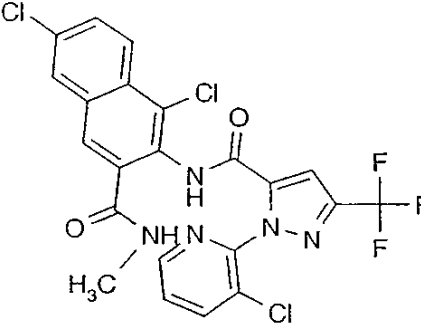
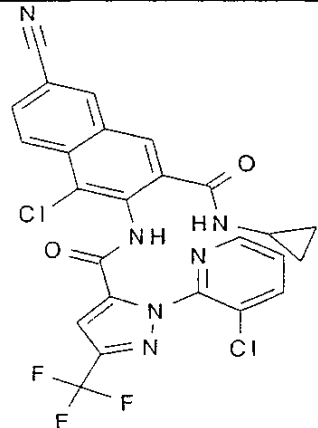
10

20

30

40

【表 4 7】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性-値 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.083		538 ((M+H)+)
P2.084 (T20.1)		544 ((M+H)+)
P2.085 (T5.207)		559 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 8】

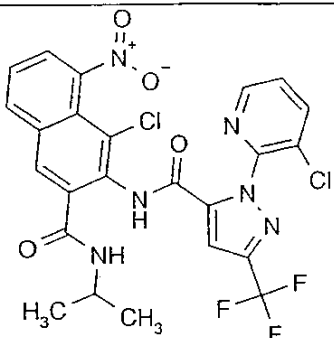
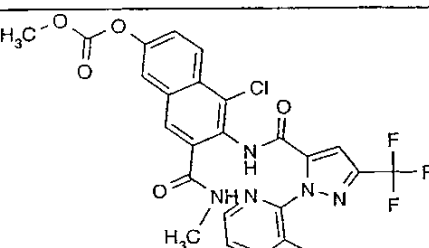
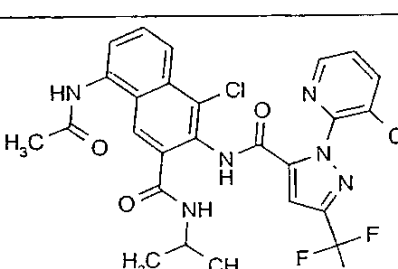
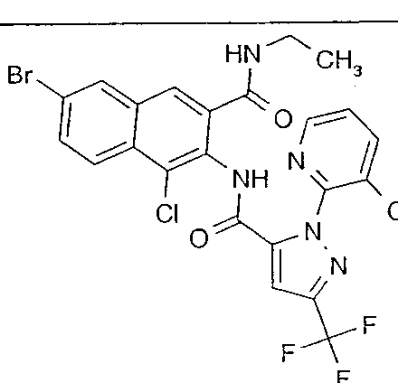
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.086 (T5.3)		561 ((M+H)+)
P2.087 (T20.207)		568 ((M+H)+)
P2.088 (T20.3)		570 ((M+H)+)

10

20

30

【表 4 9】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.089		581 ((M+H)+)
P2.090		582 ((M+H)+)
P2.091		593 ((M+H)+)
P2.092 (T2.2)		602 ((M+H)+)

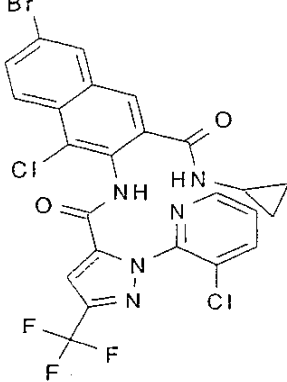
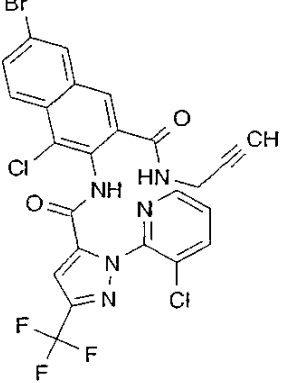
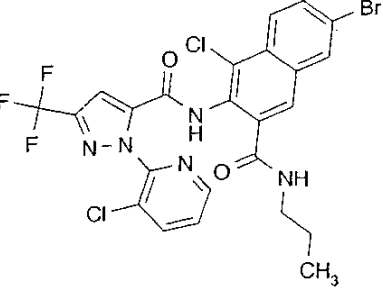
10

20

30

40

【表 5 0】

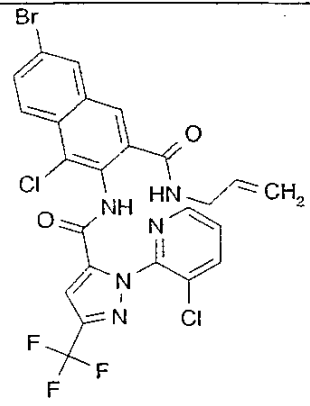
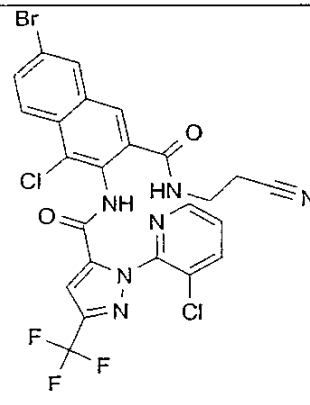
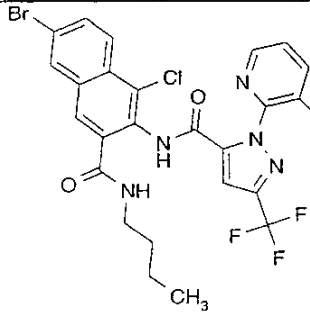
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.093 (T2.207)		612 ((M-1)-)
P2.094		612 ((M+H)+)
P2.095		614 ((M-1)-)

10

20

30

【表 5 1】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.096		614 ((M+H)+)
P2.097		627 ((M+H)+)
P2.098		628 ((M+H)+)

10

20

30

【表 5 2】

化合物Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.099		628 ((M-1)-)
P2.100		628 ((M+H)+)
P2.101		628 ((M+H)+)

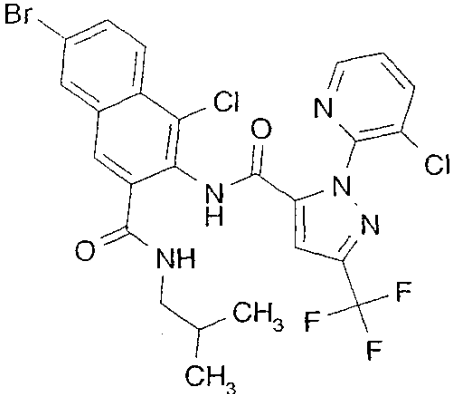
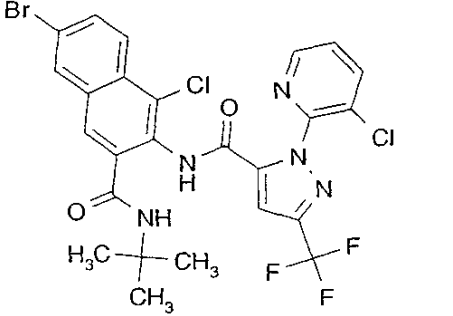
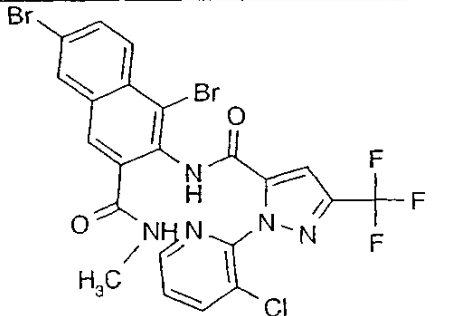
10

20

30

40

【表 5 3】

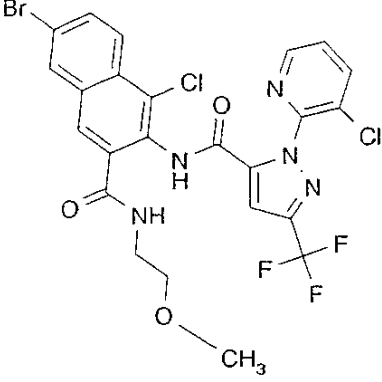
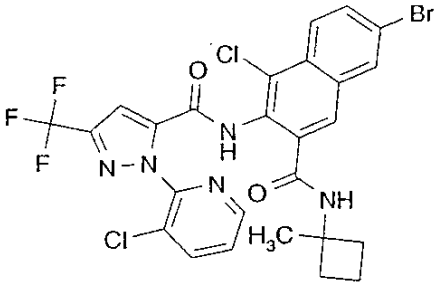
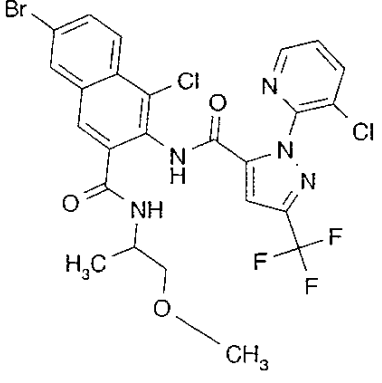
化合物 Nr.	構造	Phys. ̳ - ̳ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.102		630 ((M+H)+)
P2.103		630 ((M+H)+)
P2.104 (T9.1)		632 ((M+H)+)

10

20

30

【表 5 4】

化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.105		632 ((M+H)+)
P2.106		642 ((M+H)+)
P2.107		646 ((M+H)+)

10

20

30

【表 5 5】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\nu}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.108		646 ((M+H)+)
P2.109 (T9.2)		646 ((M+H)+)
P2.110		648 ((M+H)+)

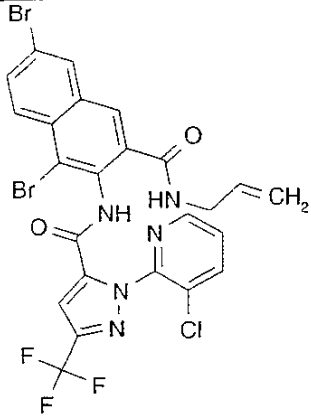
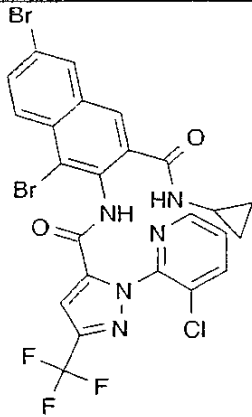
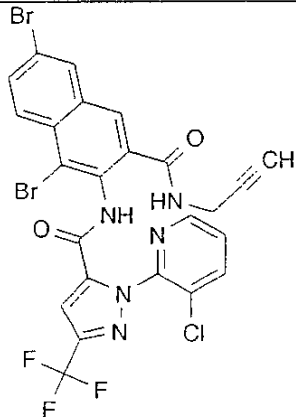
10

20

30

40

【表 5 6】

化合物Nr.	構造	Phys. 特性 - (MS., NMR, M.P in °C)
P2.111		656 ((M+H)+)
P2.112 (T9.207)		656 ((M+H)+)
P2.113		656 ((M+H)+)

10

20

30

40

【表 5 7】

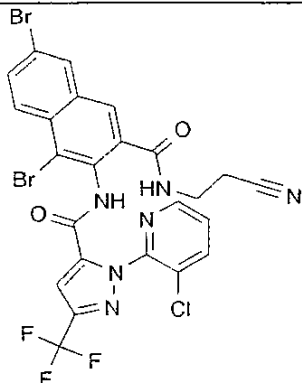
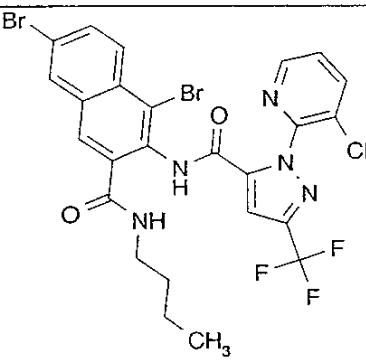
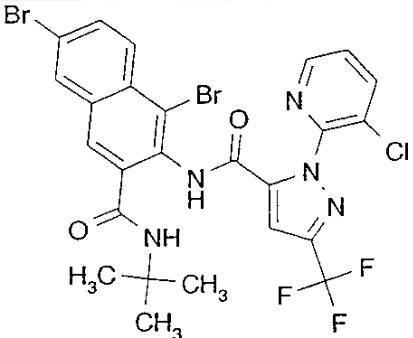
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.114 (T9.3)		660 ((M+H)+)
P2.115		670 ((M+H)+)
P2.116		670 ((M+H)+)

10

20

30

【表 5 8】

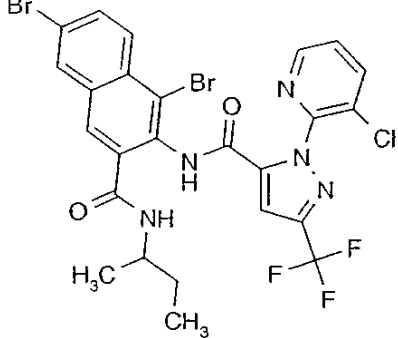
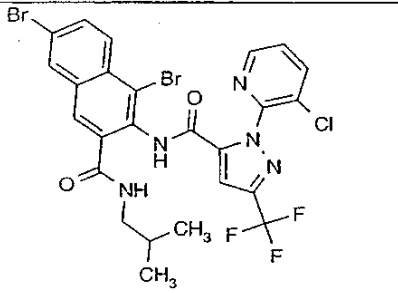
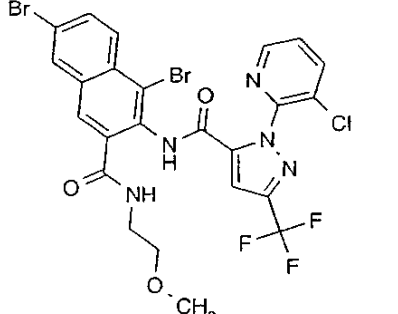
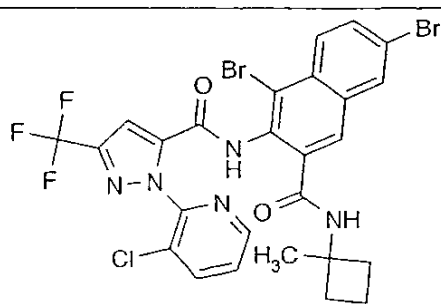
化合物 Nr.	構造	Phys. データ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.117		671 ((M+H)+)
P2.118		672 ((M+H)+)
P2.119 (T9.145)		672 ((M-1)-)

10

20

30

【表 5 9】

化合物 Nr.	構造	Phys. ̄' - (MS., NMR, M.P in °C)
P2.120		674 ((M+H)+)
P2.121		674 ((M+H)+)
P2.122		676 ((M+H)+)
P2.123		686 ((M+H)+)

10

20

30

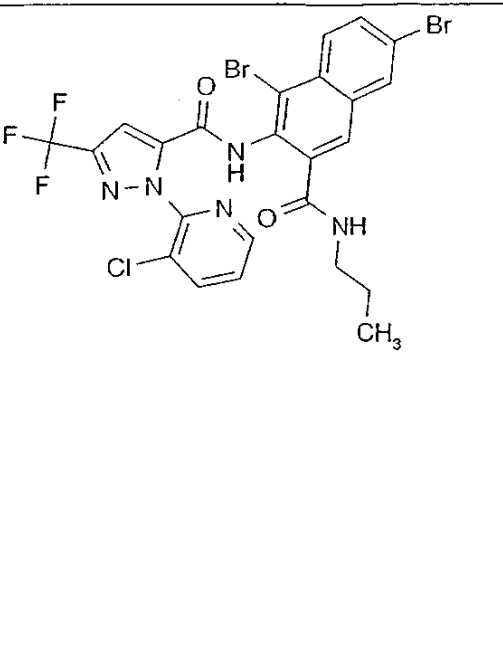
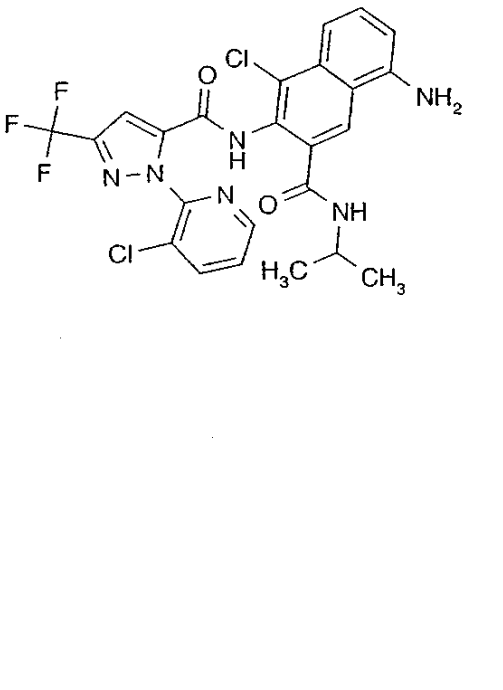
40

10

20

30

【表 6 1】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\nu}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.127		0.82-0.86 (t, 3H), 1.37-1.46 (m, 2H), 3.07-3.12 (m, 2H), 7.64-7.66 (m, 1H), 7.87-7.89 (dd, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.13-8.15 (d, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.41-8.42 (d, 1H), 8.48 (br, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H)
P2.128		1.07-7.08 (d, 6H), 3.90-3.97 (m, 1H), 6.10 (br s, 2H), 6.79-6.80 (d, 1H) 7.33-7.35 (d, 1H), 7.39-7.43 (m, 1H), 7.63-7.66 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.00-8.02 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H), 10.67 (s, 1H)

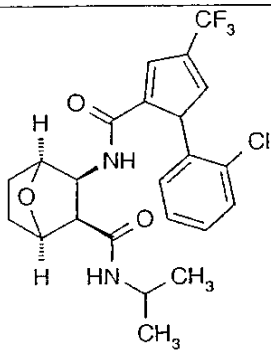
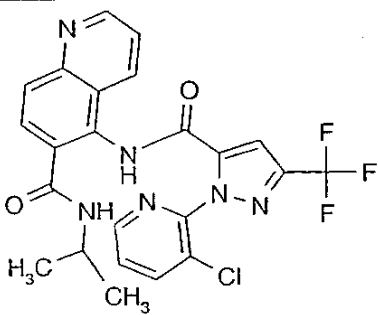
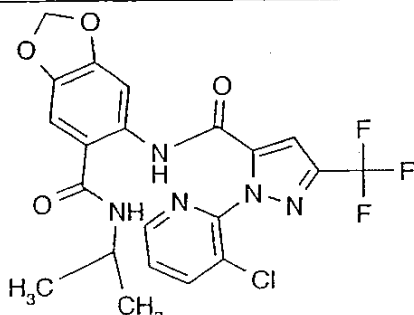
10

20

30

40

【表 6 2】

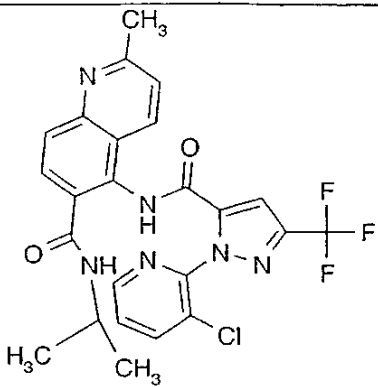
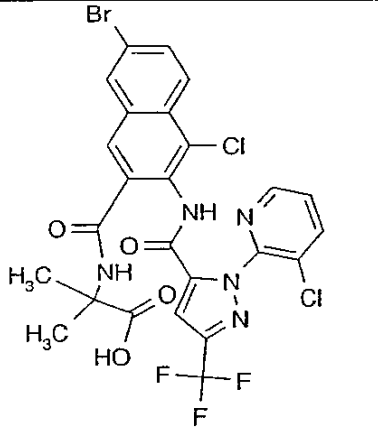
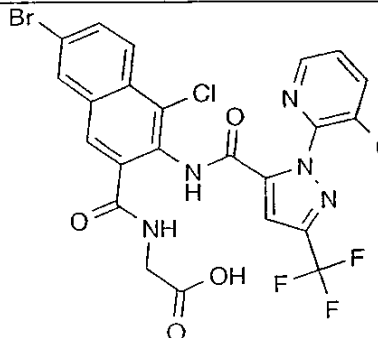
化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\nu}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
		1H)
P2.129 (T85.3)		220-224°C
P2.130		503 ((M+H)+)
P2.131 (T84.3)		496 ((M+H)+)

10

20

30

【表 6 3】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\tau}$ - \bar{t} (MS., NMR, M.P in °C)
P2.132		517 ((M+H)+)
P2.133		658 ((M+H)+)
P2.134		630 ((M+H)+)

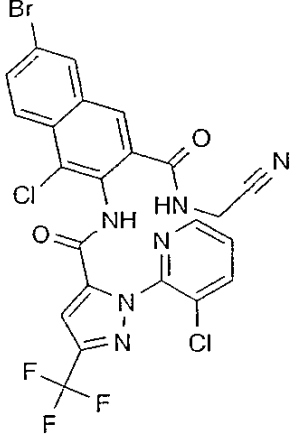
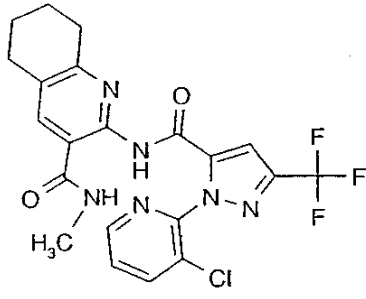
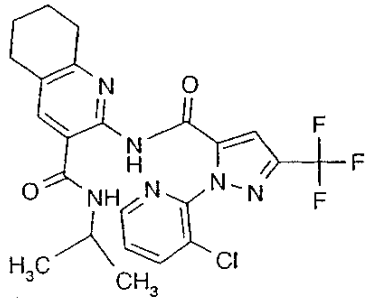
10

20

30

40

【表 6 4】

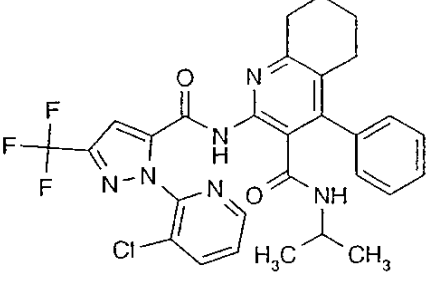
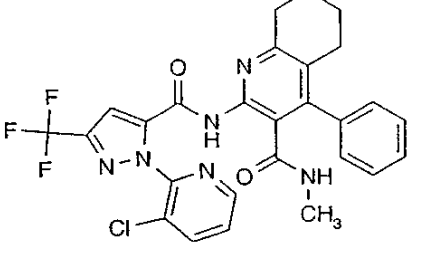
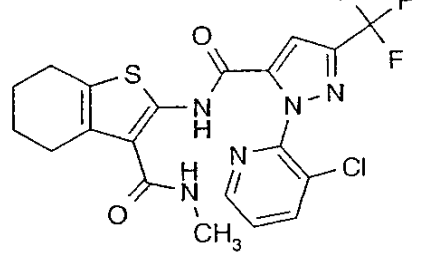
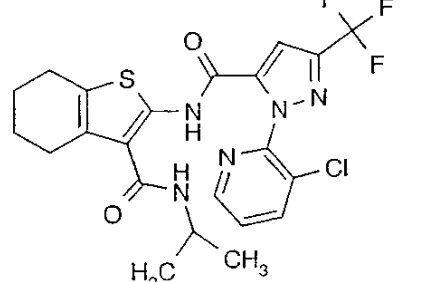
化合物Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.135		611 ((M+H)+)
P2.136 (T50.1)		145-147 °C
P2.137 (T50.3)		143-145 °C

10

20

30

【表 6 5】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\gamma}$ - δ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.138 (T51.3)		146-148 °C
P2.139 (T51.1)		165-168 °C
P2.140 (T46.1)		261-263 °C
P2.141 (T46.1)		246-248 °C

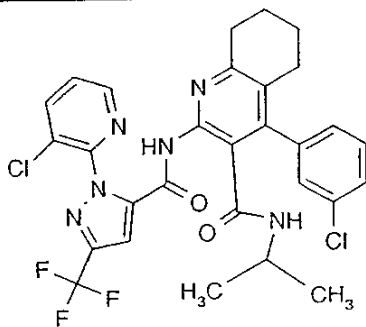
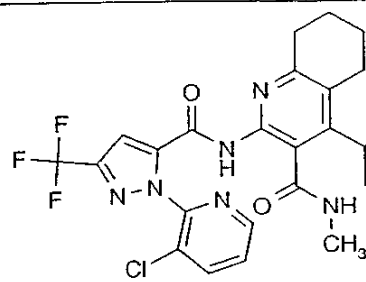
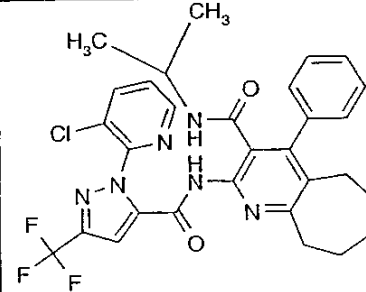
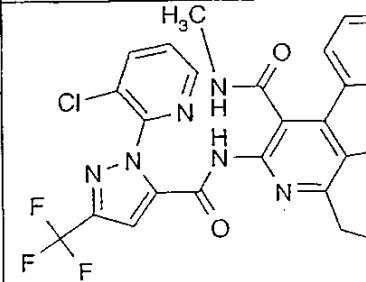
10

20

30

40

【表 6 6】

化合物 Nr.	構造	Phys. $\bar{\tau} - \delta$ (MS., NMR, M.P in °C)
P2.142 (T53.3)		259-260 °C
P2.143 (T53.1)		183-185 °C
P2.144 (T52.3)		269-270 °C
P2.145 (T52.1)		211-213 °C

10

20

30

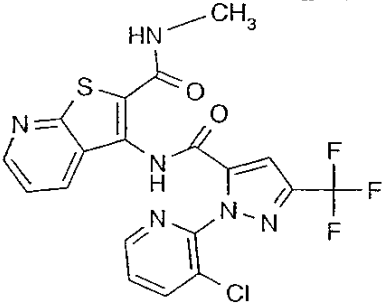
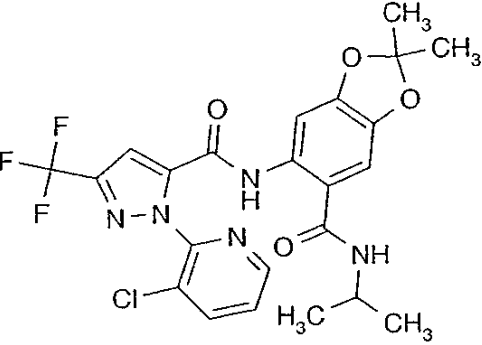
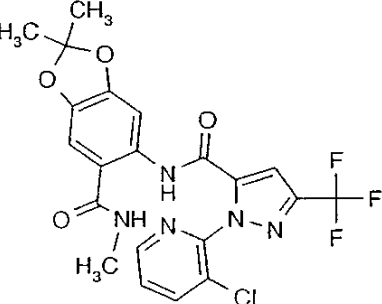
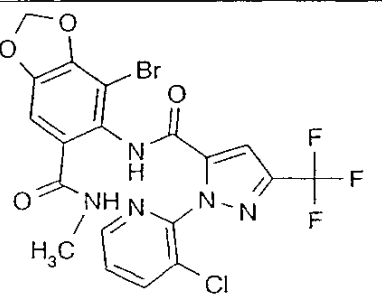
40

10

20

30

【表 6 8】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.149		253-255 °C
P2.150		284-286 °C
P2.151		273-275 °C
P2.152		255-257 °C

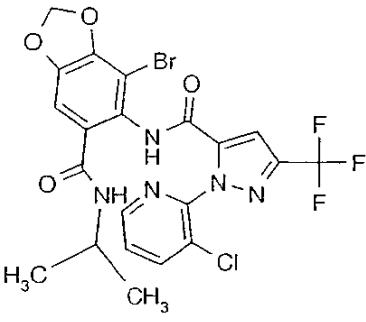
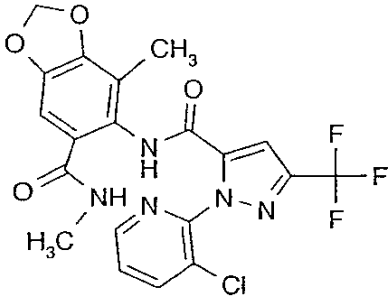
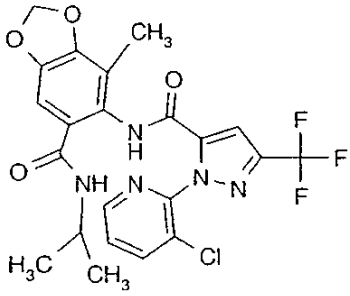
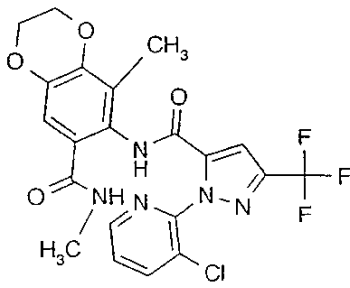
10

20

30

40

【表 6 9】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.153		274-276 °C
P2.154		255-257 °C
P2.155		267-270 °C
P2.156		265-267 °C

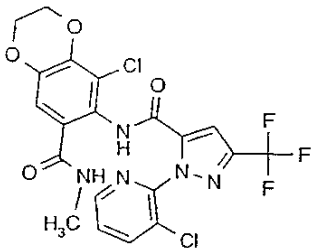
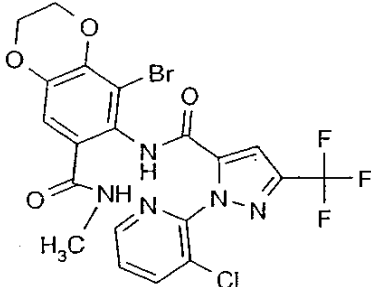
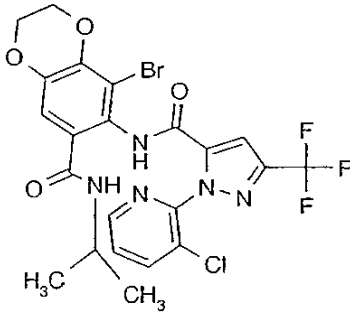
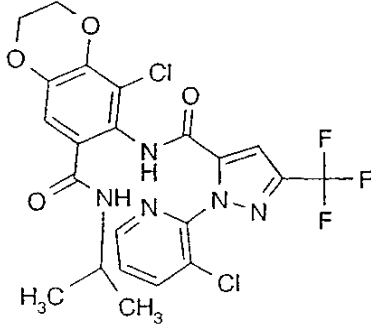
10

20

30

40

【表 7 0】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.157 (T57.1)		257-259 °C
P2.158		253-255 °C
P2.159		274-276 °C
P2.160 (T57.3)		265-267 °C

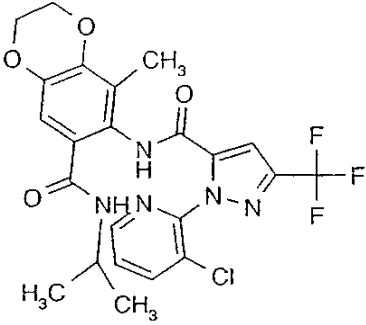
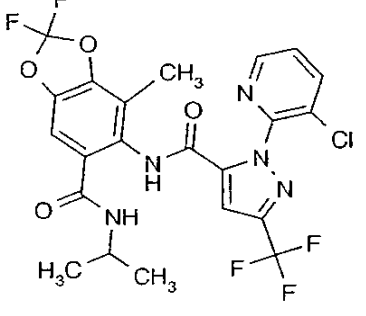
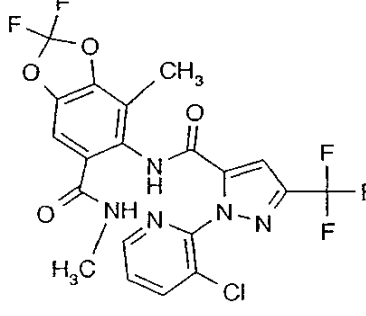
10

20

30

40

【表 7 1】

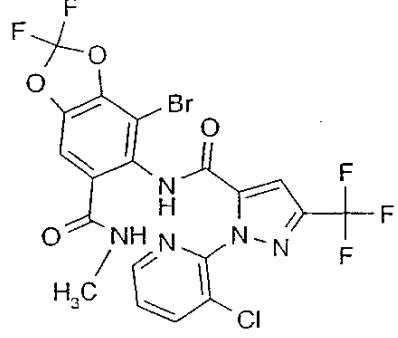
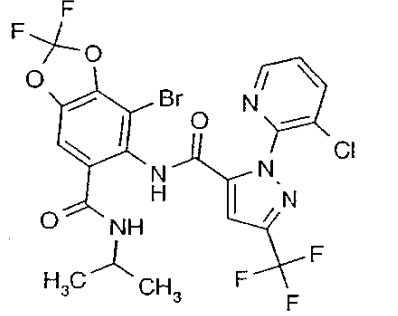
化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.161		265-267 °C
P2.162		254-255 °C
P2.163		272-274 °C

10

20

30

【表 7 2】

化合物 Nr.	構造	Phys. 特性 (MS., NMR, M.P in °C)
P2.164		234-236 °C
P2.165		284-286 °C

10

20

【 0 1 9 5 】

実施例 P11

表 1 ~ 8 5 に挙げた他の化合物は、実施例 P1 ~ P10 に発表した手順と同様の方法で調製
することができる。

30

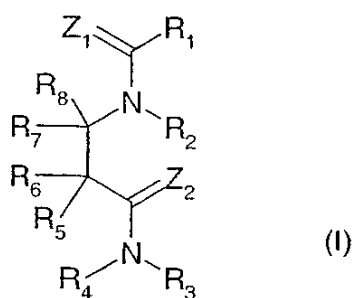
【 0 1 9 6 】

表Aは、式 I の化合物中の基 (variable) Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 を意味する338個を
開示する。

【 0 1 9 7 】

表 A

【化 2 6】

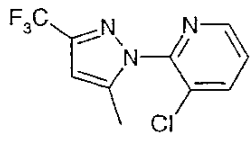
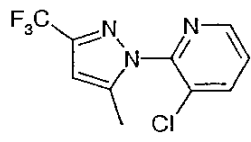
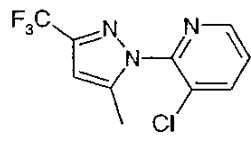
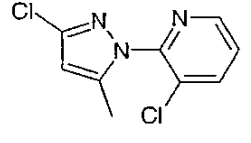
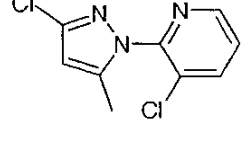
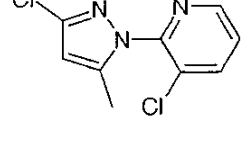
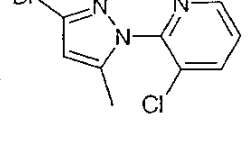


40

【 0 1 9 8 】

50

【表 7 3】



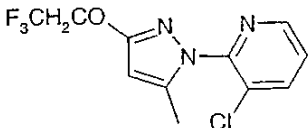
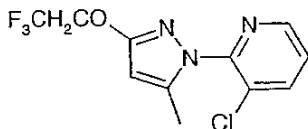
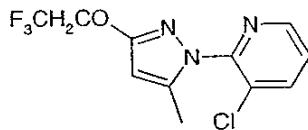
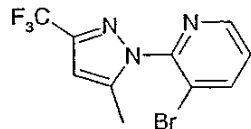
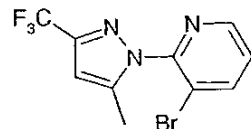
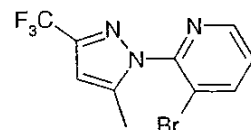
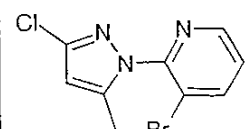
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.1	O	O		H	H	CH ₃
A.2	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.3	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.4	O	O		H	H	CH ₃
A.5	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.6	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.7	O	O		H	H	CH ₃

10

20

30

【表 7 4】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.8	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.9	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.10	O	O		H	H	CH ₃
A.11	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.12	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.13	O	O		H	H	CH ₃
A.14	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.15	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16	O	O		H	H	CH ₃

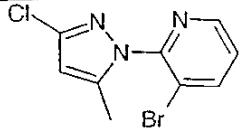
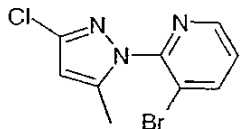
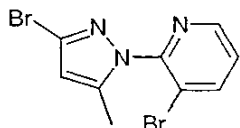
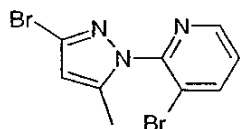
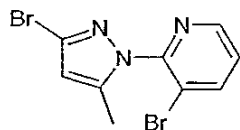
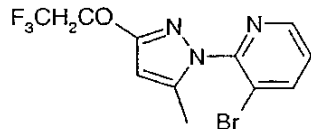
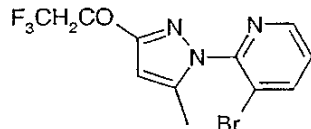
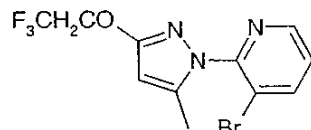
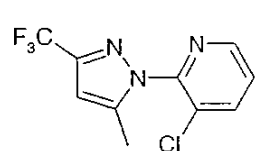
10

20

30

40

【表 7 5】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.17	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19	O	O		H	H	CH ₃
A.20	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.21	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.22	O	O		H	H	CH ₃
A.23	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.24	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.25	S	S		H	H	CH ₃

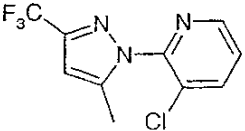
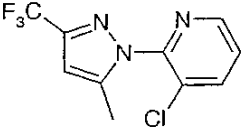
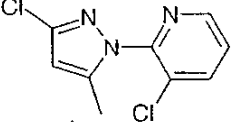
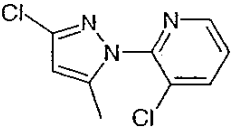
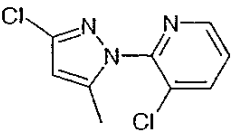
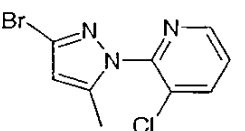
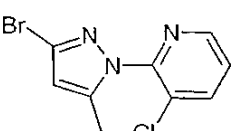
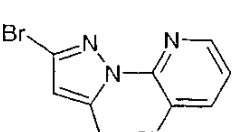
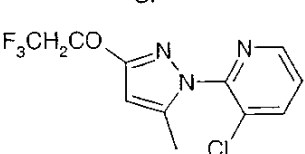
10

20

30

40

【表 7 6】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.26	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.27	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.28	S	S		H	H	CH ₃
A.29	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.30	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.31	S	S		H	H	CH ₃
A.32	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.33	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.34	S	S		H	H	CH ₃

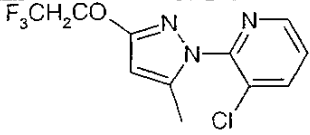
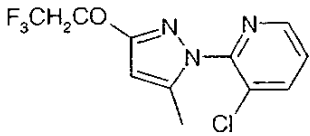
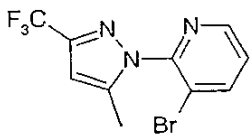
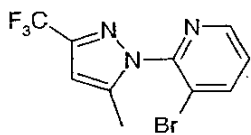
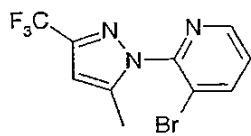
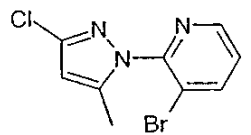
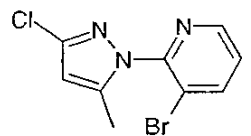
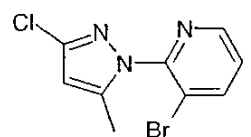
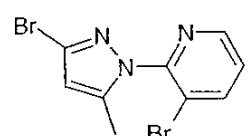
10

20

30

40

【表 7 7】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.35	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.36	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.37	S	S		H	H	CH ₃
A.38	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.39	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.40	S	S		H	H	CH ₃
A.41	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.42	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.43	S	S		H	H	CH ₃

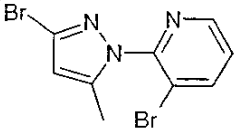
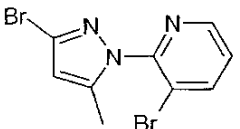
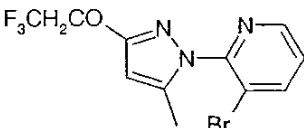
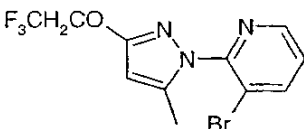
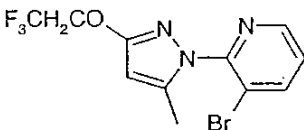
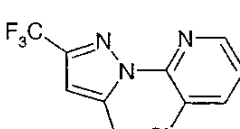
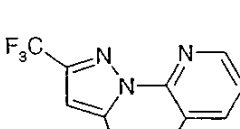
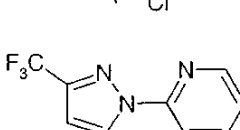
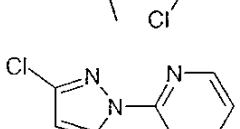
10

20

30

40

【表 7 8】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.44	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.45	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.46	S	S		H	H	CH ₃
A.47	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.48	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.49	O	S		H	H	CH ₃
A.50	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.51	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.52	O	S		H	H	CH ₃

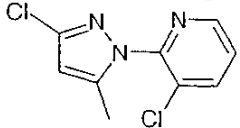
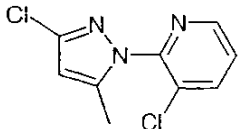
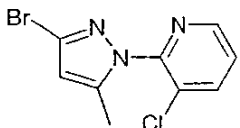
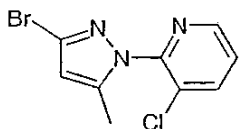
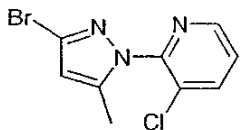
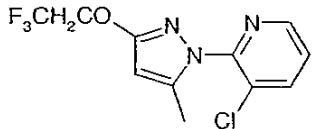
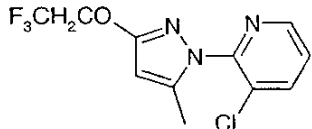
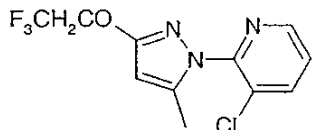
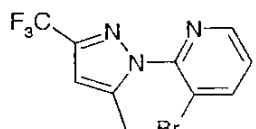
10

20

30

40

【表 7 9】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.53	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.54	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.55	O	S		H	H	CH ₃
A.56	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.57	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.58	O	S		H	H	CH ₃
A.59	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.60	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.61	O	S		H	H	CH ₃

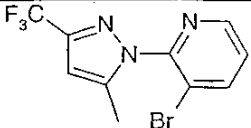
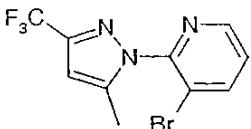
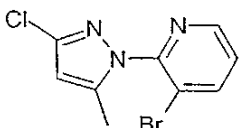
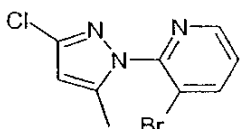
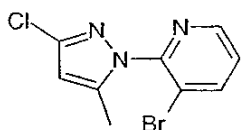
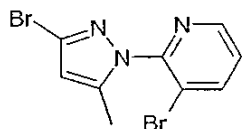

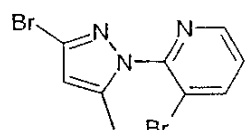
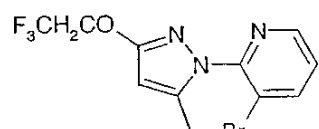
10

20

30

40

【表 80】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.62	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.63	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.64	O	S		H	H	CH ₃
A.65	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.66	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.67	O	S		H	H	CH ₃
A.68	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.69	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.70	O	S		H	H	CH ₃

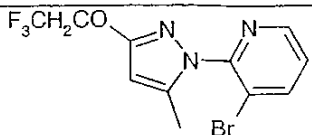
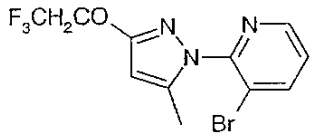
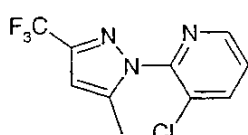
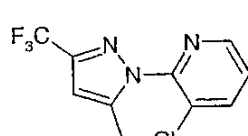
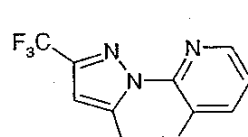
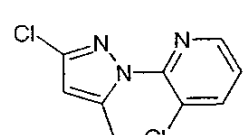
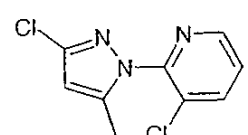
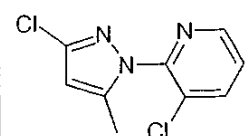
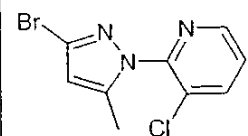
10

20

30

40

【表 8 1】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.71	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.72	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.73	S	O		H	H	CH ₃
A.74	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.75	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.76	S	O		H	H	CH ₃
A.77	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.78	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.79	S	O		H	H	CH ₃

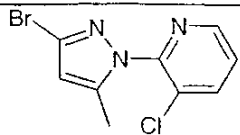
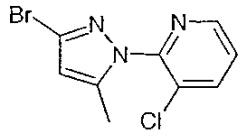
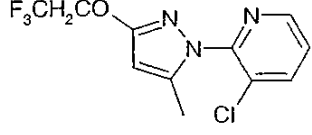
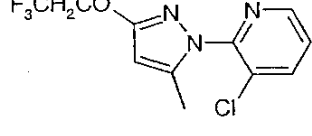
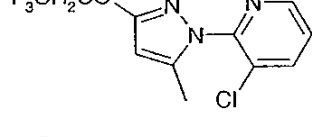
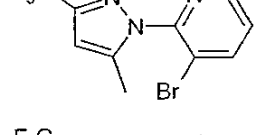
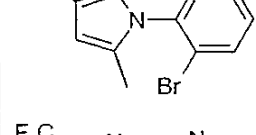
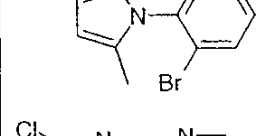
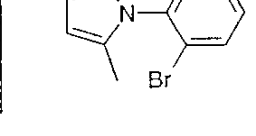
10

20

30

40

【表 8 2】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.80	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.81	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.82	S	O		H	H	CH ₃
A.83	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.84	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.85	S	O		H	H	CH ₃
A.86	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.87	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.88	S	O		H	H	CH ₃

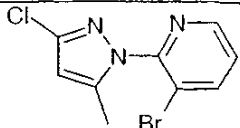

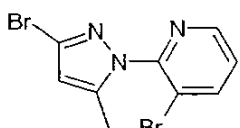


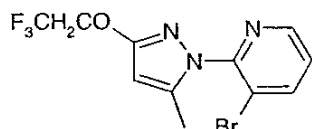
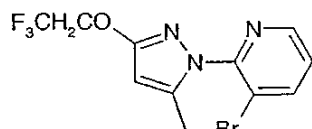
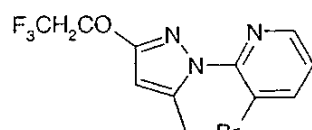
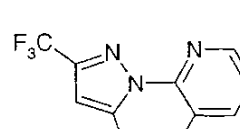
10

20

30

40

【表 8 3】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.89	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.90	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.91	S	O		H	H	CH ₃
A.92	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.93	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.94	S	O		H	H	CH ₃
A.95	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.96	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.97	O	O		CH ₃	H	CH ₃

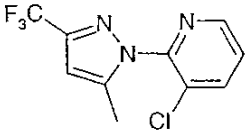
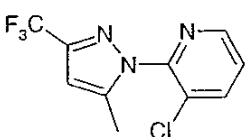
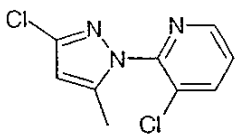
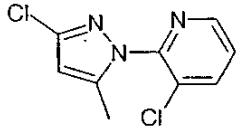
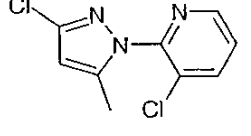
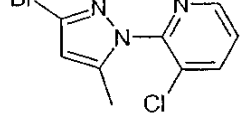
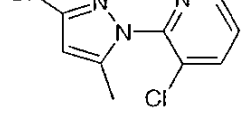
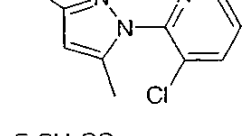
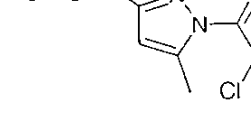
10

20

30

40

【表 8 4】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.98	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.99	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.100	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.101	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.102	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.103	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.104	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.105	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.106	O	O		CH ₃	H	CH ₃

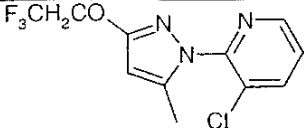
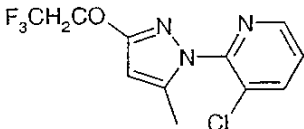
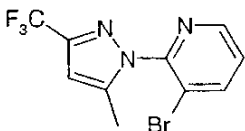
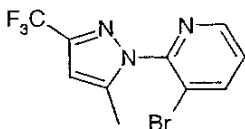
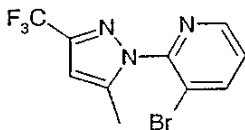
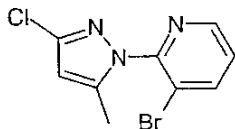
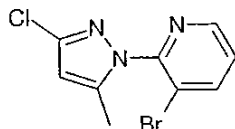
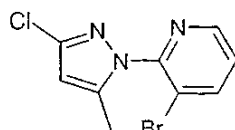
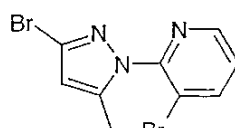
10

20

30

40

【表 8 5】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.107	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.108	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.109	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.110	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.111	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.112	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.113	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.114	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.115	O	O		CH ₃	H	CH ₃

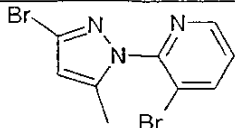
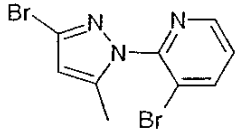
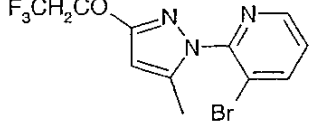
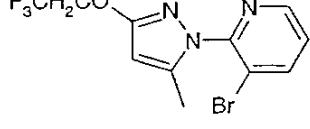
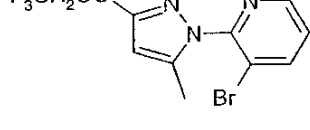
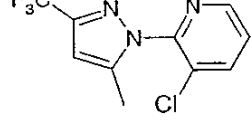
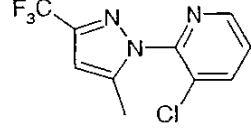
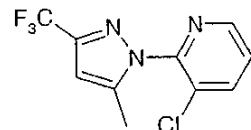

10

20

30

40

【表 8 6】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.116	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.117	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.118	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.119	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.120	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.121	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.122	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.123	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.124	O	O		H	CH ₃	CH ₃

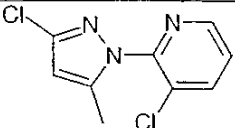
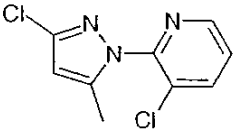
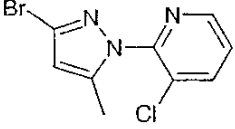
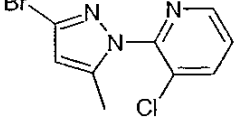
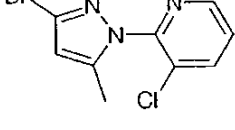
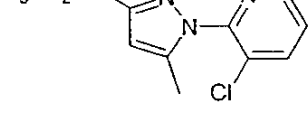
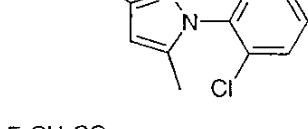
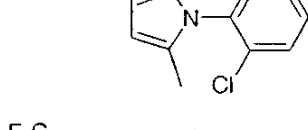
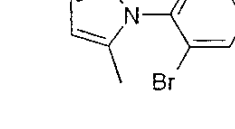
10

20

30

40

【表 8 7】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.125	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.126	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.127	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.128	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.129	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.130	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.131	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.132	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.133	O	O		H	CH ₃	CH ₃

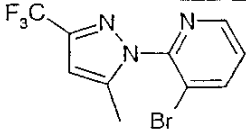
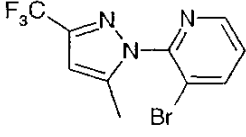
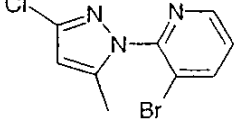
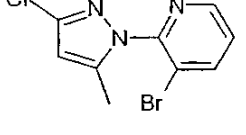
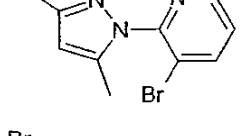
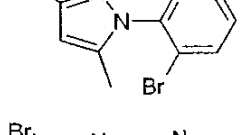
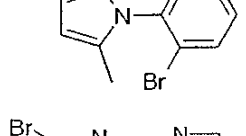
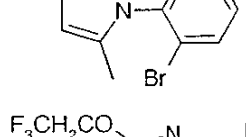
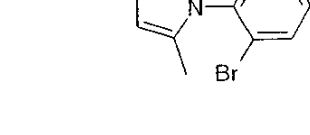
10

20

30

40

【表 8 8】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.134	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.135	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.136	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.137	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.138	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.139	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.140	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.141	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.142	O	O		H	CH ₃	CH ₃

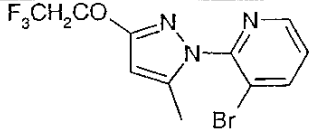
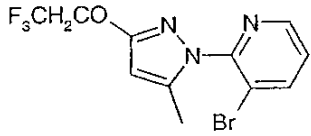
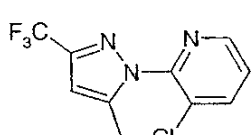
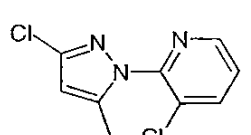
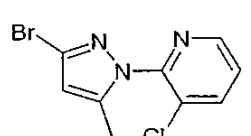
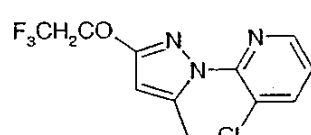
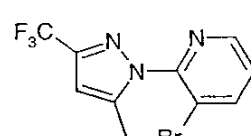
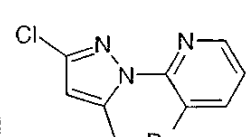
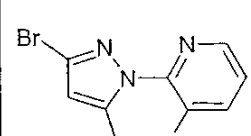
10

20

30

40

【表 8 9】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.143	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.144	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.145	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.146	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.147	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.148	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.149	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.150	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.151	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃

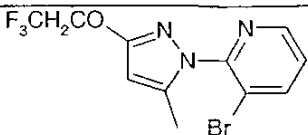
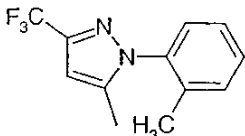
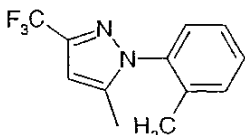
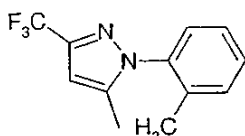
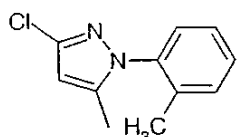
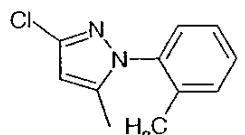
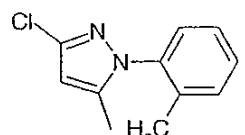
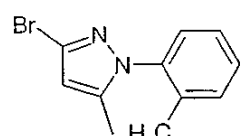
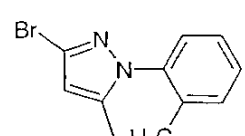
10

20

30

40

【表 90】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.152	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.153	O	O		H	H	CH ₃
A.154	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.155	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.156	O	O		H	H	CH ₃
A.157	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.158	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.159	O	O		H	H	CH ₃
A.160	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

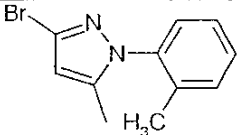
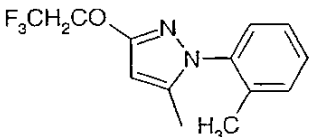
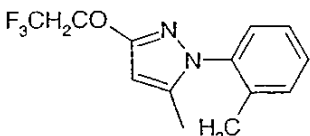
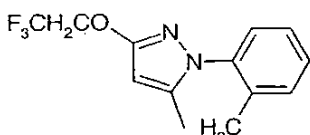
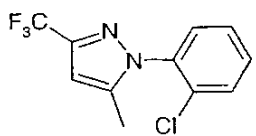
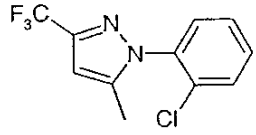
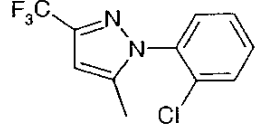
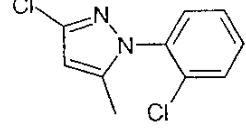
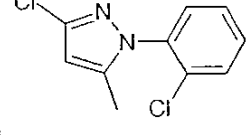
10

20

30

40

【表 9 1】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.161	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.162	O	O		H	H	CH ₃
A.163	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.164	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.165	O	O		H	H	CH ₃
A.166	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.167	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.168	O	O		H	H	CH ₃
A.169	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

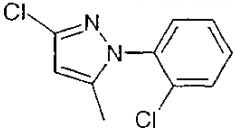

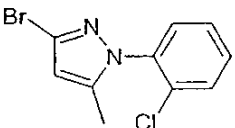
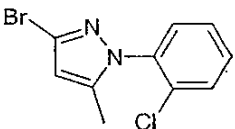
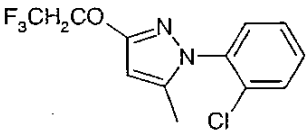
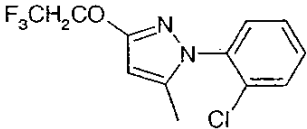
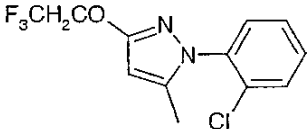
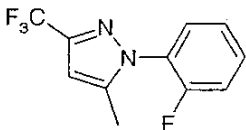
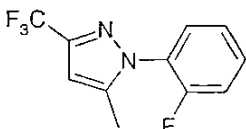
10

20

30

40

【表 9 2】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.170	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.171	O	O		H	H	CH ₃
A.172	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.173	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.174	O	O		H	H	CH ₃
A.175	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.176	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.177	O	O		H	H	CH ₃
A.178	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

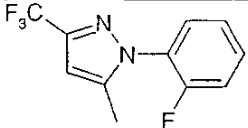
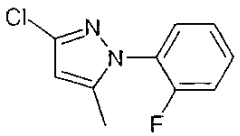
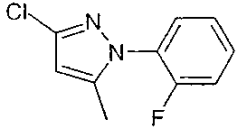
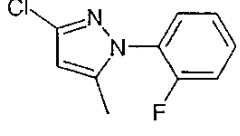
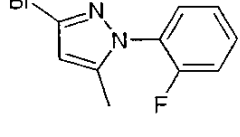
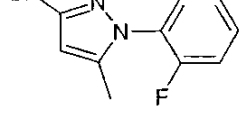
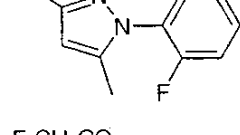
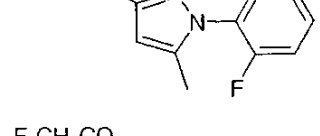
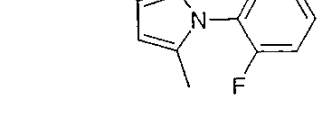
10

20

30

40

【表 9 3】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.179	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.180	O	O		H	H	CH ₃
A.181	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.182	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.183	O	O		H	H	CH ₃
A.184	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.185	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.186	O	O		H	H	CH ₃
A.187	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

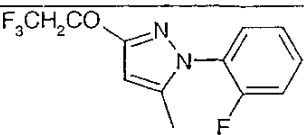
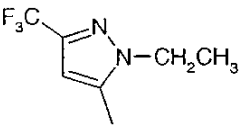
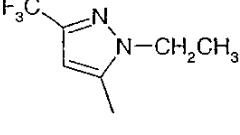
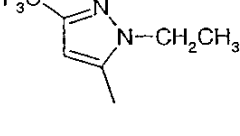
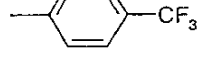
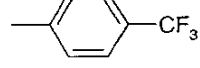
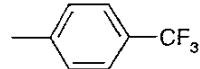
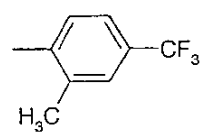
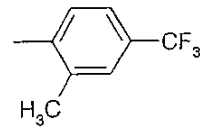
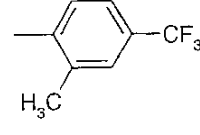
10

20

30

40

【表 9 4】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.188	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.189	O	O		H	H	CH ₃
A.190	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.191	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.192	O	O		H	H	CH ₃
A.193	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.194	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.195	O	O		H	H	CH ₃
A.196	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.197	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂

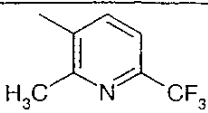
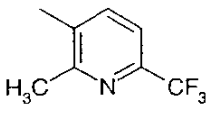
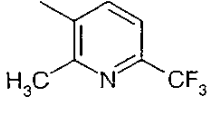
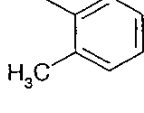
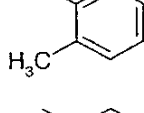
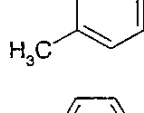
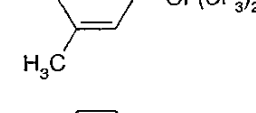
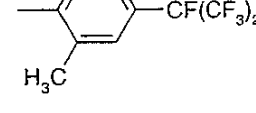
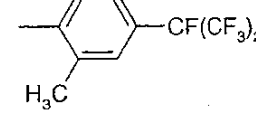
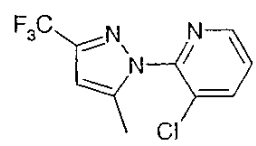
10

20

30

40

【表 9 5】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.198	O	O		H	H	CH ₃
A.199	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.200	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.201	O	O		H	H	CH ₃
A.202	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.203	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.204	O	O		H	H	CH ₃
A.205	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.206	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.207	O	O		H	H	シロア° 匹° ル

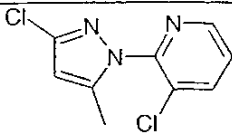
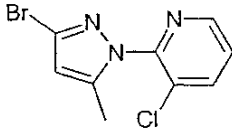
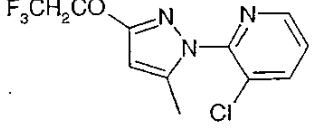
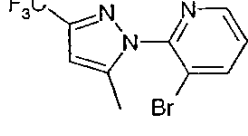
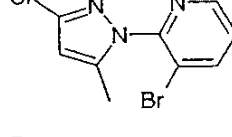
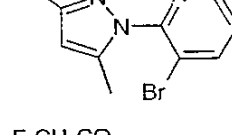
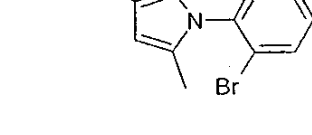
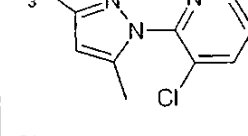
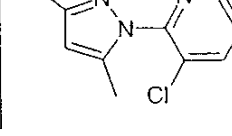
10

20

30

40

【表 9 6】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.208	O	O		H	H	シクロピリジン
A.209	O	O		H	H	シクロピリジン
A.210	O	O		H	H	シクロピリジン
A.211	O	O		H	H	シクロピリジン
A.212	O	O		H	H	シクロピリジン
A.213	O	O		H	H	シクロピリジン
A.214	O	O		H	H	シクロピリジン
A.215	S	S		H	H	シクロピリジン
A.216	S	S		H	H	シクロピリジン

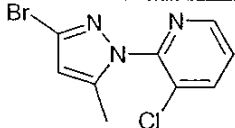
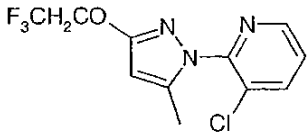
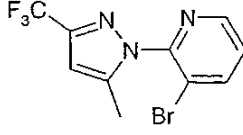
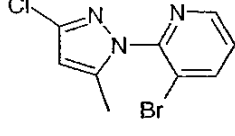
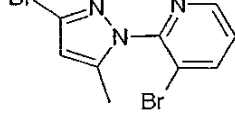
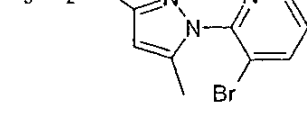
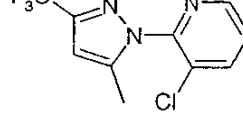
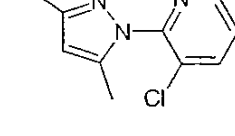
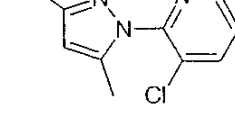
10

20

30

40

【表 9 7】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.217	S	S		H	H	シクロピリジン
A.218	S	S		H	H	シクロピリジン
A.219	S	S		H	H	シクロピリジン
A.220	S	S		H	H	シクロピリジン
A.221	S	S		H	H	シクロピリジン
A.222	S	S		H	H	シクロピリジン
A.223	O	S		H	H	シクロピリジン
A.224	O	S		H	H	シクロピリジン
A.225	O	S		H	H	シクロピリジン

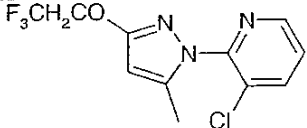
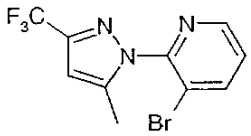
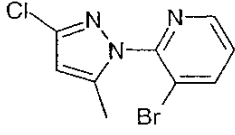
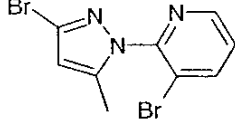
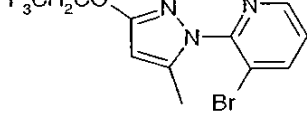
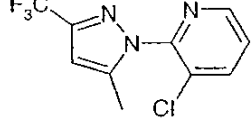
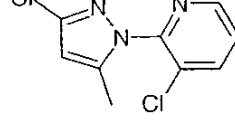
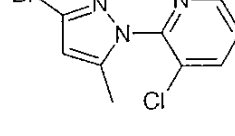
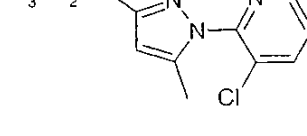
10

20

30

40

【表 9 8】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.226	O	S		H	H	シクロピリジン
A.227	O	S		H	H	シクロピリジン
A.228	O	S		H	H	シクロピリジン
A.229	O	S		H	H	シクロピリジン
A.230	O	S		H	H	シクロピリジン
A.231	S	O		H	H	シクロピリジン
A.232	S	O		H	H	シクロピリジン
A.233	S	O		H	H	シクロピリジン
A.234	S	O		H	H	シクロピリジン

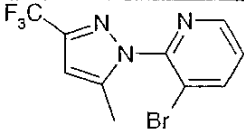
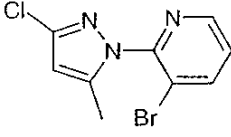
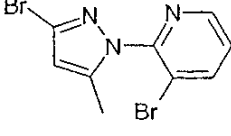
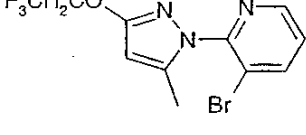
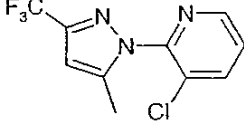

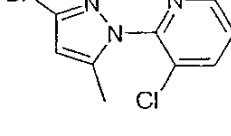
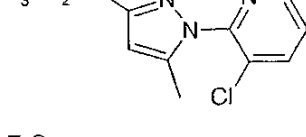
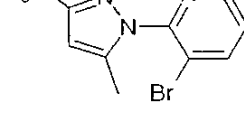
10

20

30

40

【表 9 9】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.235	S	O		H	H	シロフ° 匹° ル
A.236	S	O		H	H	シロフ° 匹° ル
A.237	S	O		H	H	シロフ° 匹° ル
A.238	S	O		H	H	シロフ° 匹° ル
A.239	O	O		CH ₃	H	シロフ° 匹° ル
A.240	O	O		CH ₃	H	シロフ° 匹° ル
A.241	O	O		CH ₃	H	シロフ° 匹° ル
A.242	O	O		CH ₃	H	シロフ° 匹° ル
A.243	O	O		CH ₃	H	シロフ° 匹° ル

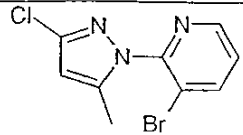
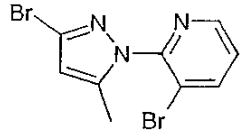
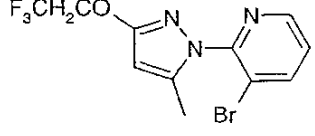
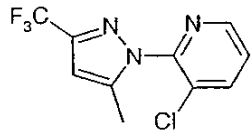
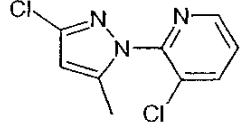
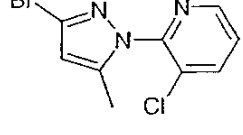
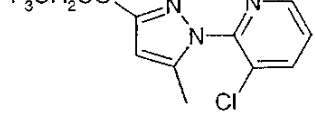
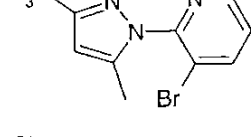
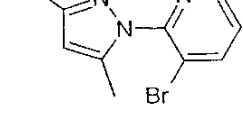
10

20

30

40

【表 100】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.244	O	O		CH ₃	H	シクロ [°] ピ [°] ル
A.245	O	O		CH ₃	H	シクロ [°] ピ [°] ル
A.246	O	O		CH ₃	H	シクロ [°] ピ [°] ル
A.247	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル
A.248	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル
A.249	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル
A.250	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル
A.251	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル
A.252	O	O		H	CH ₃	シクロ [°] ピ [°] ル

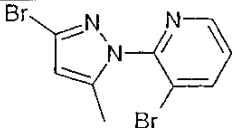
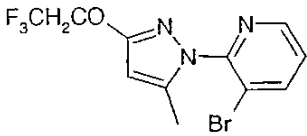
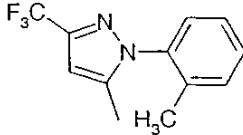
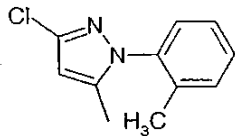
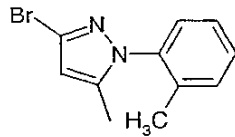
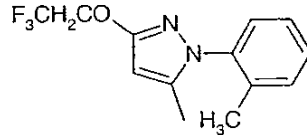
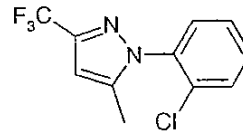
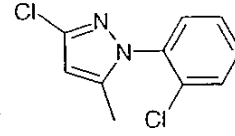
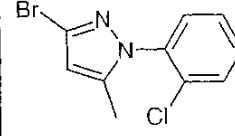
10

20

30

40

【表 101】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.253	O	O		H	CH ₃	シクロピリジン
A.254	O	O		H	CH ₃	シクロピリジン
A.255	O	O		H	H	シクロピリジン
A.256	O	O		H	H	シクロピリジン
A.257	O	O		H	H	シクロピリジン
A.258	O	O		H	H	シクロピリジン
A.259	O	O		H	H	シクロピリジン
A.260	O	O		H	H	シクロピリジン
A.261	O	O		H	H	シクロピリジン

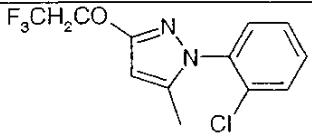
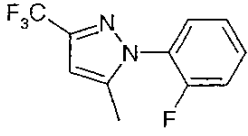
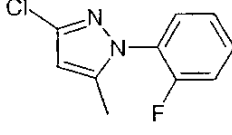
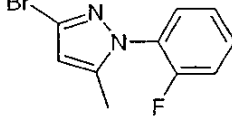
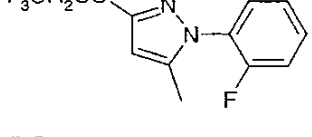
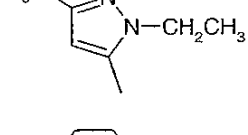
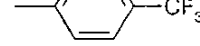
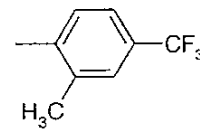
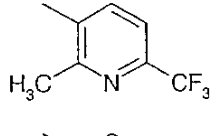
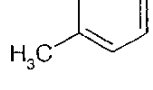
10

20

30

40

【表 102】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.262	O	O		H	H	シクロピペリル
A.263	O	O		H	H	シクロピペリル
A.264	O	O		H	H	シクロピペリル
A.265	O	O		H	H	シクロピペリル
A.266	O	O		H	H	シクロピペリル
A.267	O	O		H	H	シクロピペリル
A.268	O	O		H	H	シクロピペリル
A.269	O	O		H	H	シクロピペリル
A.270	O	O		H	H	シクロピペリル
A.271	O	O		H	H	シクロピペリル

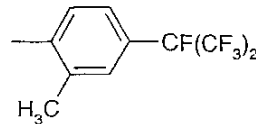
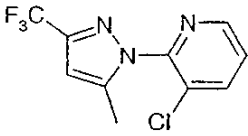
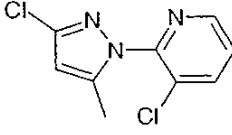
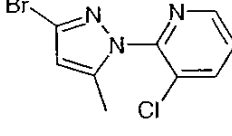
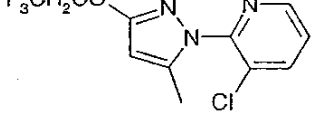
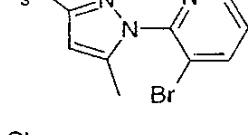
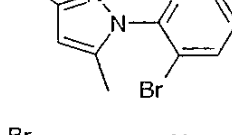
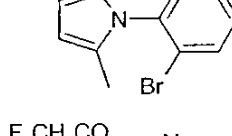
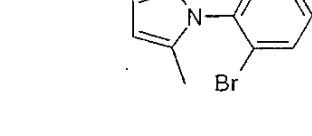
10

20

30

40

【表 103】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.272	O	O		H	H	シロリ° 匹° ル
A.273	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.274	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.275	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.276	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.277	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.278	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.279	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.280	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

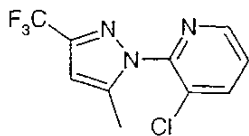
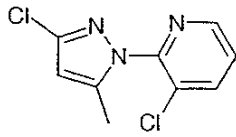
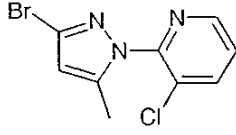
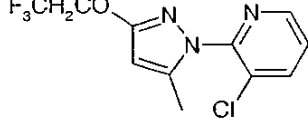
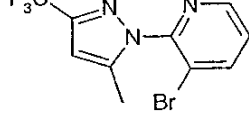
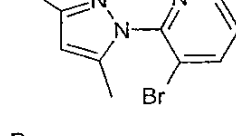
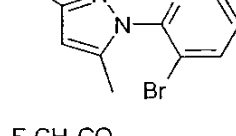
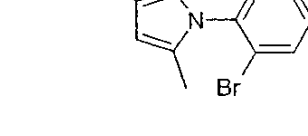
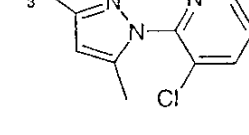
10

20

30

40

【表 104】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.281	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.282	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.283	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.284	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.285	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.286	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.287	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.288	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.289	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

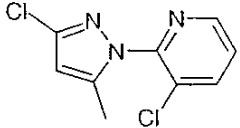

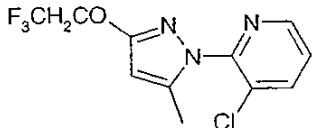
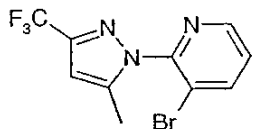
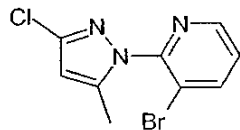
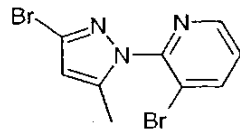
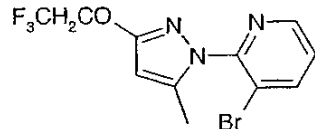
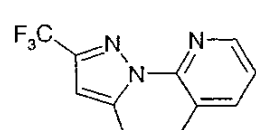
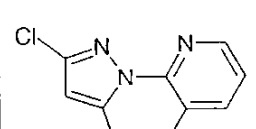
10

20

30

40

【表 105】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.290	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.291	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.292	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.293	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.294	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.295	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.296	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.297	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.298	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

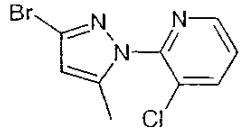
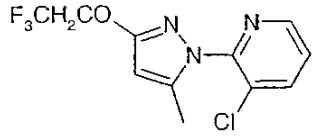
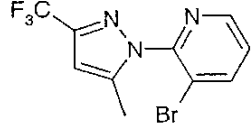
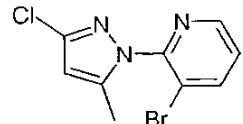
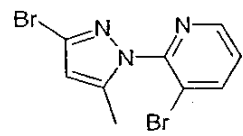
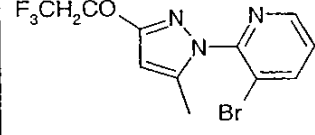
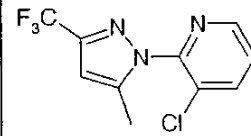
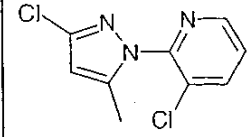
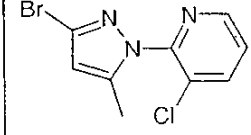
10

20

30

40

【表 106】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.299	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.300	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.301	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.302	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.303	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.304	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.305	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.306	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.307	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

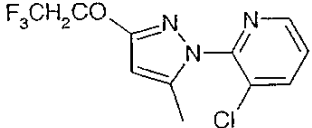
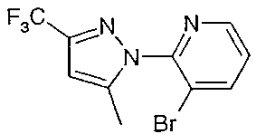
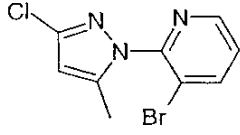
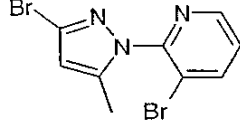
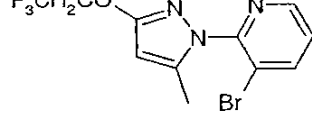
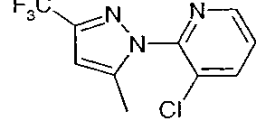
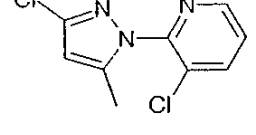
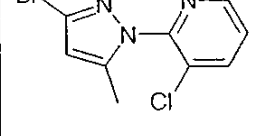
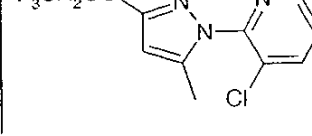
10

20

30

40

【表 107】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.308	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.309	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.310	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.311	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.312	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.313	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.314	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.315	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.316	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

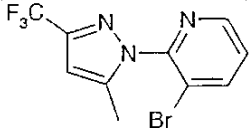
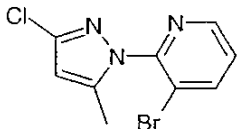

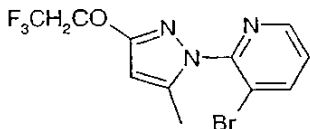
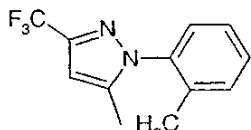
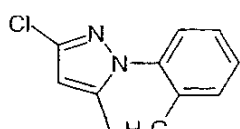
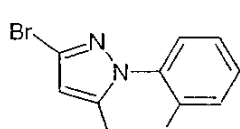
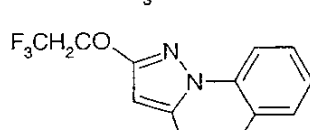
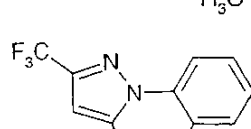
10

20

30

40

【表 108】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.317	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.318	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.319	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.320	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.321	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.322	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.323	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.324	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.325	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

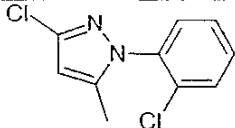
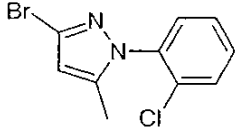
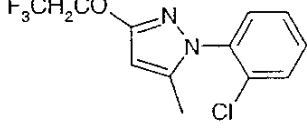
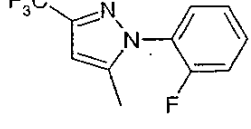

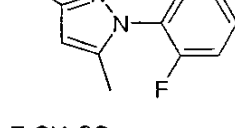
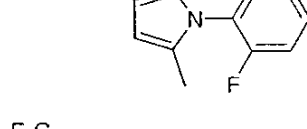
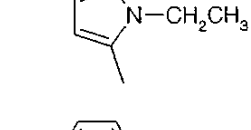
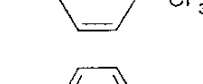
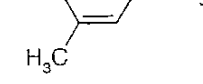
10

20

30

40

【表 109】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.326	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.327	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.328	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.329	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.330	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.331	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.332	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.333	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.334	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.335	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

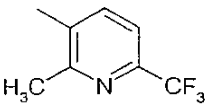
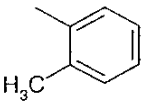
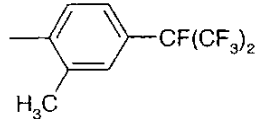
10

20

30

40

【表 1 1 0】

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.336	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.337	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.338	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

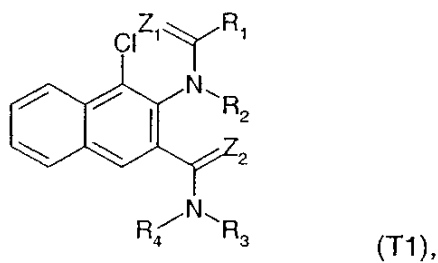
10

【 0 1 9 9 】

表 1：この表は式

【化 2 7】

20



30

の338個の化合物T1.1～T1.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 0 】

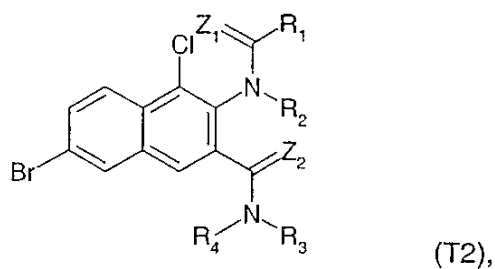
例えば、特定の化合物T1.23は、式T1の化合物であり、ここでそれぞれの基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄は表Aの行A.23で与えられる特別な意味を有する。同一の系に従い、更に他の337の特定の化合物の全てを表 1で開示し、並びに表 2～85に開示した全ての特定の化合物を同様に特定する。

【 0 2 0 1 】

表 2：この表は式

40

【化 2 8】



10

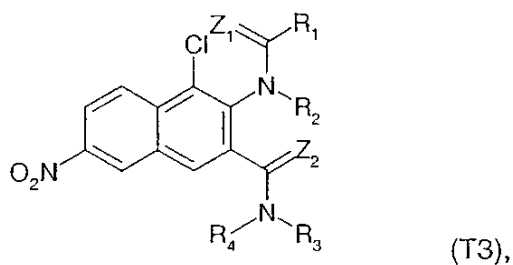
の338個の化合物T2.2 ~ T2.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1 ~ A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 2】

表 3：この表は式

【化 2 9】



20

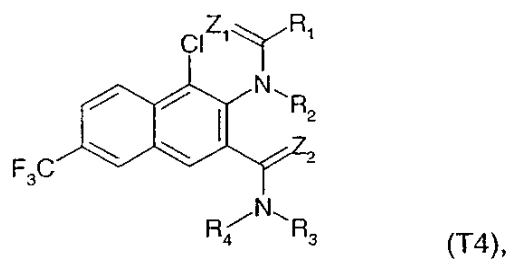
の338個の化合物T3.1 ~ T3.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1 ~ A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 3】

表 4：この表は式

【化 3 0】



40

の338個の化合物T4.1 ~ T4.338 を開示し、

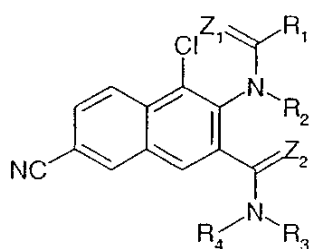
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1 ~ A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 4】

表 5：この表は式

50

【化 3 1】



(T5),

10

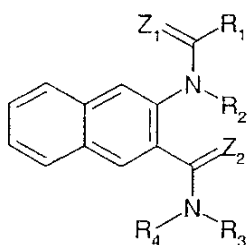
の338個の化合物T5.1～T5.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 5】

表 6：この表は式

【化 3 2】



(T6),

20

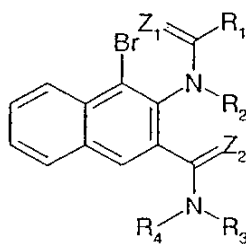
の338個の化合物T6.1～T6.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 6】

表 7：この表は式

【化 3 3】



(T7),

40

の338個の化合物T7.1～T7.338 を開示し、

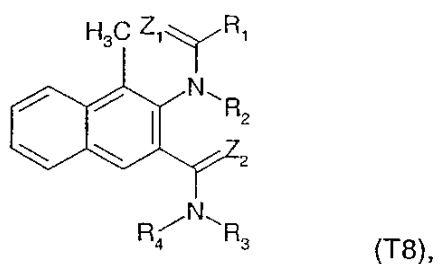
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 7】

表 8：この表は式

50

【化 3 4】



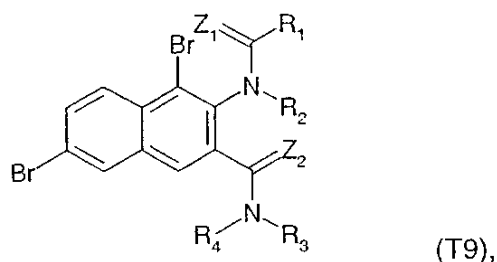
10

の338個の化合物T8.1～T8.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 0 8】

表 9：この表は式

【化 3 5】



20

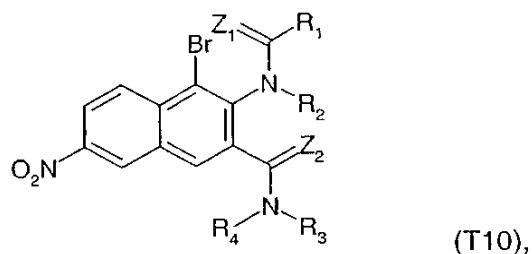
の338個の化合物T9.1～T9.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

30

【 0 2 0 9】

表 10：この表は式

【化 3 6】



40

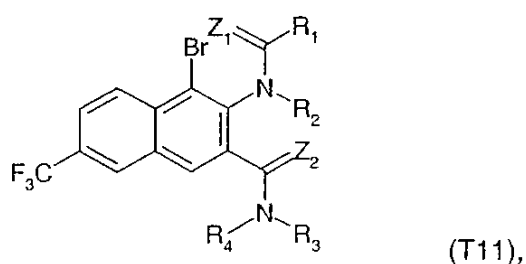
の338個の化合物T10.1～T10.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 0】

表 11：この表は式

50

【化 3 7】



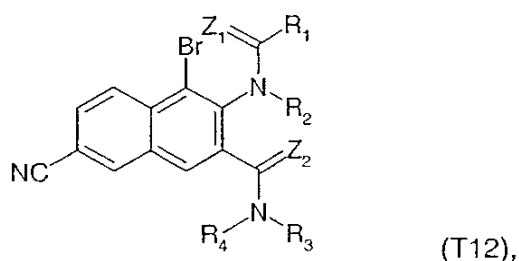
10

の338個の化合物T11.1～T11.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 1】

表 12：この表は式

【化 3 8】



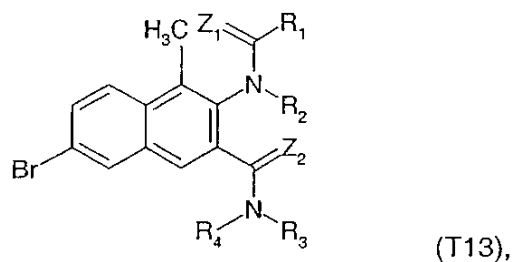
20

の338個の化合物T12.1～T12.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 2】

表 13：この表は式

【化 3 9】



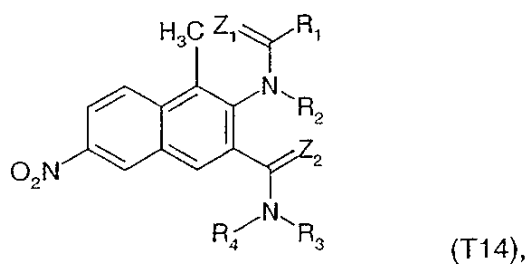
40

の338個の化合物T13.1～T13.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 3】

50

表 14：この表は式
【化 4 0】

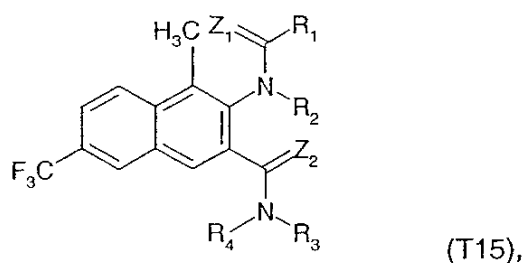


10

の338個の化合物T14.1～T14.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 4 】

表 15：この表は式
【化 4 1】

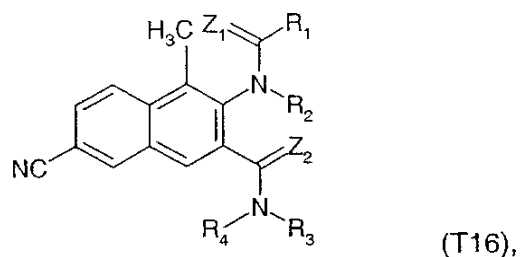


20

の338個の化合物T15.1～T15.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 5 】

表 16：この表は式
【化 4 2】



30

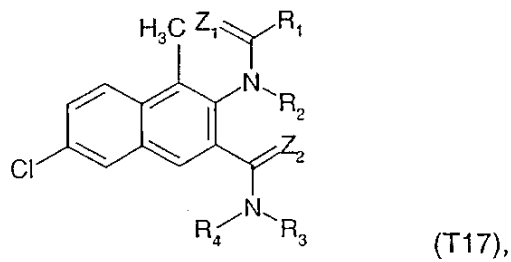
40

の338個の化合物T16.1～T16.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 6 】

50

表 17：この表は式
【化 4 3】

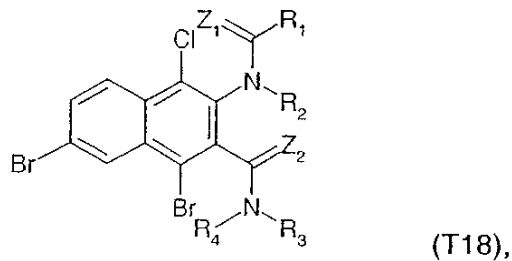


10

の338個の化合物T17.1～T17.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 7 】

表 18：この表は式
【化 4 4】

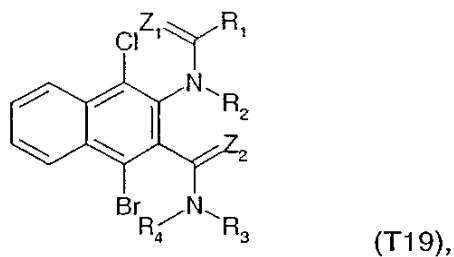


20

の338個の化合物T18.1～T18.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 8 】

表 19：この表は式
【化 4 5】



30

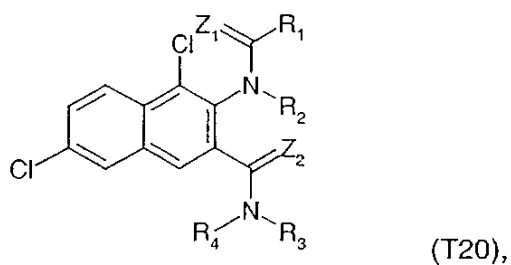
の338個の化合物T19.1～T19.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 1 9 】

40

50

表 20：この表は式
【化 4 6】

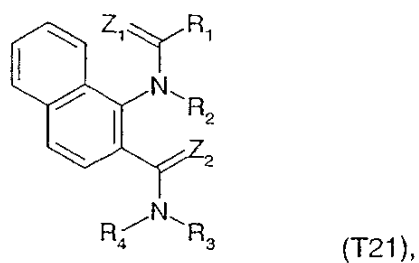


10

の338個の化合物T20.1～T20.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 2 0 】

表 21：この表は式
【化 4 7】

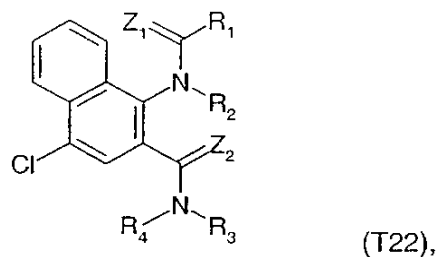


20

の338個の化合物T21.1～T21.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 2 1 】

表 22：この表は式
【化 4 8】



30

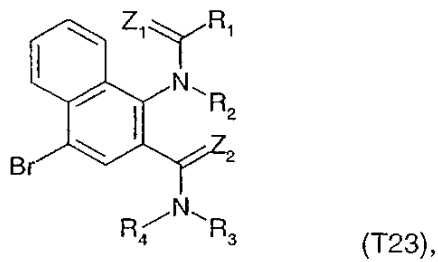
40

の338個の化合物T22.1～T22.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 2 2 】

50

表 23：この表は式
【化 4 9】

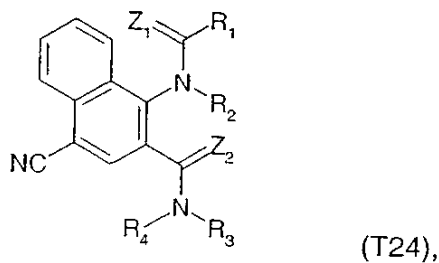


10

の338個の化合物T23.1～T23.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 2 3】

表 24：この表は式
【化 5 0】

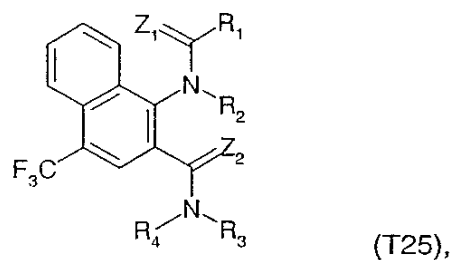


20

の338個の化合物T24.1～T24.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 2 4】

表 25：この表は式
【化 5 1】



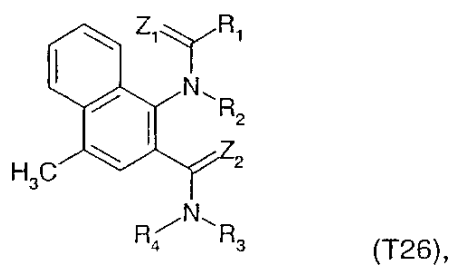
40

の338個の化合物T25.1～T25.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 2 5】

50

表 26：この表は式
【化 5 2】

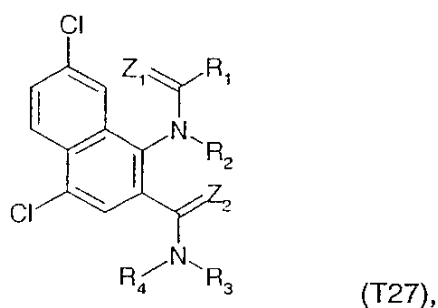


10

の338個の化合物T26.1～T26.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 2 6】

表 27：この表は式
【化 5 3】

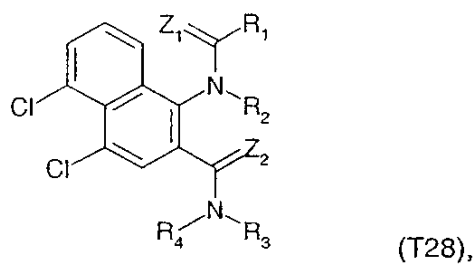


20

の338個の化合物T27.1～T27.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 2 7】

表 28：この表は式
【化 5 4】



30

40

の338個の化合物T28.1～T28.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で

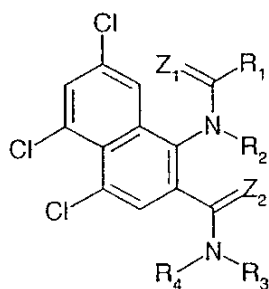
50

与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 2 8 】

表 29：この表は式

【 化 5 5 】



(T29),

10

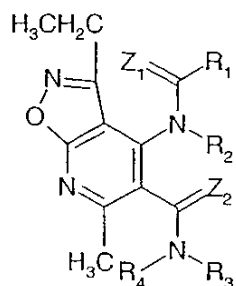
の338個の化合物T29.1～T29.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 2 9 】

表 30：この表は式

【 化 5 6 】



(T30),

30

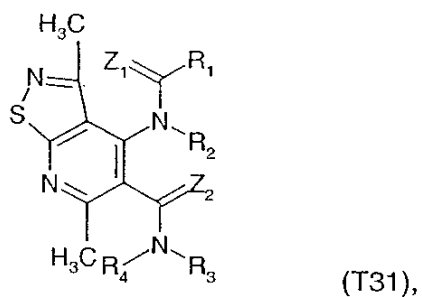
の338個の化合物T30.1～T30.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 0 】

表 31：この表は式

【化 5 7】



10

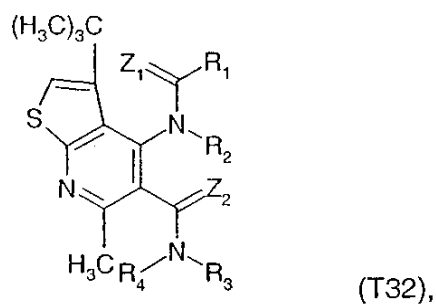
の338個の化合物T31.1～T31.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 1】

表 32：この表は式

【化 5 8】



20

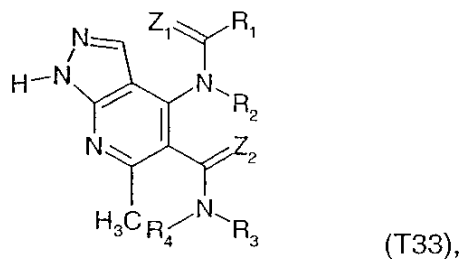
の338個の化合物T32.1～T32.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 2】

表 33：この表は式

【化 5 9】



40

の338個の化合物T33.1～T33.338 を開示し、

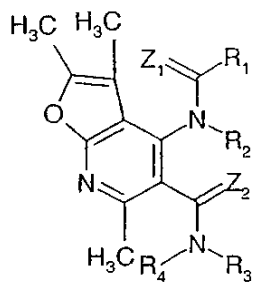
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

50

【 0 2 3 3 】

表 34：この表は式

【 化 6 0 】



(T34),

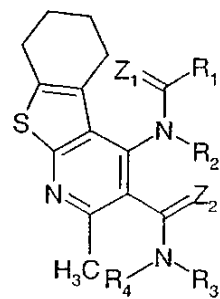
10

の338個の化合物T34.1～T34.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 4 】

表 35：この表は式

【 化 6 1 】



(T35),

20

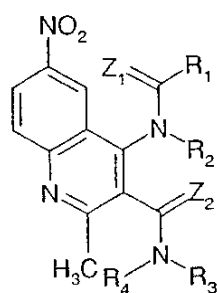
30

の338個の化合物T35.1～T35.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 5 】

表 36：この表は式

【化 6 2】



(T36),

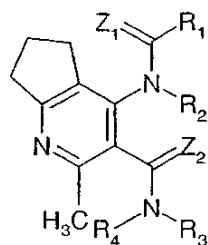
10

の338個の化合物T36.1～T36.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 6】

表 37：この表は式

【化 6 3】



(T37),

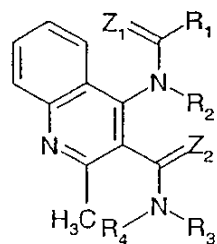
20

の338個の化合物T37.1～T37.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 7】

表 38：この表は式

【化 6 4】



(T38),

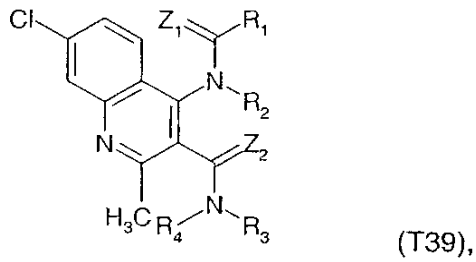
40

の338個の化合物T38.1～T38.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 8】

50

表 39：この表は式
【化 6 5】

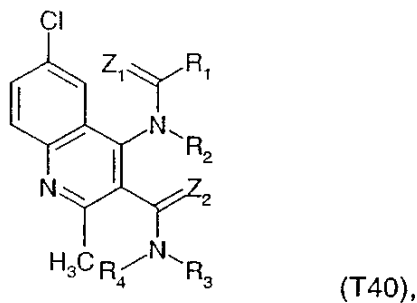


10

の338個の化合物T39.1～T39.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 3 9 】

表 40：この表は式
【化 6 6】

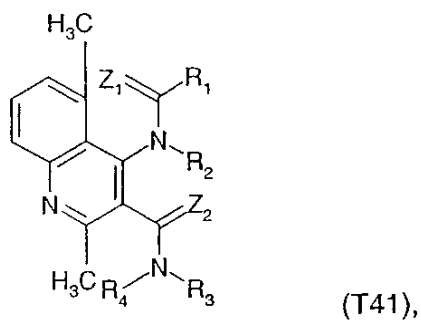


20

の338個の化合物T40.1～T40.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 4 0 】

表 41：この表は式
【化 6 7】



40

の338個の化合物T41.1～T41.338 を開示し、

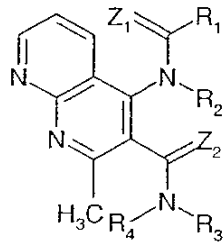
50

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0241】

表 42：この表は式

【化68】



(T42),

10

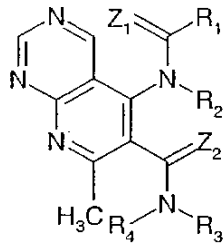
の338個の化合物T42.1～T42.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0242】

表 43：この表は式

【化69】



(T43),

30

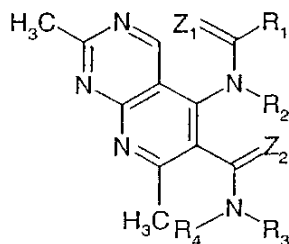
の338個の化合物T43.1～T43.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0243】

表 44：この表は式

【化70】



(T44),

40

の338個の化合物T44.1～T44.338を開示し、

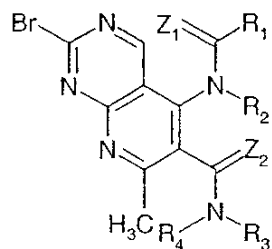
50

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0244】

表 45：この表は式

【化71】



(T45),

10

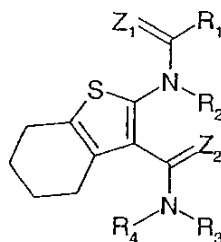
の338個の化合物T45.1～T45.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0245】

表 46：この表は式

【化72】



(T46),

30

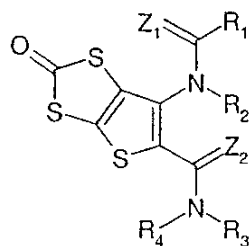
の338個の化合物T46.1～T46.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0246】

表 47：この表は式

【化73】



(T47),

40

の338個の化合物T47.1～T47.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で

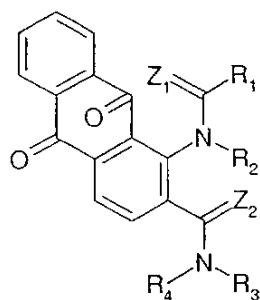
50

与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 4 7 】

表 48：この表は式

【 化 7 4 】



(T48),

10

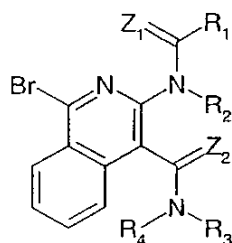
の338個の化合物T48.1～T48.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 4 8 】

表 49：この表は式

【 化 7 5 】



(T49),

30

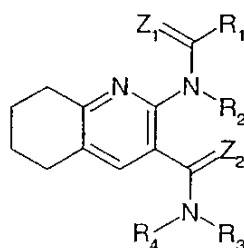
の338個の化合物T49.1～T49.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 4 9 】

表 50：この表は式

【 化 7 6 】



(T50),

40

の338個の化合物T50.1～T50.338 を開示し、

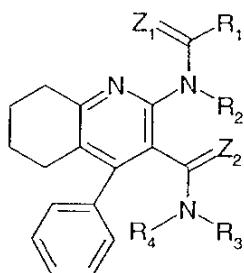
50

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0250】

表 51：この表は式

【化77】



(T51),

10

の338個の化合物T51.1～T51.338を開示し、

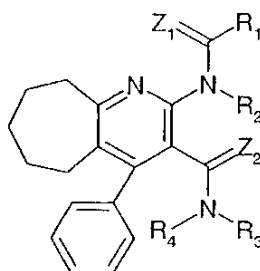
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

20

【0251】

表 52：この表は式

【化78】



(T52),

30

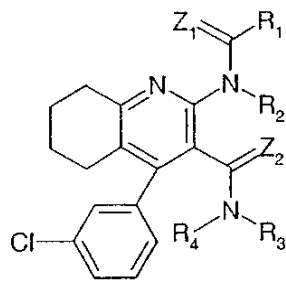
の338個の化合物T52.1～T52.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0252】

表 53：この表は式

【化 7 9】



(T53),

10

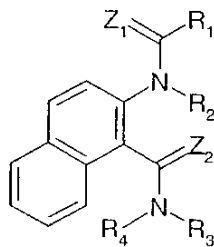
の338個の化合物T53.1～T53.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 5 3】

表 54：この表は式

【化 8 0】

20



(T54),

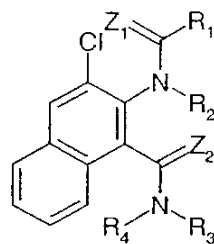
30

の338個の化合物T54.1～T54.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 5 4】

表 55：この表は式

【化 8 1】



(T55),

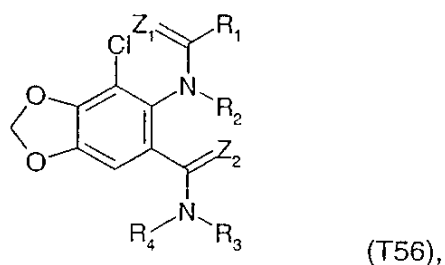
40

の338個の化合物T55.1～T55.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 5 5】

50

表 56：この表は式
【化 8 2】

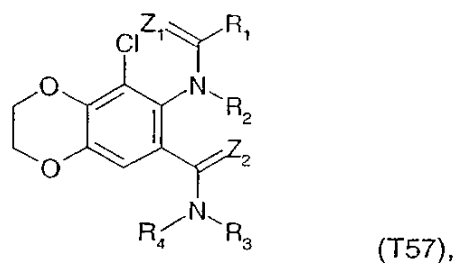


10

の338個の化合物T56.1～T56.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 5 6】

表 57：この表は式
【化 8 3】

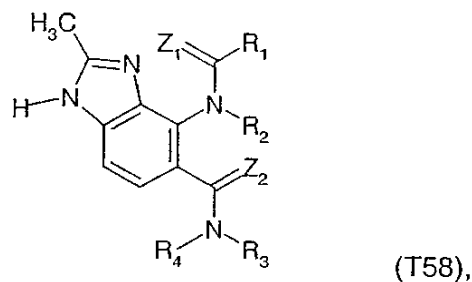


20

の338個の化合物T57.1～T57.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 5 7】

表 58：この表は式
【化 8 4】



40

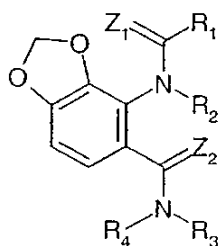
の338個の化合物T58.1～T58.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

50

【 0 2 5 8 】

表 59：この表は式

【 化 8 5 】



(T59),

10

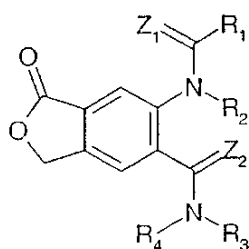
の338個の化合物T59.1～T59.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 5 9 】

表 60：この表は式

【 化 8 6 】



(T60),

20

30

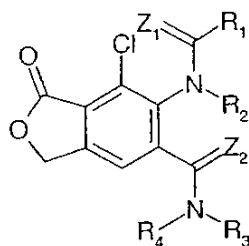
の338個の化合物T60.1～T60.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 6 0 】

表 61：この表は式

【 化 8 7 】



(T61),

40

の338個の化合物T61.1～T61.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で

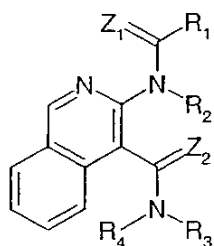
50

与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0261】

表 62：この表は式

【化88】



(T62),

10

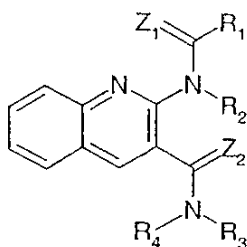
の338個の化合物T62.1～T62.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0262】

表 63：この表は式

【化89】



(T63),

20

30

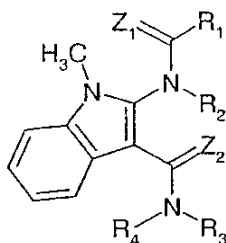
の338個の化合物T63.1～T63.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0263】

表 64：この表は式

【化90】



(T64),

40

の338個の化合物T64.1～T64.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で

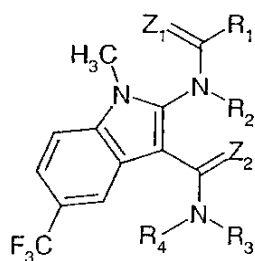
50

与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0264】

表 65：この表は式

【化91】



(T65),

10

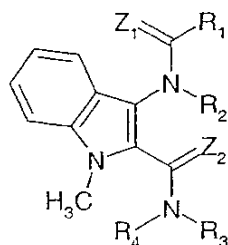
の338個の化合物T65.1～T65.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0265】

表 66：この表は式

【化92】



(T66),

30

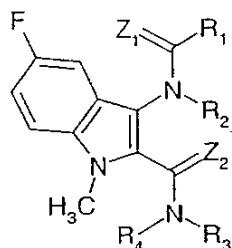
の338個の化合物T66.1～T66.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0266】

表 67：この表は式

【化93】



(T67),

40

の338個の化合物T67.1～T67.338を開示し、

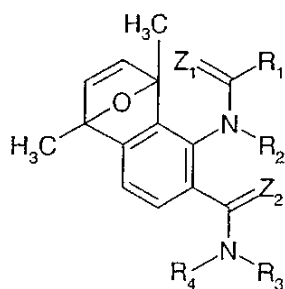
50

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 6 7 】

表 68：この表は式

【化 9 4】



(T68),

10

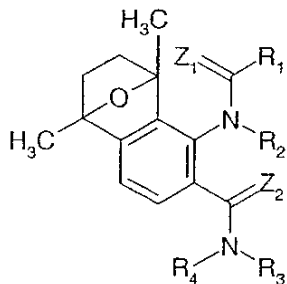
の338個の化合物T68.1～T68.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 6 8 】

表 69：この表は式

【化 9 5】



(T69),

30

の338個の化合物T69.1～T69.338 を開示し、

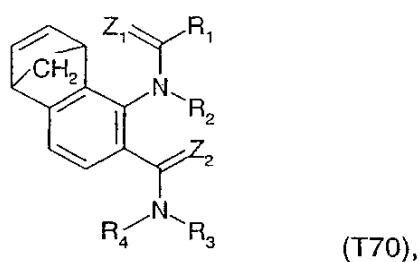
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 6 9 】

表 70：この表は式

40

【化 9 6】



10

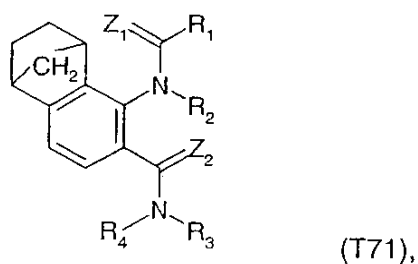
の338個の化合物T70.1～T70.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 0】

表 71：この表は式

【化 9 7】



20

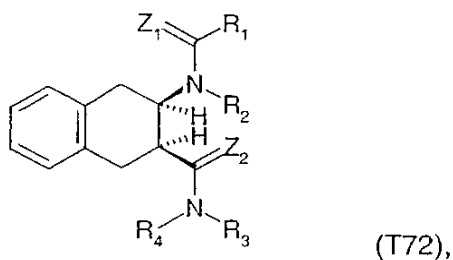
の338個の化合物T71.1～T71.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 1】

表 72：この表は式

【化 9 8】



40

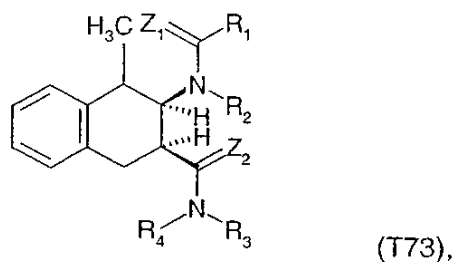
の338個の化合物T72.1～T72.338 を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 2】

50

表 73：この表は式
【化 9 9】

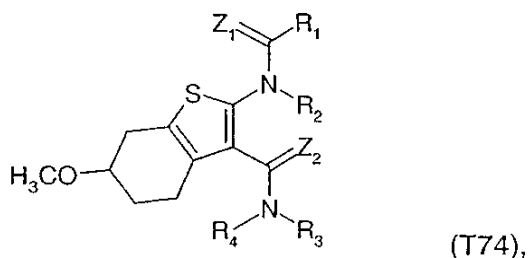


10

の338個の化合物T73.1～T73.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 7 3】

表 74：この表は式
【化 1 0 0】



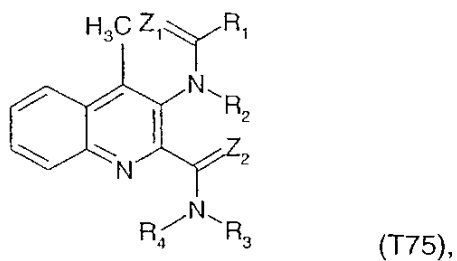
20

の338個の化合物T74.1～T74.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

30

【0 2 7 4】

表 75：この表は式
【化 1 0 1】



40

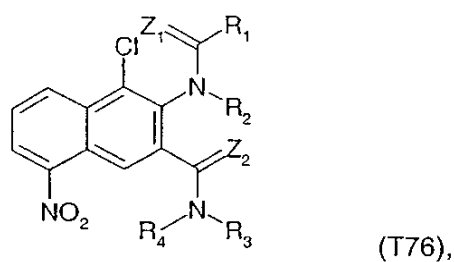
の338個の化合物T75.1～T75.338を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基Z₁、Z₂、R₁、R₂、R₃及びR₄が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 7 5】

表 76：この表は式

50

【化 1 0 2】



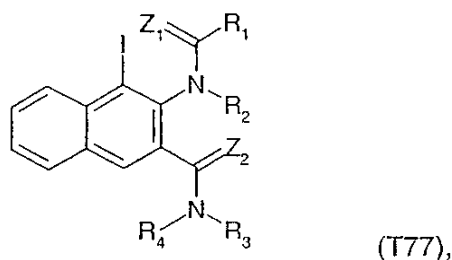
10

の338個の化合物T76.1～T76.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 6】

表 77：この表は式

【化 1 0 3】



20

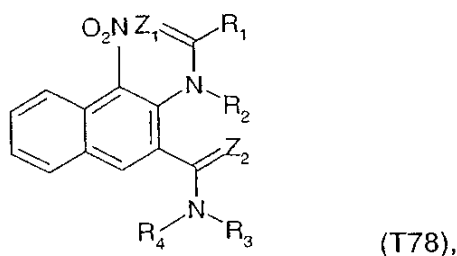
の338個の化合物T77.1～T77.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

30

【 0 2 7 7】

表 78：この表は式

【化 1 0 4】



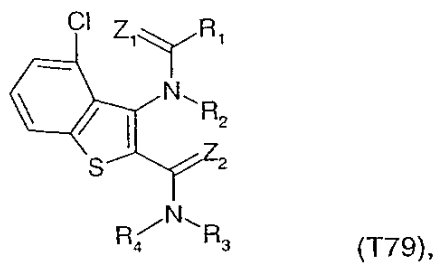
40

の338個の化合物T78.1～T78.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 8】

表 79：この表は式

【化 1 0 5】



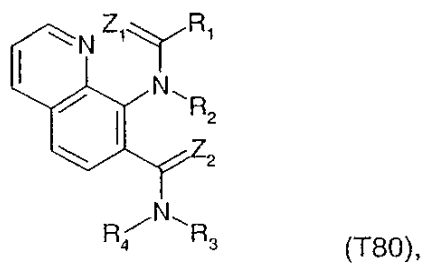
10

の338個の化合物T79.1～T79.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 7 9】

表 80：この表は式

【化 1 0 6】



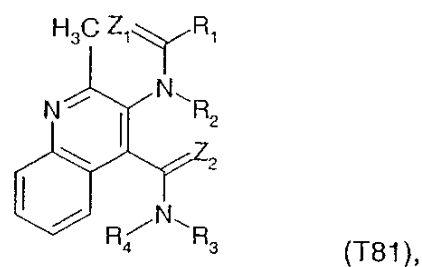
20

の338個の化合物T80.1～T80.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 0】

表 81：この表は式

【化 1 0 7】



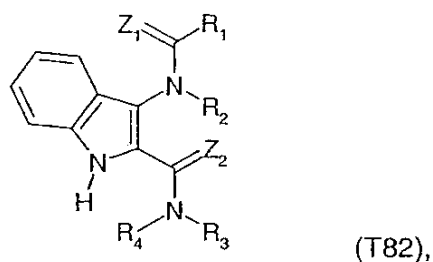
40

の338個の化合物T81.1～T81.338 を開示し、
 それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
 与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 1】

50

表 82：この表は式
【化 1 0 8】

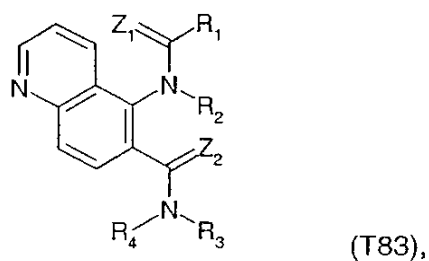


10

の338個の化合物T82.1～T82.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 2 】

表 83：この表は式
【化 1 0 9】



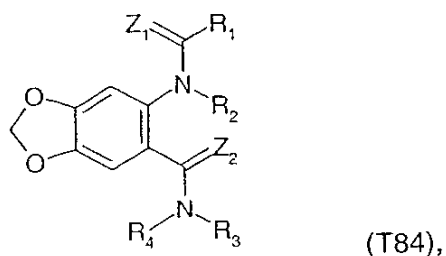
20

の338個の化合物T83.1～T83.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

30

【 0 2 8 3 】

表 84：この表は式
【化 1 1 0】



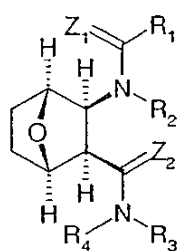
40

の338個の化合物T84.1～T84.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 4 】

表 85：この表は式

【化 1 1 1】



(T85),

10

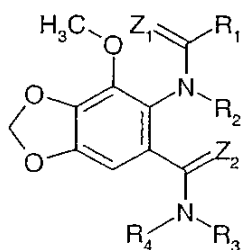
の338個の化合物T85.1～T85.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 8 5】

表 86：この表は式

【化 1 1 2】



(T86),

20

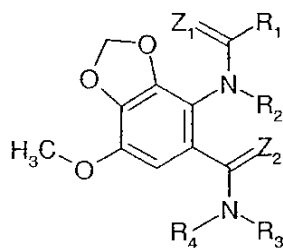
の338個の化合物T86.1～T86.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 8 6】

表 87：この表は式

【化 1 1 3】



(T87),

40

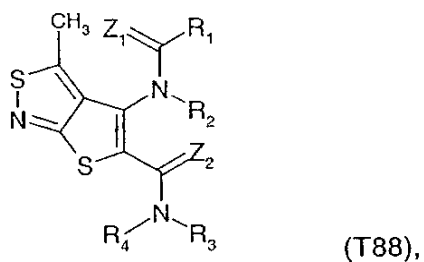
の338個の化合物T87.1～T87.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【0 2 8 7】

50

表 88：この表は式
【化 1 1 4】

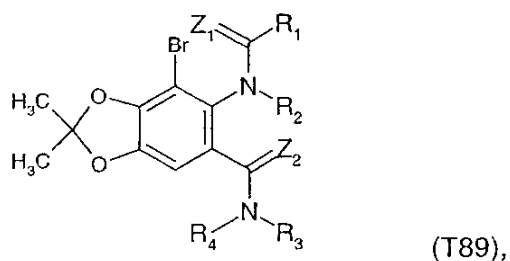


10

の338個の化合物T88.1～T88.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 8 】

表 89：この表は式
【化 1 1 5】

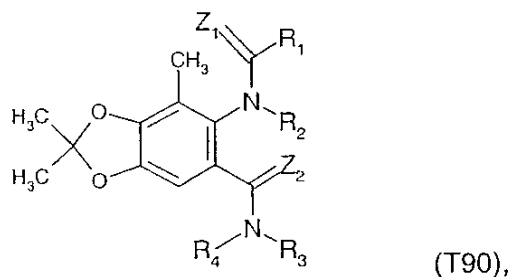


20

の338個の化合物T89.1～T89.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 8 9 】

表 90：この表は式
【化 1 1 6】



40

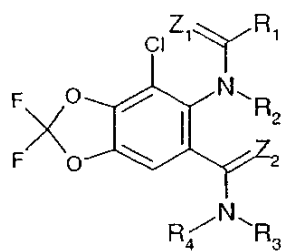
の338個の化合物T90.1～T90.338 を開示し、
それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で
与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

50

【 0 2 9 0 】

表 91：この表は式

【 化 1 1 7 】



(T91),

10

の338個の化合物T91.1～T91.338を開示し、

それぞれ338の特定の化合物は、それぞれ基 Z_1 、 Z_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が対応の行の中で与えられる特定の意味を有し、表Aの338行A.1～A.338から適切に選定される。

【 0 2 9 1 】

製剤例 (% = 重量当りのパーセント)

【 0 2 9 2 】

20

実施例 F1：エマルジョン濃度

活性成分

a)	b)	c)
25 %	40 %	50 %

カルシウムドデシルベンゼンスルホネート

5 %	8 %	6 %
-----	-----	-----

ヒマシ油ポリエチレングリコールエーテル(E0の36 mol)

5 %	-	-
-----	---	---

トリブチルフェノキシポリエチレングリコールエーテル(30 molのE0)

-	12 %	4 %
---	------	-----

シクロヘキサノン

-	15 %	20 %
---	------	------

キシレン混合物

65 %	25 %	20 %
------	------	------

【 0 2 9 3 】

エマルジョンの任意の所望される濃度は、水との希釈によって、かかる濃度から調製できる。

30

【 0 2 9 4 】

実施例 F2：溶剤

活性成分

a)	b)	c)	d)
80 %	10 %	5 %	95 %

エチレングリコールモノメチルエーテル

20 %	-	-	-
------	---	---	---

ポリエチレングリコール MW 400

-	70 %	-	-
---	------	---	---

N-メチルピロリド-2-オン

-	20 %	-	-
---	------	---	---

エポキシ化ココナツ油

-	-	1 %	5 %
---	---	-----	-----

石油エーテル(沸点範囲：160-190)

-	-	94 %	-
---	---	------	---

【 0 2 9 5 】

当該液剤は、微液滴の形態で使用するのに適している。

40

【 0 2 9 6 】

実施例 F3：顆粒

活性成分

a)	b)	c)	d)
5 %	10 %	8 %	21 %

カオリン

94 %	-	79 %	54 %
------	---	------	------

高度に分散したシリカ

1 %	-	13 %	7 %
-----	---	------	-----

アタパルジャイト

-	90 %	-	18 %
---	------	---	------

【 0 2 9 7 】

当該活性成分をジクロロメタン中に溶解し、溶剤を担体上に散布し、そしてその後、溶媒を真空中で蒸発させる。

50

【 0 2 9 8 】

実施例 F4: ダスト	a)	b)
活性成分	2 %	5 %
高度に分散したシリカ	1 %	5 %
タルク	97 %	-
カオリン	-	90 %

【 0 2 9 9 】

使用可能なダストは、担体と活性成分を密に混合することによって得られる。

【 0 3 0 0 】

実施例 F5 : 湿潤性粉末	a)	b)	c)	10
活性成分	25 %	50 %	75 %	
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-	
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %	
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	-	6 %	10 %	
オクチルフェノキシポリエチレングリコールエーテル(7-8モルのEO)	-	2 %	-	
高度に分散したシリカ	5 %	10 %	10 %	
カオリン	62 %	27 %	-	

【 0 3 0 1 】

活性成分を添加剤と共に混合し、そして当該混合物を適当なミルの中で完全に粉砕する。水で希釈することができる湿潤性粉末が得られ、任意の所望される濃度の懸濁物が得られる。

20

【 0 3 0 2 】

実施例 F6: 押出し形成顆粒	
活性成分	10 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	87 %

【 0 3 0 3 】

活性成分を添加剤と混合し、当該混合物を粉砕し、水で加湿し、押出し、造粒し、そして空気流で乾燥させる。

30

【 0 3 0 4 】

実施例 F7: コート顆粒	
活性成分	3 %
ポリエチレングリコール (MW 200)	3 %
カオリン	94 %

【 0 3 0 5 】

ミキサー中、細かく粉砕した活性成分を、ポリエチレングリコールで加湿したカオリンに均質に適用する。ダストが存在しない顆粒を得る。

【 0 3 0 6 】

実施例 F8: 懸濁濃縮物	40
活性成分	40 %
エチレングリコール	10 %
ノニルフェノキシポリエチレングリコールエーテル(15モルのEO)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
37 % 水性ホルムアルデヒド溶液	0.2 %
シリコーン油 (75 % 水性エマルジョン)	0.8 %
水	32 %

【 0 3 0 7 】

細かく粉砕した活性成分を密に添加剤と混合する。任意の所望される濃縮物の懸濁物は

50

、水での希釈によって、このようにして得られた懸濁濃縮物から調製することができる。

【0308】

生物学の実施例(％＝特に断わりのない限り、重量パーセント)

【0309】

実施例 B1: マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)に対する活性

エンドウマメの苗木にマメアブラムシ(*Aphis craccivora*)を感染させて、その後400 ppmの活性成分を含むスプレー混合物をスプレーし、20°で3日及び6日後まで潜伏させる。集団の減少パーセントおよび摂食損傷の減少パーセント(活性％)を、処理した植物上の死滅したアブラムシの数を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験では、表1～85までに挙げた化合物は良好な活性を示す。

10

【0310】

実施例 B2: ダイアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)に対する活性

トウモロコシの苗木に400 ppmの活性成分を含む水性乳化剤スプレー混合物をスプレーし、スプレーコーティングが乾燥した後、10匹のダイアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)幼虫(第2期)で生息させ、プラスチック容器に配置する。6日後、集団の減少パーセント(活性％)を、処理した植物上の死滅した幼虫の数を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験では、表1～85に挙げた化合物が良好な活性を示す。特に化合物T1.1、T1.3、T7.1及びT7.3は80％を超える活性を有す。

【0311】

実施例 B3: ヘリオジス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)(葉面適用)に対する活性

若いダイズ植物に400 ppmの活性成分を含む水性乳化剤スプレー混合物をスプレーする。スプレーコーティングが乾燥した後、10匹のヘリオジス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)毛虫を第1期で生息させ、プラスチック容器に配置する。6日後に、集団の減少パーセントおよび摂食損傷の減少パーセント(活性％)を、処理した植物上の死滅した毛虫の数および摂食損傷を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験では、表1～85に挙げた化合物は、良好な活性を示す。特に化合物T1.1、T1.3、T2.1、T7.1、T7.3、T75.1、T75.3、T76.1、T76.3、T79.1、T81.1、T2.2、T8.1、T5.1、T5.3、T20.1、T20.3、T9.1、T9.3及びT9.2は、80％を超える活性を有する。

20

【0312】

実施例 B4: ヘリオジス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)(卵適用)に対する活性

綿花に付着したヘリオジス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)の卵に400 ppmの活性成分を含む水性乳化剤スプレー混合物をスプレーする。8日後に、種卵パーセント(活性％)及び死滅した毛虫の生き残り率(活性％)を、未処理バッチと比較し、評価する。本試験では、表1～85は、良好な活性を示す。特に化合物T1.1、T1.3、T2.1、T7.1、T7.3、T75.1、T75.3、T76.1、T76.3、T79.1、T81.1、T2.2、T8.1、T5.1、T5.3、T20.1、T20.3、T9.1、T9.3及びT9.2は80％を超える活性を有する。

30

【0313】

実施例 B5: モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)(葉面適用)に対する活性

エンドウマメ苗木にモモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)を感染させて、その後400 ppmの活性成分を含むスプレー混合物をスプレーし、その後20°で3日及び6日後まで潜伏させる。集団の減少パーセントおよび摂食損傷の減少パーセント(活性％)を、処理した植物上の死滅したアブラムシの数を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験では、表1～85までに挙げた化合物は良好な活性を示す。特に、化合物T1.1及びT7.1は80％を超える活性を有する。

40

【0314】

実施例 B6: モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)(全体適用)に対する活性

エンドウマメ苗木にモモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)を感染させて、その後をこれらの根に400 ppmの活性成分を含むスプレー混合物を設置する。苗木を20°で3日及び6日後までインキュベートする。集団の減少パーセント(活性％)を、処理した植物上の死滅したアブラムシの数を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試

50

験では、表 1 ~ 8 5 までに挙げた化合物は良好な活性を示す。

【 0 3 1 5 】

実施例 B7 : プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) に対する活性

若いキャベツ植物に 4 0 0 p p m の活性成分を含む水性乳化物スプレー混合物をスプレーする。スプレーコーティングが乾燥した後、キャベツ植物に 1 0 匹のプルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) 毛虫を第 3 期で生息させ、プラスチック容器に配置する。3 日後に、集団の減少パーセントおよび摂食損傷の減少パーセント (活性 %) を、処理した植物上の死滅した毛虫の数および摂食損傷を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験では、表 1 ~ 8 5 に挙げた化合物は良好な活性を示す。特に化合物 T1.1、T1.3、T2.1、T7.1、T7.3、T22.3、T75.1、T75.3、T76.1、T76.3、T78.1、T79.1、T81.1、T2.2、T8.1、T5.1、T5.3、T20.1、T20.3、T9.1、T9.3 及び T9.2 は 80 % を超える活性を有する。

10

【 0 3 1 6 】

実施例 B8: スポドプテラ・リットラリス (*Spodoptera littoralis*) に対する活性

若いダイズ植物に 4 0 0 p p m の活性成分を含む水性乳化物スプレー混合物をスプレーし、スプレーコーティングが乾燥した後、植物に 1 0 匹のスポドプテラ・リットラリス (*Spodoptera littoralis*) 毛虫を第 1 期で生息させ、プラスチック容器に配置する。3 日後、集団の減少パーセントおよび摂食損傷の減少パーセント (活性 %) を、処理した植物上の死滅した毛虫の数および摂食損傷を、未処理植物上のそれと比較することによって決定する。本試験において、表 1 ~ 8 5 に挙げた化合物は良好な活性を示す。特に化合物 T1.1、T1.3、T2.1、T7.1、T7.3、T75.1、T75.3、T76.1、T76.3、T2.2、T8.1、T5.1、T5.3、T20.1、T20.3、T9.1、T9.3 及び T9.2 は 80 % を超える活性を有す。

20

フロントページの続き

(51) Int.Cl.			F I		
C 0 7 D	513/04	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 0 1
C 0 7 D	413/14	(2006.01)	C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	417/14	(2006.01)	C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	495/04	(2006.01)	C 0 7 D	495/04	1 0 5 A
A 0 1 N	43/86	(2006.01)	A 0 1 N	43/86	1 0 1
A 0 1 N	43/56	(2006.01)	A 0 1 N	43/56	D
A 0 1 N	43/90	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 3
A 0 1 N	43/80	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 1
A 0 1 N	43/78	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 2
A 0 1 N	43/653	(2006.01)	A 0 1 N	43/80	1 0 1
A 0 1 N	43/84	(2006.01)	A 0 1 N	43/78	D
A 0 1 N	55/00	(2006.01)	A 0 1 N	43/653	B
C 0 7 F	7/10	(2006.01)	A 0 1 N	43/84	1 0 1
A 0 1 P	7/04	(2006.01)	A 0 1 N	43/78	A
A 0 1 P	7/02	(2006.01)	A 0 1 N	55/00	Z
A 0 1 C	1/08	(2006.01)	C 0 7 F	7/10	C
A 0 1 G	7/06	(2006.01)	A 0 1 P	7/04	
			A 0 1 P	7/02	
			A 0 1 C	1/08	
			A 0 1 G	7/06	A

(31)優先権主張番号 0425453.8

(32)優先日 平成16年11月18日(2004.11.18)

(33)優先権主張国 英国(GB)

(74)代理人 100087871

弁理士 福本 積

(74)代理人 100087413

弁理士 古賀 哲次

(74)代理人 100134360

弁理士 近藤 亜矢子

(72)発明者 ヒューズ, デイブ

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イー, ブラックネル, シンジエンタ リミテッド
, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター

(72)発明者 ピース, ジェイムズ エドワード

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イー, ブラックネル, シンジエンタ リミテッド
, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター

(72)発明者 ライリー, スザンナ

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イー, ブラックネル, シンジエンタ リミテッド
, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター

(72)発明者 ラッセル, サリー

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イー, ブラックネル, シンジエンタ リミテッド
, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター

(72)発明者 スワンボロウ, ジョー

イギリス国, パークシャー アールジー 4 2 6 イー, ブラックネル, シンジエンタ リミテッド
, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ センター

(72)発明者 ホール, ロジャー グラハム

- スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ジーンゲナト, アンドレ
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ロワゼロイル, オリビエ
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 レノルト, ペーター
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 トラ, ステファン
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ベンゲル, ジーン
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

審査官 伊藤 幸司

- (56)参考文献 国際公開第2004/014844(WO, A1)
特表2001-502683(JP, A)
特開2003-212834(JP, A)
特表2003-528070(JP, A)
特開2004-051614(JP, A)
国際公開第2002/070483(WO, A1)
国際公開第2002/094791(WO, A1)
JOURNAL OF THE INDIAN CHEMICAL SOCIETY, 1972年, Vol.49, No.4, p.407-414
INDIAN JOURNAL OF CHEMISTRY, 1968年, Vol.6, No.6, p.294-296

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D

A01N

CAPLUS/REGISTRY/MARPAT(STN)