

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6080917号
(P6080917)

(45) 発行日 平成29年2月15日 (2017. 2. 15)

(24) 登録日 平成29年1月27日 (2017. 1. 27)

(51) Int. Cl.	F I
C O 7 C 237/44 (2006. 01)	C O 7 C 237/44 C S P
C O 7 D 285/06 (2006. 01)	C O 7 D 285/06
C O 7 D 207/337 (2006. 01)	C O 7 D 207/337
C O 7 D 213/82 (2006. 01)	C O 7 D 213/82
C O 7 D 213/89 (2006. 01)	C O 7 D 213/89

請求項の数 10 外国語出願 (全 70 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2015-146801 (P2015-146801)	(73) 特許権者	300091441
(22) 出願日	平成27年7月24日 (2015. 7. 24)		シンジェンタ パーティシペーションズ
(62) 分割の表示	特願2012-508973 (P2012-508973)		アーゲー
原出願日	平成22年4月14日 (2010. 4. 14)		スイス国4058 パーゼル、シュバルツ
(65) 公開番号	特開2016-26143 (P2016-26143A)		バルトアレー 215
(43) 公開日	平成28年2月12日 (2016. 2. 12)	(74) 代理人	100086771
審査請求日	平成27年8月21日 (2015. 8. 21)		弁理士 西島 孝喜
(31) 優先権主張番号	0907824. 7	(74) 代理人	100088694
(32) 優先日	平成21年5月6日 (2009. 5. 6)		弁理士 弟子丸 健
(33) 優先権主張国	英国 (GB)	(74) 代理人	100094569
(31) 優先権主張番号	10150814. 1		弁理士 田中 伸一郎
(32) 優先日	平成22年1月15日 (2010. 1. 15)	(74) 代理人	100084663
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 箱田 篤
		(74) 代理人	100093300
			弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

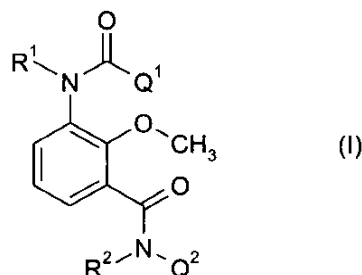
(54) 【発明の名称】 殺虫性化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

の化合物であって、式中、

Q¹は、同じかまたは異なっていてよい1～5個のR³置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、アリールまたはヘテロシクリルであり、Q²は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、

2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、

20

2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、
 2, 6 - ジメチル - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、
 2 - クロロ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、および

2 - ブロモ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニルから選択され、

R^1 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^3 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、ヒドロキシル、アセトキシ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $CN - C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)O$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル - $S(O)_2$ 、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル NH 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2N$ 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2P(O)O$ 、フェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式複素環から選択される、化合物、またはその農薬として許容される塩もしくはN - オキシド。

【請求項2】

Q^1 は、同じかまたは異なっているもよい1～5個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式ヘテロアール基から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Q^1 は、同じかまたは異なっているもよい1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジャゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシル、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3 - エトキシ - n - プロピル、メトキシメチル、2 - メトキシエトキシ、 CH_2CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N - ピロリル、チアジャゾリル、およびピリジルから選択される、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R^3 は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R^1 および R^2 は、両方とも水素である、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

Q^2 は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、
 2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、および
 2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルから選択される、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

害虫、害虫の居場所、または害虫による攻撃を受けやすい植物に、請求項1～7のい

10

20

30

40

50

れか1項に記載される、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、または殺軟体動物的に有効な量の式(I)の化合物を施用することを含む、昆虫、ダニ、線虫、または軟体動物を駆除する方法、但し、人体に施す手術又は治療又は診断方法による人の処置を除く。

【請求項9】

農薬として許容される希釈剤または担体とともに、請求項1～7のいずれか1項に記載される、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、または殺軟体動物的に有効な量の式(I)の化合物を含む、殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、または殺軟体動物性の組成物。

【請求項10】

1つ以上の追加の殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、または殺軟体動物性の化合物をさらに含む、請求項9に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、ビスアミド誘導体、それらを調製するためのプロセスおよび中間体、昆虫、ダニ、線虫、および軟体動物の害虫を駆除するためにそれらを使用する方法、ならびにそれらを含む殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、および殺軟体動物性の組成物に関する。

【背景技術】

【0002】

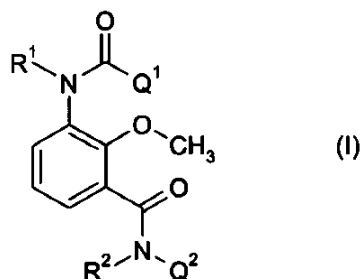
殺虫特性を有する化合物は、欧州特許第1,714,958号、日本国特許第2006/306771号、国際公開第2006/137376号、欧州特許第1,916,236号、国際公開第2007/017075号、国際公開第2008/000438号、国際公開第2008/074427号、および国際公開第2009/049845号に開示されている。害虫を駆除する代替方法の必要性が存在する。好ましくは、新規化合物は、広範囲の害虫に対する有効性の向上、選択性の向上、毒性の低下、抵抗性または活性を生じる傾向の軽減等の、改良された殺虫特性を保有することができる。化合物は、より有利に製剤化され得るか、またはより効率的な送達および作用部位にける滞留を提供することができるか、またはより容易に生分解可能であり得る。意外なことに、アリールペルフルオロブチル基によって置換された特定のビスアミド誘導体が、それらを殺虫剤としての使用に特に好適にする有益な特性を有することが分かっている。

【発明の概要】

【0003】

したがって、本発明は、式(I)

【化1】



の化合物であって、式中、

Q¹は、同じかまたは異なってもよい1～5個のR³置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、アリールまたはヘテロシクリルであり、

Q²は、

2-エチル-6-メチル-4-(ノナフルオロブト-2-イル)フェニル、

2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロプロト - 2 - イル) フェニル、
2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - プロト - 2 - イル) フェニル、
2, 6 - ジメチル - 4 - (ノナフルオロ - プロト - 2 - イル) フェニル、
2 - クロロ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロプロト - 2 - イル) フェニル、および

2 - ブロモ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロプロト - 2 - イル) フェニルから選択され、

R^1 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^3 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、ヒドロキシル、アセトキシ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $CN - C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)O$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル - $S(O)_2$ 、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル NH 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2N$ 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2P(O)O$ 、フェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式複素環から選択される、化合物、またはその農薬として許容される塩もしくはN - オキシドを提供する。

【0004】

式(I)の化合物は、異なる幾何異性体または光学異性体(鏡像異性体および/もしくはジアステレオ異性体)あるいは互変異性型として存在することができる。本発明は、全てのそのような異性体および互変異性体、ならびにあらゆる比率のそれらの混合物、また、重水素化合物等の同位体の形態を包含する。

【0005】

別途記載のない限り、アルキルは、単独で、またはアルコキシ、アルキルカルボニル、もしくはアルコキシカルボニル等の別の基の一部として、直鎖または分岐鎖であってもよく、好ましくは1～6個の炭素原子、より好ましくは1～4個、最も好ましくは1～3個を含有することができる。アルキルの例として、メチル、エチル、n - プロピル、イソ - プロピル、n - ブチル、sec - ブチル、イソ - ブチル、およびtert - ブチルが挙げられる。

【0006】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素、またはヨウ素を意味する。
ハロアルキル基は、1つ以上の同一のまたは異なるハロゲン原子を含有することができ、例えば、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、または2, 2 - ジフルオロエチルを含む。ペルフルオロアルキル基は、フッ素原子で完全に置換されたアルキル基であり、例えば、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロポ - 2 - イル、およびノナフルオロ - プロト - 2 - イルを含む。

【0007】

アリールは、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニル、フェナントレニル、およびビフェニルを含み、好ましくはフェニルである。

ヘテロアリールは、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～6個、好ましくは1～4個、より好ましくは1、2または3個のヘテロ原子を含む、3～14個、好ましくは4～10個、より好ましくは4～7個、最も好ましくは5～6個の環原子を含有する、単環式、二環式、または三環式の芳香族炭化水素を意味する。例として、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリルピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリ

ル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、およびナフチリジニルが挙げられる。窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む、4～7個、好ましくは5～6個の環原子を含有する、単環式ヘテロアリール基が好ましい。

【0008】

ヘテロアリールは、本明細書で使用される場合、ヘテロアリールを含み、さらに、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～6個、好ましくは1～4個、より好ましくは1、2または3個のヘテロ原子を含む、3～10個の環原子を含有する、飽和または部分的に不飽和の、単環式または二環式の炭化水素であってもよい。非芳香族複素環基の例は、オキシラニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、チオラニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、スルホラニル、ジオキソラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、1, 3 - ジオキサニル、1, 4 - ジオキサニル、モルホリニル、ジチアニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、アゼピニル、オキサゼピニル、チアゼピニル、チアゾリニル、ジアザパニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - ベンゾ [b] [1, 4] ジオキセピニル、ベンゾ [1, 3] ジオキソラニル、および2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシニルである。

10

【0009】

Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 および R^3 の好ましい値は、以下に記載するような任意の組み合わせである。

20

【0010】

好ましくは、 Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～5個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、アリールまたはヘテロアリールである。

より好ましくは、 Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～5個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式ヘテロアリール基から選択される。

【0011】

さらにより好ましくは、 Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～5個の R^3 によって、より好ましくは1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、およびナフチリジニルから選択される。

30

【0012】

なおより好ましくは、 Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択される。

40

【0013】

好ましくは、 R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、アセトキシ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $CH_2 - CN$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N - ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジルから選択される。

【0014】

50

より好ましくは、 R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3-エトキシ-n-プロピル、メトキシメチル、2-メトキシエトキシ、 CH_2CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N-ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジルから選択される。

最も好ましくは、 R^3 は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される。

【0015】

最も好ましい Q^1 は、実施例に定義されるものおよび表A～Mの化合物である。

好ましくは、 Q^2 は、

2-エチル-6-メチル-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニル、
2-ブロモ-6-クロロ-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニル、および
2,6-ジクロロ-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニルから選択される。

好ましくは、 R^1 は水素である。好ましくは、 R^2 は水素である。

【0016】

第1の好ましい態様において、本発明は、 Q^2 は、2-エチル-6-メチル-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニルであり、 Q^1 、 R^1 、 R^2 および R^3 は、本明細書に定義される、式(I)の化合物を提供する。

【0017】

第1の好ましい態様の好ましい実施形態において、本発明は、式(I)の化合物であって、式中、

Q^2 は、2-エチル-6-メチル-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニルであり、

Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、およびナフチリジニルから選択され、

R^1 および R^2 は、両方とも水素であり、

R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3-エトキシ-n-プロピル、メトキシメチル、2-メトキシエトキシ、 CH_2CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N-ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジルから選択される、化合物を提供する。

【0018】

第1の好ましい態様のより好ましい実施形態において、本発明は、式(I)の化合物であって、式中、

Q^2 は、2-エチル-6-メチル-4-(ノナフルオロ-ブト-2-イル)フェニルであり、

Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾ

10

20

30

40

50

リル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択され、

R^1 および R^2 は、両方とも水素であり、

R^3 は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、化合物を提供する。

【0019】

第2の好ましい態様において、本発明は、 Q^2 は、2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、 Q^1 、 R^1 、 R^2 および R^3 は、本明細書に定義される、式 (I) の化合物を提供する。

【0020】

第2の好ましい態様の好ましい実施形態において、本発明は、式 (I) の化合物であって、式中、

Q^2 は、2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、

Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1~3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、およびナフチリジニルから選択され、

R^1 および R^2 は、両方とも水素であり、

R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3 - エトキシ - n - プロピル、メトキシメチル、2 - メトキシエトキシ、 $CH_2 - CN$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N - ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジルから選択される、化合物を提供する。

【0021】

第2の好ましい態様のより好ましい実施形態において、本発明は、式 (I) の化合物であって、式中、

Q^2 は、2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、

Q^1 は、同じかまたは異なっているいてもよい1~3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択され、

R^1 および R^2 は、両方とも水素であり、

R^3 は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、化合物を提供する。

【0022】

第3の好ましい態様において、本発明は、 Q^2 は、2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、 Q^1 、 R^1 、 R^2 および R^3 は、本明細書に定義される、式 (I) の化合物を提供する。

【0023】

第3の好ましい態様の好ましい実施形態において、本発明は、式 (I) の化合物であって、式中、

Q²は、2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、
 Q¹は、同じかまたは異なっているもよい1~3個のR³置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、およびナフチリジニルから選択され、

10

R¹およびR²は、両方とも水素であり、

R³は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3 - エトキシ - n - プロピル、メトキシメチル、2 - メトキシエトキシ、CH₂ - CN、C(O)OCH₃、S(O)₂CH₃、NH₂、N(CH₃)₂、OP(O)(CH₂CH₃)₂、フェニル、N - ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジルから選択される、化合物を提供する。

【0024】

第3の好ましい態様のより好ましい実施形態において、本発明は、式(I)の化合物であって、式中、

20

Q²は、2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルであり、
 Q¹は、同じかまたは異なっているもよい1~3個のR³置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択され、

R¹およびR²は、両方とも水素であり、

R³は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、化合物を提供する。

【0025】

30

最も好ましい式(I)の化合物は、

N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチル - フェニル] - 3 - (4 - シアノ - 2 - メチルベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A5)、

N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (4 - フルオロ - 2 - クロロベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A3)、

N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 3 - (4 - フルオロ - 2 - クロロベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Bの化合物番号B2)、

40

N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - フェニル] - 3 - (4 - シアノ - 2 - メチルベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Bの化合物番号B1)、

N - [2, 6 - ジクロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 3 - (4 - フルオロ - 2 - クロロベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Cの化合物番号C1)、

N - [2, 6 - ジクロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 3 - (4 - シアノ - 2 - メチルベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Cの化合物番号C2)、

N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロ

50

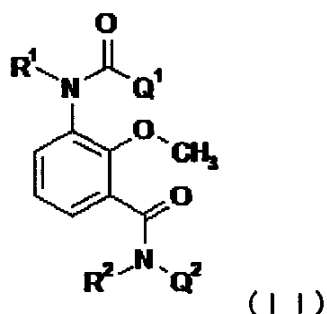
メチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (4 - フルオロベンゾイルアミノ) - 2 -
 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A 1)、
 N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロ
 メチルプロピル) - 6 - メチル - フェニル] - 3 - (4 - シアノベンゾイルアミノ) - 2
 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A 4)、
 N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロ
 メチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - メチル - 3 - ニトロベンゾイルア
 ミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A 2)、および
 N - {3 - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ
 - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - フェニルカルバモイル] - 2 - メトキシフェニル
 } - 2, 4, 6 - トリフルオロベンズアミド (表Bの化合物番号B 1 8 9) から選択され
 る。

10

【0026】

さらなる態様において、本発明は、式 (I I)

【化2】



20

の化合物であって、式中、 Q^1 、 R^1 、 R^2 および R^3 は、式 (I) について定義される通り
 であり、その好ましい実施形態は、式 (I) の好ましい実施形態に対応し、
 Q^2 は、

30

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
 2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
 2, 6 - ジクロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
 2, 6 - ジメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、および
 2 - メチル - 6 - メトキシメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニルから選択
 される、化合物を提供する。

【0027】

好ましい実施形態において、本発明は、式 (I I) の化合物であって、式中、
 Q^1 は、同じかまたは異なってもよい1~3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選
 択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾ
 リル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およ
 びピリミジニルから選択され、
 R^1 および R^2 は、両方とも水素であり、

40

R^3 は、シアノ、ニトロ、ブロモ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメ
 チル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択され、
 Q^2 は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
 2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
 2, 6 - ジクロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、

50

2, 6 - ジメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、および
2 - メチル - 6 - メトキシメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニルから選択
される、化合物、
またはその農薬として許容される塩もしくはN - オキシドを提供する。

最も好ましい式 (I I) の化合物は、表 E、G、J、K および L の化合物である。

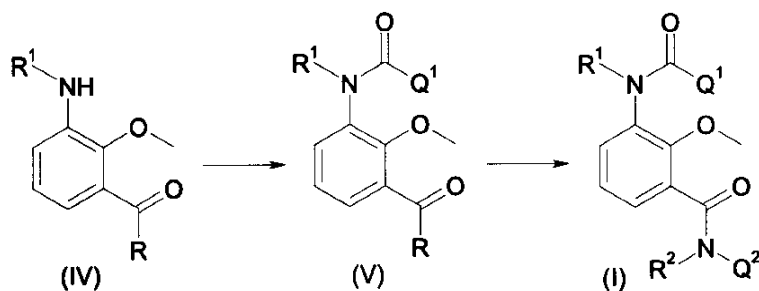
【0028】

本発明の化合物は、種々の方法によって、例えば、国際公開第 08 / 000438 号に
開示される方法によって作製することができる。

【0029】

1) 式 (I) の化合物は、式 (V) (式中、R は OH、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、Cl、F、
または Br である) の化合物を、式 NHR^2Q^2 のアミンで処理することによって作製
することができる。R が OH である場合、そのような反応は、DCC (N, N' - ジシクロ
ヘキシルカルボジイミド)、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) もしくは BOP - Cl (ビス (2 - オキソ - 3 - オキサゾリジ
ニル) ホスホン酸クロリド) 等のカップリング試薬の存在下で、ピリジン、トリエチルア
ミン、4 - (ジメチルアミノ) - ピリジン、もしくはジイソプロピルエチルアミン等の塩
基の存在下で、また任意選択的に、ヒドロキシベンゾトリアゾール等の求核性触媒の存在
下で実行することができる。R が Cl である場合、そのような反応は、例えば、ピリジン
、トリエチルアミン、4 - (ジメチルアミノ) - ピリジンもしくはジイソプロピルエチル
アミンの存在下等の塩基性条件下において、また任意選択的に、求核性触媒の存在下にお
いて実行することができる。代替として、反応は、好ましくは酢酸エチルである有機溶媒
と、好ましくは重炭酸ナトリウムの溶液である水性溶媒とを含む二相系において実施す
ることができる。R が $C_1 - C_6$ アルコキシである場合、熱プロセスにおいてエステルおよび
アミンと一緒に熱することによって、エステルを直接アミドに変換することができる。

【化 3】



【0030】

2) 式 (V) (式中、R は Cl、F、もしくは Br である) の酸ハロゲン化物は、塩化
チオニルまたは塩化オキサリルで処理することによって、式 (V) (式中、R は OH であ
る) のカルボン酸から作製することができる。

【0031】

3) 式 (V) (式中、R は OH である) のカルボン酸は、エタノール等の溶媒中で、エ
ステルを水酸化ナトリウム等のアルカリ性水酸化物で処理することによって、式 (V) (
式中、R は $C_1 - C_6$ アルコキシである) のエステルから形成することができる。

【0032】

4) 式 (V) (式中、R は $C_1 - C_6$ アルコキシである) のエステルは、1) に記載され
るような標準条件下において、式 $Q^1 - COOH$ のカルボン酸または式 $Q^1 - COHal$ (
式中、Hal は Cl、F、もしくは Br である) の酸ハロゲン化物でアシル化することによ
り式 (I V) (R は $C_1 - C_6$ アルコキシである) の化合物を処理することによって作製

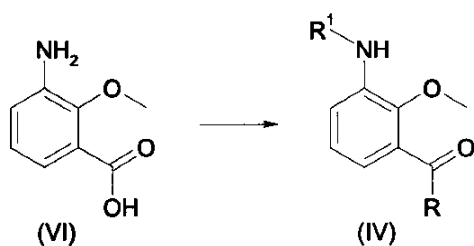
することができる。

【0033】

5) 式 (IV) (式中、RはC₁ - C₆アルコキシである) の化合物は、酸性条件下におけるアルコールR - OHを用いた連続処理、およびその後のN - R¹結合の形成によって、式 (VI) の化合物から作製することができる。例えば、アルデヒドまたはケトン、およびシアノ水素化ホウ素ナトリウム等の還元剤でアミンを処理することによって、還元的アミノ化を達成することができる。代替として、アルキル化は、任意選択的に塩基の存在下で、ハロゲン化アルキル等のアルキル化剤でアミンを処理することによって達成することもできる。代替として、アリール化は、好適な触媒／リガンド系、多くはパラジウム(0)錯体の存在下で、ハロゲン化アリールまたはスルホン酸アリールでアミンを処理することによって達成することもできる。

10

【化4】



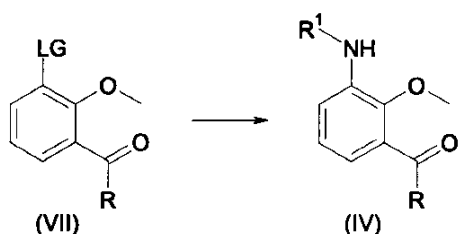
20

【0034】

6) 代替として、式 (IV) (式中、RはC₁ - C₆アルコキシである) の化合物は、式 R¹ - NH₂ のアミンまたは他のイミン類似体による脱離基の置換と、それに続く金属触媒による加水分解を介して、式 (VII) (式中、RはC₁ - C₆アルコキシであり、LGはフルオロ、クロロ、もしくはスルホネート等の脱離基である) の化合物から作製することもできる。例えば、Chemical Communications (2009), (14), 1891 - 1893またはJournal of Organic Chemistry (2000), 65 (8), 2612 - 2614を参照のこと。

30

【化5】



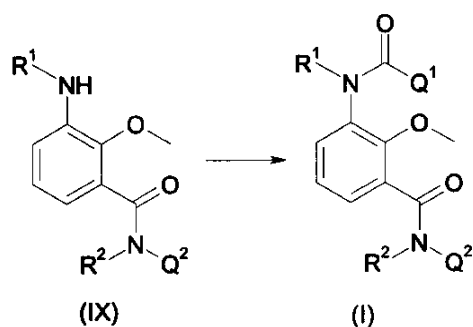
40

式 (VII) の化合物および式 R¹ - NH₂ のアミンは、既知の化合物であるか、または当業者に既知の方法によって作製することができる。

【0035】

7) 代替として、式 (I) の化合物は、1) に記載されるような標準条件下において、式 Q¹ - COOH のカルボン酸または式 Q¹ - COHal (式中、HalはCl、F、もしくはBrである) の酸ハロゲン化物で式 (IX) の化合物を処理することによって作製することもできる。

【化 6】



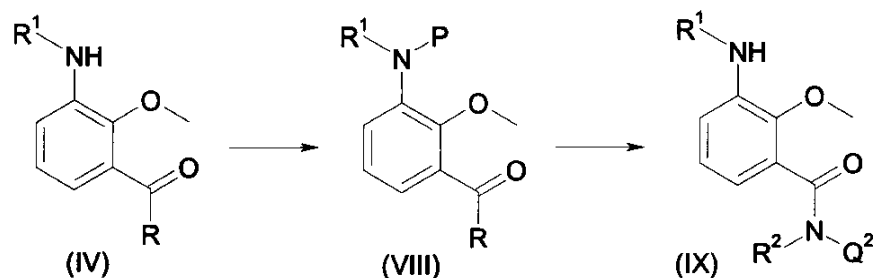
10

【0036】

8) 式 (IX) の化合物は、1) に記載されるような標準条件下における式 NHR^2Q^2 のアミンとのアミド結合形成、それに続く標準条件下における保護基 P の除去によって、式 (VII) (式中、P は好適な保護基であり、R は OH、Cl、または $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシである) の化合物から作製することができる。

【化 7】

20



30

【0037】

9) 式 (VII) (式中、R は OH または $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシである) の化合物は、式 (IV) (式中、R は OH または $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシである) の化合物においてアミン官能性を保護することによって作製することができる。好適な保護基として、カルバミン酸塩 (tert-ブチルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル、およびベンジルオキシカルボニル等)、トリアルキルシリル基 (tert-ブチルジメチルシリル等) およびアシル基 (アセチル等) が挙げられる。

【0038】

10) 式 (VII) の化合物および式 (IV) の化合物について、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性水酸化物で処理することによって、エステル (式中、R は $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシである) を酸 (式中、R は OH である) に加水分解することができる。酸は、2) および 3) に記載されるように、塩化チオニルまたは塩化オキサリルで処理することによって、酸塩化物 (式中、R は Cl である) に変換することができる。

40

【0039】

11) 代替として、式 (IV) (式中、R は OH、Cl、F、Br、または $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシである) の化合物は、1) に記載されるような標準条件下における式 NHR^2Q^2 のアミンとのアミド結合形成によって、式 (IX) の化合物に直接変換することができる。

【0040】

50

12) 代替として、式 (IX) の化合物は、式 R^1-NH_2 の化合物または他のイミン類似体による脱離基の置換と、それに続く金属触媒による加水分解によって、式 (XI) (式中、LG はヨード、ブロモ、クロロ、もしくはスルホネート等の脱離基である) の化合物から作製することができる。例えば、Chemical Communication (2009), (14), 1891-1893 または Journal of Organic Chemistry (2000), 65 (8), 2612-2614 を参照のこと。

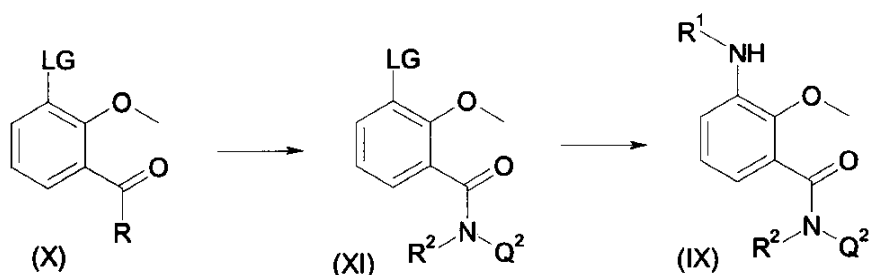
【0041】

13) 式 (XI) の化合物は、1) に記載されるような標準条件下におけるアミド結合形成を介して、式 (X) (式中、R は Cl または OH であり、LG は 12) に記載される

10

ような脱離基である) の化合物から作製することができる。式 (X) および式 (IV) の化合物は、既知の化合物であるか、または当業者に既知の方法によって作製することができる。

【化8】



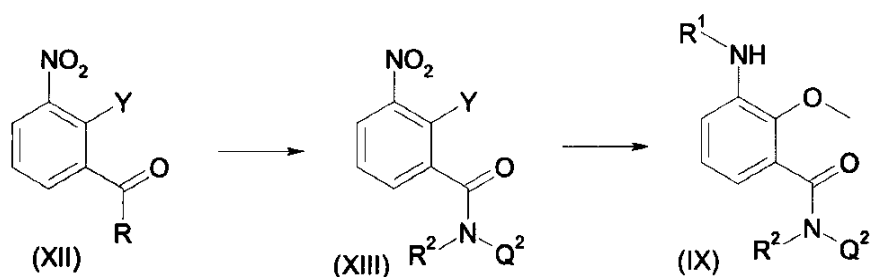
20

【0042】

14) 式 (IX) (式中、 R^1 は水素である) の化合物の代替の合成は、酸性条件下における塩化スズによる処理、または炭素上のパラジウム等の貴金属によって触媒される水素添加等の、式 (XIII) のニトロ化合物の還元によって達成することができる。

【化9】

30



YはLG又はOMe

40

【0043】

15) 式 (XIII) の化合物は、1) に記載されるような標準条件下において式 $NH-R^2-Q^2$ のアミンでアシル化することにより、式 (XII) (式中、R は OH、Cl、または C_1-C_6 アルコキシである) の化合物から誘導することができる。

【0044】

16) 式 (XII) の化合物について、3) に記載されるような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性水酸化物で処理することによって、エステル (式中、R は C_1-C_6 アルコキシである) を酸 (式中、R は OH である) に加水分解することが

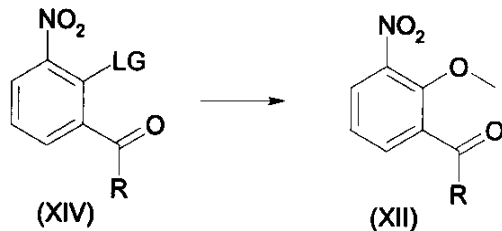
50

できる。酸は、2)に記載されるように、塩化チオニルまたは塩化オキサリルで処理することによって、酸塩化物(式中、RはClである)に変換することができる。式(XII)の化合物は、既知であるか、または当業者に既知の方法によって作製することができる。

【0045】

17)式(XII)の化合物は、NaH等の塩基の存在下でメタノールと反応させることによって、式(XIV)(式中、LGはフルオリンまたは塩素等のハロゲンである)の化合物から作製することができる。

【化10】



【0046】

酸素求核剤によるハロゲンの置換もまた、式(XIII)の中間体上で実行することができる。

【0047】

式(I)の化合物は、鱗翅目、双翅目、半翅目、総翅目、直翅目、防翅目、鞘翅目、ノミ目、膜翅目および等翅目等の昆虫の害虫、ならびに他の無脊椎害虫、例えば、ダニ、線虫、および軟体動物の害虫の寄生を抑制するために使用することができる。昆虫、ダニ、線虫、および軟体動物は、これ以降、害虫と総称される。本発明化合物の使用によって駆除することができる害虫は、農業(この用語は、食物および繊維製品のための作物栽培を含む)、園芸および畜産、ペット、山林学、および植物起源(果実、穀物および木材等)の製品の保存に関連する害虫、人工構造物の破損ならびにヒトおよび動物の疾病の伝播に関連する害虫、そしてまた迷惑害虫(ハエ等)を含む。

【0048】

式(I)の化合物によって駆除することができる害虫種の例として、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)(アブラムシ)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)(アブラムシ)、マメクロアブラムシ(*Aphis fabae*)(アブラムシ)、カスミカメムシ(*Lygus*)属の数種(カスミカメムシ)、アカホシカメムシ(*Dysdercus*)属の数種(カスミカメムシ)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)(ウンカ)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)(ヨコバイ)、アオカメムシ(*Nezara*)属の数種(カメムシ)、ユースキスツス(*Euschistus*)属の数種(カメムシ)、クモヘリカメムシ(*Leptocoris*)属の数種(カメムシ)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)(アザミウマ)、アザミウマ属の数種(アザミウマ)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)(コロラドハムシ)、ワタミハナゾウムシ(*Anthonomus grandis*)(ワタミハナゾウムシ)、アオニジエラ(*Aonidiella*)属の数種(カイガラムシ)、トリアレウロデス(*Trialetrodes*)属の数種(コナジラミ)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)(コナジラミ)、ヨーロッパアワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)(ヨーロッパアワノメイガ)、スポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera littoralis*)(ハスモンヨトウ近縁種)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)(ニセアメリカタバコガ幼虫)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)(

10

20

30

40

50

オオタバコガ幼虫)、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) (アメリカ
 タバコガ幼虫)、ワタノメイガ (*Sylepta derogata*) (ワタノメイガ)
 、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*) (オオモンシロチョウ)、
 コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)、ヤガ (*Agrotis*
) 属の数種 (ヨトウムシ)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニ
 カメイガ)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*) (イナゴ)、オ
 ーストラリアトビバッタ (*Chortiocetes terminifera*) (イナ
 ゴ)、ディアブロチカ (*Diabrotica*) 属の数種 (ハムシ)、リンゴハダニ (*P*
anonychus ulmi) (リンゴハダニ)、ミカンハダニ (*Panonych*
s citri) (ミカンハダニ)、ナミハダニ (*Tetranychus urtic*
ae) (ナミハダニ)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabari*
nus) (ニセナミハダニ)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta ole*
ivora) (ミカンサビダニ)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarson*
emus latus) (チャノホコリダニ)、ブレヴィパルプス (*Brevipalp*
us) 属の数種 (ヒメハダニ)、オウシマダニ (*Boophilus microplu*
s) (ウシマダニ)、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variab*
ilis) (アメリカイヌカクマダニ)、ネコノミ (*Ctenocephalides*
felis) (ネコノミ)、リリオミザ (*Liriomyza*) 属の数種 (ハモグリバエ
)、イエバエ (*Musca domestica*) (イエバエ)、ネッタイシマカ (*Ae*
des aegypti) (カ)、ハマダラカ (*Anopheles*) 属の数種 (カ)、
 イエカ (*Culex*) 属の数種 (カ)、キンバエ (*Lucillia*) 属の数種 (クロバ
 エ)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) (ゴキブリ)、ワ
 モンゴキブリ (*Periplaneta americana*) (ゴキブリ)、東洋ゴキ
 ブリ (*Blatta orientalis*) (ゴキブリ)、ゲンシロアリ科のシロアリ
 (例えば、ムカシシロアリ (*Mastotermes*) 属の数種)、レイビシロアリ (*K*
alotermitidae) (例えば、コウシュンシロアリ (*Neotermes*) 属
 の数種)、ミゾガシラシロアリ科 (*Rhinotermitidae*) (例えば、イエシ
 ロアリ (*Coptotermes formosanus*)、土壌シロアリ (*Retic*
ulitermes flavipes)、ヤマトシロアリ (*R. speratu*)、
R. バージニカス (*R. virginicus*)、西洋シロアリ (*R. hespe*
rus)、および *R. サントネシス* (*R. santonensis*) ならびにシロアリ
 科 (*Termitidae*) (例えば、キイロマルガシラシロアリ (*Globiterm*
es sulfureus))、アカカミアリ (*Solenopsis geminat*
a) (ヒアリ)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*) (ファラ
 オアリ)、ダマリニア (*Damalinia*) 属の数種およびケモノホソジラミ (*Lin*
ognathus) 属の数種 (刺咬性および吸血性のシラミ)、ネコブセンチュウ属の数
 種 (ネコブセンチュウ (*root knot nematodes*))、グロボデラ (*G*
lobodera) 属の数種およびヘテロデラ (*Heterodera*) 属の数種 (シス
 トセンチュウ)、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus*) 属の数種 (ネグサレ
 センチュウ)、バナナネモグリセンチュウ (*Rhodopholus*) 属の数種 (バナナ
 ネモグリセンチュウ)、ティレンクルス (*Tylenchulus*) 属の数種 (ミカンネ
 センチュウ)、捻転胃虫 (*Haemonchus contortus*) (バーバーポー
 ルワーム)、セノラブディティスエレガンス (*Caenorhabditis eleg*
ans) (スセンチュウ)、トリコストロンギルス (*Trychostrongylus*
) 属の数種 (消化管内線虫)、およびノハラナメクジ (*Deroceras retic*
ulatum) (ナメクジ) が挙げられる。

【0049】

したがって、本発明は、昆虫、ダニ、線虫、もしくは軟体動物を駆除する方法であって
 、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、もしくは殺軟体動物的に有効な量の式 (I) の化
 合物、または式 (I) の化合物を含む組成物を、害虫、害虫の居場所 (好ましくは植物)

、または害虫による攻撃を受けやすい植物に施用することを含む方法を提供する。式（I）の化合物は、好ましくは昆虫またはダニに対して使用される。

【0050】

用語「植物」は、本明細書で使用される場合、苗、灌木、および木を含む。

【0051】

作物は、従来の育種方法または遺伝子工学によって、除草剤または除草剤のクラス（例えば、ALS-、GS-、EPSPS-、PPO- およびHPPD- 阻害剤）に対する耐性が付与された作物も含むものと理解されたい。従来の育種方法によって、イミダゾリノン、例えばイマザモックスに対する耐性が付与された作物の例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（キャノーラ）である。遺伝子工学的方法によって除草剤に対する耐性が付与された作物の例として、例えば、Roundup Ready（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）の商品名で市販されるグリホサートおよびグルホシネートに対して抵抗性を有するトウモロコシの変種が挙げられる。

10

【0052】

作物はまた、遺伝子工学的方法によって有害な昆虫に対する抵抗性が付与されたもの、例えば、Bt トウモロコシ（ヨーロッパアワノメイガに対して抵抗性）、Bt ワタ（ワタミハナゾウムシに抵抗性）、またBt ジャガイモ（コロラドハムシに対して抵抗性）であると理解されたい。Bt トウモロコシの例は、NK（登録商標）のBt 176 トウモロコシハイブリッド（Syngenta Seeds）である。殺虫剤抵抗性をコードし、かつ1つ以上の毒素を発現する1つ以上の遺伝子を含むトランスジェニック植物の例は、KnockOut（登録商標）（トウモロコシ）、Yield Gard（登録商標）（トウモロコシ）、NuCOTIN 33B（登録商標）（ワタ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、NewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）、NatureGard（登録商標）、およびProteXcta（登録商標）である。

20

【0053】

植物の作物またはその種子材料は、除草剤に対して抵抗性であること、そして同時に、昆虫の摂食に対して抵抗性であることの両方が可能である（「積み重なった」形質転換現象）。例えば、種子は、殺虫性Cry 3タンパク質を発現する能力を有し得る一方で、同時にグリホサートに対して耐性である。

【0054】

30

作物はまた、従来の育種方法または遺伝子工学的方法によって得られ、いわゆる出力形質（例えば、貯蔵安定性の向上、より高い栄養価、および風味の改良）を含むものと理解されたい。

【0055】

式（I）の化合物を、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、または殺軟体動物剤として、害虫、害虫の居場所、または害虫による攻撃を受けやすい植物に施用するために、式（I）の化合物は、通常、式（I）の化合物に加えて、好適な不活性の希釈剤または担体、および任意選択的に界面活性剤（SFA）を含む組成物中に製剤化される。SFAは、界面張力を低下させ、それにより他の特性（例えば、分散、乳化、および湿潤）に変化をもたらすことによって、界面（例えば、液体／固体、液体／空気、または液体／液界面）の特性を改変することができる化学薬品である。全ての組成物（固体製剤および液体製剤の両方）が、0.0001～95重量%、より好ましくは1～85重量%、例えば5～60重量%の式（I）の化合物を含むことが好ましい。組成物は、式（I）の化合物が、1ヘクタール当たり0.1g～10kg、好ましくは1ヘクタール当たり1g～6kg、より好ましくは1ヘクタール当たり1g～1kgの割合で施用されるように、害虫の駆除のために一般的に使用される。

40

【0056】

種子粉衣において使用される場合、式（I）の化合物は、種子1キログラム当たり0.0001g～10g（例えば、0.0001gまたは0.05g）、好ましくは0.005g～10g、より好ましくは0.005g～4gの割合で使用される。

50

別の態様において、本発明は、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、または殺軟体動物的に有効な量の式（I）の化合物と、そのための好適な担体または希釈剤とを含む、殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、または殺軟体動物性の組成物を提供する。組成物は、好ましくは殺虫性または殺ダニ性組成物である。

【0057】

組成物は、粉剤（DP）、水溶剤（SP）、顆粒水溶剤（SG）、顆粒水和剤（WG）、水和剤（WP）、粒剤（GR）（徐放性または即放性）、液剤（SL）、油剤（OL）、微量散布剤（UL）、乳剤（EC）、分散剤（DC）、エマルジョン剤（水中油型（EW）および油中水型（EO）の両方）、マイクロエマルジョン剤（ME）、懸濁剤、（SC）、エアロゾル、塗布剤／燻煙剤、カプセル懸濁剤（CS）、および種子処理剤を含む、多くの剤型から選択することができる。いずれの場合においても、選択される剤型は、意図する特定の目的と、式（I）の化合物の物理的、化学的、および生物学的特性とに依存する。

10

【0058】

粉剤（DP）は、式（I）の化合物を、1つ以上の固形希釈剤（例えば、天然粘土、カオリン、パイロフィライト、ベントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、キーゼルグール、白亜、珪藻土、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよび炭酸マグネシウム、硫黄、石灰、小麦粉、タルク、ならびに他の有機および無機固形担体）と混合し、該混合物を機械的に粉砕して微粉末にすることによって調製することができる。

【0059】

水溶剤（SP）は、式（I）の化合物を、1つ以上の水溶性無機塩（重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、もしくは硫酸マグネシウム等）または1つ以上の水溶性有機固形物（多糖等）、および任意選択的に1つ以上の湿潤剤、1つ以上の分散剤、あるいは上記物質の混合物と混合して、水分散性／溶解度を向上させることによって調製することができる。次いで、混合物を粉砕して微粉末にする。同様の組成物を造粒して顆粒水溶剤（SG）を形成することもできる。

20

【0060】

水和剤（WP）は、式（I）の化合物を、1つ以上の固形希釈剤もしくは担体、1つ以上の湿潤剤（好ましくは1つ以上の分散剤）、任意選択的に1つ以上の懸濁化剤と混合して、液体中の分散を促進することによって調製することができる。次いで、混合物を粉砕して微粉末にする。同様の組成物を造粒して顆粒水和剤（WG）を形成することもできる。

30

粒剤（GR）は、式（I）の化合物と、1つ以上の粉末状の固形希釈剤もしくは担体との混合物を造粒することによって形成することができるか、あるいは、多孔質の粒状材料（軽石、アタパルジャイト粘土、フラー土、キーゼルグール、珪藻土、もしくは粉砕したトウモロコシの穂軸等）に式（I）の化合物（もしくは好適な物質中のその溶液）を吸収させるか、または砕石材（砂、ケイ酸塩、鉱物炭酸塩、硫酸塩、もしくはリン酸塩等）上に式（I）の化合物（もしくは好適な物質中のその溶液）を吸着させ、必要に応じて乾燥させることによって、予め形成されたブランクの顆粒から形成することができる。吸収または吸着を補助するために一般的に使用される物質として、溶媒（脂肪族および芳香族石油溶媒、アルコール、エーテル、ケトンおよびエステル等）、ならびに固着剤（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、砂糖および植物油等）が挙げられる。顆粒には1つ以上の他の添加剤（例えば、乳化剤、湿潤剤、または分散剤）が含まれてもよい。

40

【0061】

分散剤（DC）は、式（I）の化合物を、水中、またはケトン、アルコール、もしくはグリコールエーテル等の有機溶媒中に溶解することによって調製することができる。これらの溶液は、界面活性剤（例えば、水の希釈を向上するため、または噴霧タンク中の結晶化を防ぐため）を含有してもよい。

【0062】

50

乳剤（EC）または水中油型エマルジョン（EW）は、式（I）の化合物を、有機溶媒（1つ以上の湿潤剤、1つ以上の乳化剤、または上記物質の混合物を任意選択的に含有する）に溶解することによって調製することができる。ECに使用するのに好適な有機溶媒として、芳香族炭化水素（SOLVESSO 100、SOLVESSO 150およびSOLVESSO 200によって例示されるアルキルベンゼンまたはアルキルナフタレン等、SOLVESSOは登録商標である）、ケトン（シクロヘキサノンまたはメチルシクロヘキサノン等）およびアルコール（ベンジルアルコール、フルフリルアルコール、またはブタノール等）、N-アルキルピロリドン（N-メチルピロリドンまたはN-オクチルピロリドン等）、脂肪酸のジメチルアミド（C₈-C₁₀脂肪酸ジメチルアミド等）、ならびに塩素化炭化水素が挙げられる。EC製品は、水に添加すると瞬時に乳化することができ、適切な器具を用いた噴霧施用を可能にするのに十分な安定性を有するエマルジョンを生じる。EWの調製は、液体（室温では液体でなくとも、適切な温度、通常70℃未満で溶融できる）として、または（適切な溶媒に溶解することによって）溶液中に、式（I）の化合物を得ること、そして、得られた液体または溶液を、次いで、高剪断力下で1つ以上のSFAを含有する水に乳化してエマルジョンを生成することを含む。EWに使用するのに好適な溶媒として、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼン等）、芳香族溶媒（アルキルベンゼンまたはアルキルナフタレン等）、および水中での溶解度が低い他の適切な有機溶媒が挙げられる。

10

【0063】

マイクロエマルジョン（ME）は、水と、1つ以上のSFAを含む1つ以上の溶媒の混合物とを混合して、熱力学的に安定した等方性の液体製剤を瞬時に生成することによって調製することができる。式（I）の化合物は、最初、水中または溶媒/SFAの混合物中のいずれかに存在する。MEに使用するのに好適な溶媒として、ECまたはEWにおける使用について本明細書で上述したものが挙げられる。MEは、水中油系または油中水系のどちらであってもよく（どの系が存在するかは伝導率の測定値によって決定することができる）、同じ製剤中で水溶性および油溶性の殺虫剤を混合するのに好適であってもよい。MEは、水中で希釈するに好適であり、マイクロエマルジョンとして残るか、または従来の水中油型エマルジョンを形成する。

20

【0064】

懸濁剤（SC）は、式（I）の化合物の微粉化した不溶性固形微粒子の水性または非水性の懸濁液を含有することができる。SCは、任意選択的に1つ以上の分散剤とともに、好適な媒体中で式（I）の固体化合物をボール製粉またはビーズ製粉して、化合物の微粒子懸濁液を生成することによって調製することができる。1つ以上の湿潤剤が組成物に含まれてもよく、粒子が沈降する速度を低下させるために懸濁化剤が含まれてもよい。代替として、式（I）の化合物は、乾式製粉して水に加えることもでき、所望の最終産物を生成するために、本明細書において後述する物質を含有する。

30

【0065】

エアゾル製剤は、式（I）の化合物と、好適な噴射薬（例えば、n-ブタン）とを含む。また、式（I）の化合物は、非加圧式の手動噴霧ポンプに使用するための組成物を提供するように、好適な媒体（例えば、水、またはn-プロパノール等の水混和性の液体）に溶解または分散させることもできる。

40

【0066】

式（I）の化合物は、化合物を含有する煙を密閉空間で発生させるのに好適な組成物を形成するために、乾燥した状態で火工混合物と混合することができる。

【0067】

カプセル懸濁剤（CS）は、EW製剤の調製法と同様の様式で調製することができるが、油滴の水分散液が得られるように追加の重合段階が加わり、各油滴が重合体シェルによって封入され、式（I）の化合物、および任意選択的に、そのための担体または希釈剤を含有する。重合体シェルは、界面重縮合反応によって、またはコアセルベーション法のいずれかによって生成することができる。組成物は、式（I）の化合物の制御放出を提供し

50

、また種子処理に使用することができる。式（I）の化合物は、化合物の徐放、制御放出を提供するように、生分解性重合体マトリックス中に製剤化することもできる。

【0068】

組成物は、（例えば、表面上での湿潤、滞留、もしくは分布、処理面上での雨に対する抵抗性、または式（I）の化合物の取り込みもしくは流動性を改善することによって）組成物の生物学的性能を向上するために、1つ以上の添加剤を含むことができる。そのような添加剤として、界面活性剤、（油剤、例えば特定の鉱油または天然植物油（大豆および菜種油等）に基づく）噴霧添加剤、他の生物強化アジュバント（式（I）の化合物の作用を補助または改変できる成分）を含むこれらの混合物が挙げられる。

【0069】

式（I）の化合物は、例えば、乾燥種子処理用の粉剤（DS）、水溶性粉剤（SS）、もしくはスラリー処理用の水和剤（WS）を含む粉末組成物として、またはフロアブル剤（FS）、液剤（LS）、もしくはカプセル懸濁剤（CS）を含む液体組成物として、種子処理剤としての使用のために製剤化することもできる。DS、SS、WS、FS、およびLS組成物の調製法は、それぞれ、上述したDP、SP、WP、SC、およびDC組成物の調製法と非常に類似している。種子処理のための組成物は、組成物の種子への付着を補助するための物質（例えば、鉱油または膜を形成するバリア）を含むことができる。

【0070】

湿潤剤、分散剤、および乳化剤は、カチオン型、アニオン型、両性型、または非イオン型の表面SFAであってもよい。

カチオン型の好適なSFAとして、四級アンモニウム化合物（例えば、セチルトリメチルアンモニウムブロミド）、イミダゾリン、およびアミン塩が挙げられる。

【0071】

好適なアニオン性SFAとして、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩（例えば、ラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化芳香族化合物の塩（例えば、ナトリウムドデシルベンゼンスルホネート、カルシウムドデシルベンゼンスルホネート、ブチルナフタレンスルホネート、ならびにナトリウムジイソプロピルおよびトリ-イソプロピル-ナフタレンスルホネートの混合物）、エーテルスルファート、アルコールエーテル硫酸塩（例えば、ナトリウムラウレス-3-スルファート）、エーテルカルボン酸塩（例えば、ナトリウムラウレス-3-カルボキシレート）、リン酸エステル（1つ以上の脂肪族アルコールとリン酸（優位にはモノエステル）または五酸化リン（優位にはジエステル）との反応の産物、例えば、ラウリルアルコールと四リン酸との反応、さらに、これらの産物はエトキシ化されてもよい）、スルホスクシナメート、パラフィンまたはオレフィンスルホネート、タウレート、ならびにリグノスルホネートが挙げられる。

【0072】

両性型の好適なSFAとして、ベタイン、プロピオネート、およびグリシネートが挙げられる。

【0073】

非イオン型の好適なSFAとして、脂肪族アルコール（オレイルアルコールもしくはセチルアルコール等）またはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノール、もしくはオクチルクレゾール等）と、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、もしくはそれらの混合物等のアルキレンオキシドとの縮合物；長鎖脂肪酸またはヘキシトール無水物から誘導される部分的エステル；上記部分的エステルとエチレンオキシドとの縮合物；ブロック重合体（エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドを含む）；アルカノールアミド；単一エステル（例えば、脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミンオキシド（例えば、ラウリルジメチルアミンオキシド）、ならびにレシチンが挙げられる。

【0074】

好適な懸濁化剤として、親水コロイド（多糖、ポリビニルピロリドン、またはカルボキシメチルセルロースナトリウム等）および膨潤粘土（ベントナイトまたはアタパルジャイ

10

20

30

40

50

ト等)が挙げられる。

【0075】

式(I)の化合物は、殺虫性化合物を施用する既知の手段のいずれかによって施用することができる。例えば、害虫、または害虫の居場所(害虫の生息場所、もしくは害虫が寄生しやすい生育中の植物等)、または葉、茎、枝、もしくは根を含む植物のいずれかの部分、播種前の種子、または植物が生育しているかもしくは植えられるべき他の媒体(根の周りの土壌、一般的な土壌、水田の水もしくは水耕栽培システム等)に、(製剤化してまたは製剤化せずに)直接施用することができるか、あるいは、噴霧するか、散布するか、浸漬により施用するか、クリームもしくはペースト製剤として施用するか、蒸気として施用するか、または組成物(粒状組成物もしくは水溶性のバッグに充填された組成物等)の土壌もしくは水性環境における分布もしくは組込みを介して施用することができる。

10

【0076】

式(I)の化合物はまた、植物内に注射することもできるか、または電気力学的な噴霧技術もしくは他の微量散布法を用いて植生に噴霧することもできるか、または地上もしくは空中の灌漑システムによって施用することもできる。

【0077】

水性調製物(水溶液または分散液)として使用するための組成物は、一般的に、高い比率で活性成分を含有する濃縮物の形態で供給され、該濃縮物は、使用前に水に加えられる。DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG、およびCSを含み得るこれらの濃縮物は、長期間の保存に耐えること、そして、そのような保存の後で、水に添加して、従来の噴霧器具で施用可能な十分な時間均質性を保持する水性調製物を形成できることを必要とされることが多い。そのような水性調製物は、使用される目的によって、種々の量の式(I)の化合物(例えば、0.0001~10重量%)を含有することができる。

20

【0078】

式(I)の化合物は、肥料(例えば、窒素、カリウム、またはリンを含有する肥料)を含む混合物中に使用することができる。好適な剤型として、肥料の顆粒が挙げられる。混合物は、好ましくは最高で25重量%の式(I)の化合物を含有する。

【0079】

したがって、本発明は、肥料と式(I)の化合物とを含む肥料組成物も提供する。本発明の組成物は、生物学的活性を有する他の化合物、例えば、殺真菌活性を有するか、もしくは植物成長調整活性、除草活性、殺虫活性、殺線虫活性、または殺ダニ活性を保持する、微量栄養素または化合物を含有することができる。

30

【0080】

式(I)の化合物は、組成物の唯一の活性成分であってもよい、または必要に応じて、殺虫剤、殺真菌剤、共力剤、除草剤、もしくは植物成長調整剤等の1つ以上の追加の活性成分と混合されてもよい。追加の活性成分は、より広い活性スペクトルまたは害虫の居場所における高い残留性を有する組成物を提供することができ；(例えば、効果を加速させるもしくは撥水性を克服することによって)式(I)の化合物の活性に相乗作用を与えるかまたは該活性を補完することができ、あるいは個々の構成成分に対する抵抗性の発生を克服または防ぐのに役立つことができる。具体的な追加の活性成分は、意図する組成物の用途に依存する。好適な殺虫剤の例として、以下が挙げられる：

40

a) ペルメトリン、シベルメトリン、フェンバレーラート、エスフェンバレーラート、デルタメトリン、シハロトリン(具体的にはλ-シハロトリン)、ピフェントリン、フェンプロパトリン、シフルトリン、テフルトリン、魚類に安全なピレスロイド(例えば、エトフェンプロックス)、天然ピレトリン、テトラメトリン、S-バイオアレスリン、フェンフルトリン、プラレトリン、または5-ベンジル-3-フリルメチル-(E)-(1R, 3S)-2, 2-ジメチル-3-(2-オキシチオラン-3-イリデンメチル)シクロプロパンカルボキシレート等のピレスロイド、

b) プロフェノホス、スルプロホス、アセフェート、メチルパラチオン、アジンホスメチ

50

ル、デメトン - s - メチル、ヘプテノホス、チオメトン、フェナミホス、モノクロトホス、プロフェノホス、トリアゾホス、メタミドホス、ジメトエート、ホスファミドン、マラチオン、クロルピリホス、ホサロン、テルブホス、フェンスルホチオン、ホノホス、ホレート、ホキシム、ピリミホス - メチル、ピリミホス - エチル、フェニトロチオン、ホスチアゼート、またはダイアジノン等の有機リン酸エステル、

c) ピリミカーブ、トリアザメート、クロエトカルブ、カルボフラン、フラチオカルブ、エチオフエンカルブ、アルジカルブ、チオフロクス、カルボスルファン、ベンジオカルブ、フェノブカルブ、プロボキスル、メトミル、またはオキサミル等のカルバメート（アリアルカルバメートを含む）、

d) ジフルベンズロン、トリフルムロン、ヘキサフルムロン、フルフェノキスロン、またはクロルフルアズロン等のベンゾイル尿素、

e) シヘキサチン、フェンブタチンオキシド、またはアゾシクロチン等の有機スズ化合物、

f) テブフェンピラドおよびフェンピロキシメート等のピラゾール、

g) アベルメクチンもしくはミルベマイシン等のマクロライド、例えば、アバメクチン、エマメクチンベンゾエート、イベルメクチン、ミルベマイシン、スピノサド、アザジラクチン、またはスピネトラム、

h) ホルモンまたはフェロモン、

i) エンドスルファン（具体的には α - エンドスルファン）、ベンゼンヘキサクロリド、DDT、クロルデン、またはジェルドリン等の有機塩素化合物、

j) クロルジメホルムまたはアミトラズ等のアミジン、

k) クロロピクリン、ジクロロプロパン、臭化メチル、またはメタム等の燻蒸剤、

l) イミダクロプリド、チアクロプリド、アセタミプリド、ニテンピラム、ジノテフラン、チアメトキサム、クロチアニジン、ニチアジン、またはフロニカミド等のネオニコチノイド化合物、

m) テブフェノジド、クロマフェノジド、またはメトキシフェノジド等のジアシルヒドラジン、

n) ジオフエノランまたはピリプロキシフェン等のジフェニルエーテル、

o) インドキサカルブ、

p) クロルフェナピル、

q) ピメトロジン、

r) スピロテトラマト、スピロジクロフェン、またはスピロメシフェン、

s) フルベンジアミド、クロラントラニリプロール、またはシアントラニリプロール等のジアミド、

t) スルホキサフロール、

u) メタフルミゾン。

【0081】

意図する組成物の用途に適切である場合は、上に列挙した殺虫剤の主要な化学的分類に加えて、特定の標的を有する他の殺虫剤が組成物中に使用されてもよい。例えば、特定の作物に選択的な殺虫剤、例えば、イネに使用するためのニカメイガに特異的な殺虫剤（カルタップ等）またはバッタに特異的な殺虫剤（ブプロフェジン等）が用いられてもよい。代替として、特定の昆虫種／段階に特異的な殺虫剤または殺ダニ剤（例えば、クロフェンテジン、フルベンジミン、ヘキシチアゾクス、またはテトラジホン等の殺ダニ性の卵・幼虫駆除剤；ジコホルまたはプロパルギット等の運動阻害性殺ダニ剤（acaricidal motilicides）；ブロモプロピラートまたはクロロベンジラート等の殺ダニ剤；ヒドラメチルノン、シロマジン、メトプレネ、クロルフルアズロン、またはジフルベンズロン等の成長抑制剤）が組成物に含まれていてもよい。

【0082】

本発明の組成物に含むことができる殺虫性化合物の例は、(E) - N - メチル - 2 - [2 - (2, 5 - ジメチルフェノキシメチル) フェニル] - 2 - メトキシ - イミノアセトア

10

20

30

40

50

ミド (SSF - 129)、4 - ブロモ - 2 - シアノ - N, N - ジメチル - 6 - トリフルオ
ロメチルベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、 α - [N - (3 - クロロ - 2, 6 -
キシリル) - 2 - メトキシアセトアミド] - γ - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シア
ノ - N, N - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド (IKF - 9
16、シアミダゾスルファミド)、3 - 5 - ジクロロ - N - (3 - クロロ - 1 - エチル -
1 - メチル - 2 - オキソプロピル) - 4 - メチルベンズアミド (RH - 7281、ゾキサ
ミド)、N - アリル - 4, 5, - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフェン - 3 - カル
ボキサミド (MON65500)、N - (1 - シアノ - 1, 2 - ジメチルプロピル) - 2
- (2, 4 - ジクロロフェノキシ) プロピオンアミド (AC382042)、N - (2 -
メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、アシベンゾラル (CGA
245704)、アラニカルブ、アルジモルフ、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシ
ストロビン、ベナラキシル、ベノミル、ビロキサゾール、ビテルタノール、プラスチジ
ンS、ブロムコナゾール、ブピリメート、カプタホール、カプタン、カルベンダジム、カ
ルベンダジムクロルハイドレート、カルボキシ、カルプロパミド、カルボン、CGA4
1396、CGA41397、キノメチオネート、クロロタロニル、クロロゾリネート、
クロジラコン、銅含有化合物 (塩基性塩化銅、銅オキシキノレート、硫酸銅、銅タラート
、およびボルドー混合物等)、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、デバカ
ルブ、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド1, 1' - ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロ
メジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾコート、ジ
フルメトリム、O, O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、ジメフル
アゾール、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、ジニコナゾール、ジノカ
ップ、ジチアノン、ドデシルジメチルアンモニウムクロリド、ドデモルフ、ドジン、ドグ
アジン (doguadine)、エジフェンホス、エポキシコナゾール、エチリモール、
エチル - (Z) - N - ベンジル - N ([メチル (メチル - チオエチリデンアミノオキシカ
ルボニル) アミノ] チオ) - β - アラニネート、エトリジアゾール、ファモキサドン、フ
ェンアミドン (RPA407213)、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラ
ム、フェンヘキサミド (KBR2738)、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェ
ンプロピモルフ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリ
ムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトベル、フルオロイミド、フルキノコ
ナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルトリアール、ホルペット、フベリダゾ
ール、フララキシル、フラメトピル、グアザチン、ヘキサコナゾール、ヒドロキシイソキ
サゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノ
クタジントリアセテート、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリ
カルブ (SZX0722)、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、カ
スガマイシン、クレソキシム - メチル、LY186054、LY211795、LY24
8908、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メパニピリム、メプロニル、メタラキ
シル、メトコナゾール、メチラム、メチラム - 亜鉛、メトミノストロビン、マイクロブタ
ニル、ネオアソジン、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル、ニトロタールイソプロピル
、ヌアリモール、オフラセ、有機水銀化合物、オキサジキシル、オキサスルフロ、オキ
ソリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、ペフラゾエート、ペンコナゾール
、ペンシクロン、フェナジンオキシド、ホセチル - A1、リン含有酸、フタリド、ピコキ
シストロビン (ZA1963)、ポリオキシシンD、ポリラム、プロベナゾール、プロクロ
ラズ、プロシミドン、プロバモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、
ピラゾホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキノ、ピロキシフル、ピロールニ
トリン、四級アンモニウム化合物、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、シ
プロコナゾール (F - 155)、ナトリウムペンタクロロフェネート、スピロキサミン、ス
トレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトラコナゾ
ール、チアベンダゾール、チフルザミド、2 - (チオシアノメチルチオ) ベンゾチアゾ
ール、チオフアネート - メチル、チラム、チミベンコナゾール、トルクロホス - メチル、ト
リルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアズブチル、トリアゾキシド

10

20

30

40

50

、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン（C G A 2 7 9 2 0 2）、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、バリダマイシンA、バパム、ピンクロゾリン、ジネブ、およびジラムである。

【0083】

式（I）の化合物は、種子伝染病、土壌伝染病、または葉の真菌性病から植物を保護するために、土壌、ピート、または他の発根媒体と混合することができる。

組成物において使用するための好適な共力剤の例として、ピペロニルブトキシド、セサメックス、サフロキサシ、およびドデシルイミダゾールが挙げられる。

組成物に包含するのに好適な除草剤および植物成長調整剤は、意図する標的および要求される効果に依存する。

10

【0084】

包含することのできるイネ選択的除草剤の例は、プロパニルである。ワタにおいて使用するための植物成長調整剤の例は、P I X（商標）である。

いくつかの混合物は、それらが従来の同じ剤型に容易に適用されないように、有意に異なる物理的、化学的、または生物学的特性を有する活性成分を含んでもよい。これらの状況では、他の剤型が調製されてもよい。例えば、一方の活性成分が水溶性の固形であり、他方が水溶性の液体である場合であっても、（S Cと同様の調製法を用いて）固形活性成分を懸濁液として分散させる一方で、（E Wと同様の調製法を用いて）液体活性成分をエマルジョンとして分散させることにより、各活性成分を同じ連続した水相中に分散させることが可能であり得る。得られる組成物は、サスポエマルジョン（S E）製剤である。

20

【実施例】

【0085】

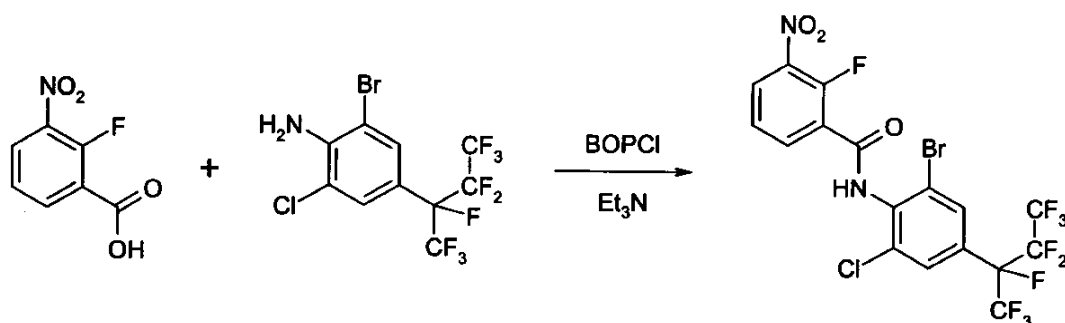
本項目を通して以下の略語を使用した：s＝一重線、b s＝幅広一重線、d＝二重線、d d＝二重の二重線、d t＝二重の三重線、t＝三重線、t t＝三重の三重線、q＝四重線、s e p t＝七重線、m＝多重線、M e＝メチル、E t＝エチル、P r＝プロピル、B u＝ブチル、M. p.＝融点、R T＝滞留時間、M H⁺＝分子カチオン（すなわち、測定された分子量）

【0086】

実施例 I 1：N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1 , 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロ - メチルプロピル) フェニル] - 2 - フルオロ - 3 - ニトロベンズアミド

30

【化 1 1】



40

ジクロロメタン（230 mL）中の2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1 , 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチル - プロピル) フェニルアミン（実施例 I 6）（20 g、47.1 mmol）および2 - フルオロ - 3 - ニトロ安息香酸（17.4 g、94.2 mmol）の溶液に、トリエチルアミン（19.7 mL、141 mmol）およびビス（2 - オキソ - 3 - オキサゾリジニル）ホスホン酸クロリド（「BOP - Cl」（23.98 g、94 mmol）を加えた。反応混合物を6時間加熱還流した。反応

50

混合物を周囲温度まで冷却し、塩酸水溶液（1 N）の添加により反応を停止させた。次いで、ジクロロメタンで混合物を3回抽出した。合わせた有機抽出物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル7：3）により残渣を精製し、N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 2 - フルオロ - 3 - ニトロベンズアミドを得た（12 g、収率43%）。¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) : 8.48 (t, 1H), 8.30 (t, 1H), 8.18 (db, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.54 (t, 1H) ppm.

【0087】

同じ手順により、以下の化合物を作製した：

N - [2, 6 - ジクロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 2 - フルオロ - 3 - ニトロ - ベンズアミド

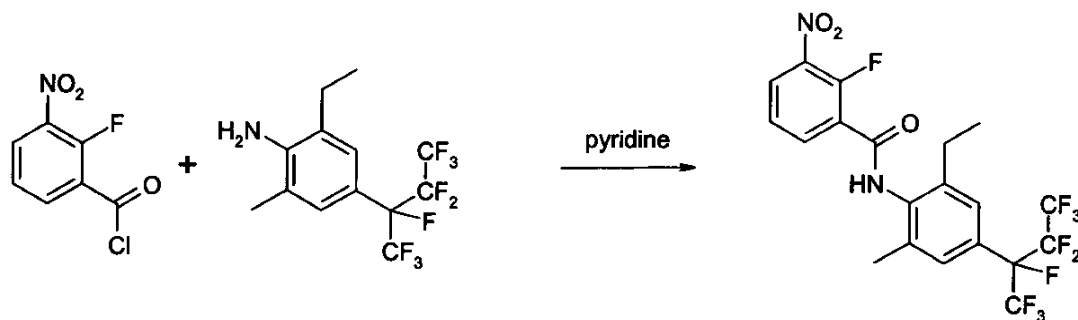
¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) : 8.48 (t, 1H), 8.28 (t, 1H), 8.14 (db, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.54 (t, 1H) ppm.

【0088】

実施例 I 2 : N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチル - フェニル] - 2 - フルオロ - 3 - ニトロベンズアミド

ピリジン

【化12】



ジクロロメタン（20 mL）中の2 - フルオロ - 3 - ニトロ安息香酸（6.3 g、34 mmol）の懸濁液に、塩化オキサリル（4.3 mL）を周囲温度で加え、続いてN, N - ジメチルホルムアミド（0.2 mL）を加えた。反応混合物を周囲温度で1時間攪拌し、次いで3時間加熱還流した。反応混合物を周囲温度まで冷却し、次いで濃縮した。残渣をテトラヒドロフラン（50 mL）に懸濁させた。2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルアニリン（国際公開第08/074427号に記載される調製物）（10 g、28.3 mmol）をテトラヒドロフラン（50 mL）に溶解し、ピリジン（6.8 mL、84.9 mmol）を加えた。反応混合物を周囲温度で3時間攪拌し、次いで3時間還流攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（100 mL）の添加により反応物の反応を停止させ、酢酸エチル（2 × 200 mL）で混合物を2回抽出した。合わせた有機抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル4：1～0：1）により残渣を精製し、N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 2 - フルオロ - 3 - ニトロベンズアミドを得た（6.32 g、収率43%）。

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) : 8.34 (m, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.02 (bs, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.48 (s, 2H), 2.70

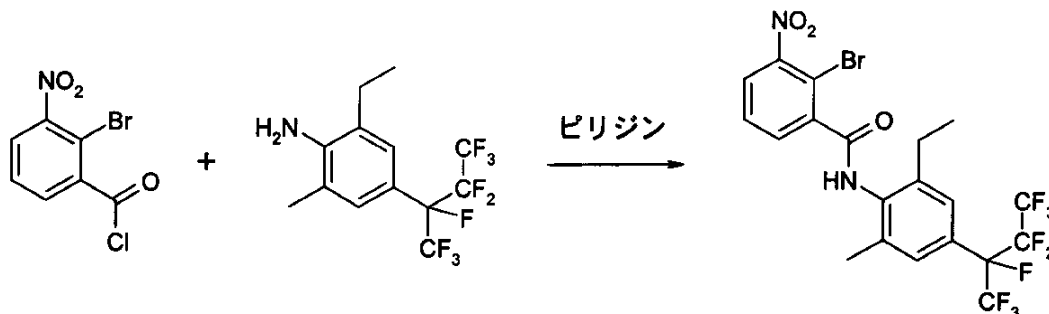
(q, 2H), 1.22 (t, 3H).

【0089】

実施例 I 3: N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチル-フェニル]-2-ブロモ-3-ニトロベンズアミド

ピリジン

【化13】



10

トルエン (29 mL) 中の 2-ブロモ-3-ニトロ安息香酸 (2.870 g、0.0117 mol) の懸濁液に、N,N-ジメチルホルムアミド (90 μ l) を周囲温度で加え、続いて、塩化チオニル (1.69 mL、0.02332 mol) を徐々に加えた。反応混合物を 100 $^{\circ}$ C で 1 時間攪拌した。反応混合物を周囲温度まで放冷し、トルエンを蒸発させた。適量の塩化アシルを THF に溶解し、さらに精製せずに使用した。

20

テトラヒドロフラン (0.5 mL) 中の 2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルアリニン (国際公開第 08/074427 号に記載される調製物) (106 mg、0.3 mmol) の溶液に、ピリジン (72.6 μ l、0.9 mmol) を 0~5 $^{\circ}$ C で加えた。テトラヒドロフラン (0.5 mL) 中の 2-ブロモ-3-ニトロ安息香酸クロリドの溶液 (87 mg、0.33 mmol) を加えた。反応混合物を周囲温度で 3 時間攪拌し、次いで 15 時間還流攪拌した。15 時間後、反応が完了していなかったため、N,N-ジメチルアセトアミド (「DMA」) (0.1 当量) と、さらに 2-ブロモ-3-ニトロ安息香酸クロリド (0.2 当量) とを加えた。反応混合物を周囲温度で 41 時間攪拌した。41 時間後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (10 mL) の添加により反応を停止させ、酢酸エチル (2 $\times$ 20 mL) で混合物を 2 回抽出した。合わせた有機抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー (溶離液: シクロヘキサン/酢酸エチル 6:1) により残渣を精製し、N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-ブロモ-3-ニトロベンズアミドを得た (0.133 g、収率 76%)。

30

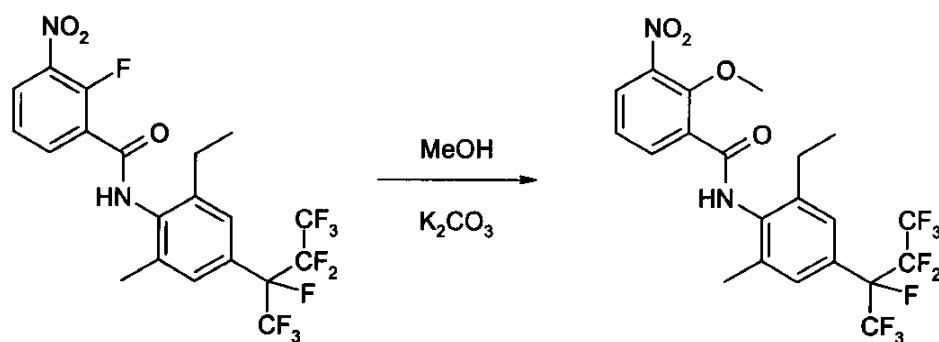
^1H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 7.78 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.32 (s, 2H), 7.17 (bs, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.19 (t, 3H).

40

【0090】

実施例 I 4: N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチル-フェニル]-2-メトキシ-3-ニトロベンズアミド

【化 1 4】



10

メタノール（195 mL）中のN-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-フルオロ-3-ニトロベンズアミド（実施例I2）（5 g、9.6 mmol）の懸濁液に、炭酸カリウム（2.6 g、16.2 mmol）を周囲温度で加えた。反応混合物を周囲温度で16時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残渣をジクロロメタンに溶解した。有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル3：1）により残渣を精製し、N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-メトキシ-3-ニトロベンズアミドを得た（5.1 g、収率99%）。¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：8.90（bs, 1H），8.32（d, 1H），7.97（d, 1H），7.38（m, 3H），4.19（s, 3H），2.70（q, 2H），2.24（s, 3H），1.20（t, 3H）ppm.

20

【0091】

同じ手順により、以下の化合物を作製した：

N-[2-ブromo-6-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-2-メトキシ-3-ニトロベンズアミド

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：9.23（bs, 1H），8.45（dd, 1H），8.07（dd, 1H），7.84（s, 1H），7.71（s, 1H），7.46（t, 1H），4.18（s, 3H）ppm.

30

【0092】

N-[2,6-ジクロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-2-メトキシ-3-ニトロベンズアミド

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：9.22（bs, 1H），8.42（d, 1H），8.07（d, 1H），7.68（s, 2H），7.44（t, 1H），4.15（s, 3H）ppm.

【0093】

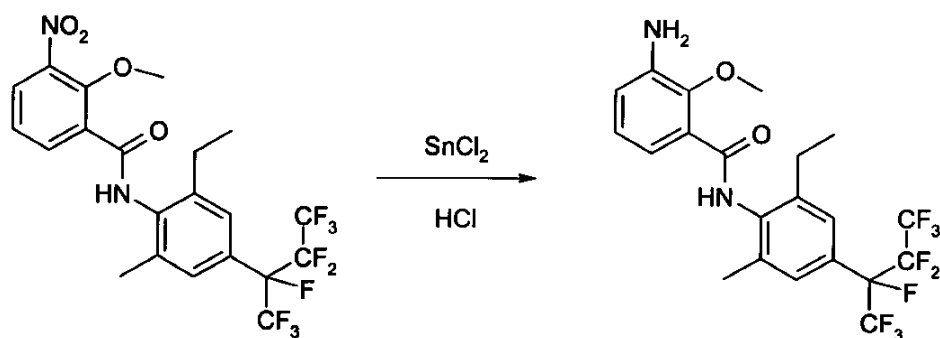
同様の手順をN-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-ブromo-3-ニトロベンズアミド（実施例I3）に適用し、N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-メトキシ-3-ニトロベンズアミドを得た（収率92%）。

40

【0094】

実施例I5： 3-アミノ-N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-メトキシベンズアミド

【化 15】



10

イソプロパノール（50 mL）中のN - [2 - エチル - 4 - （1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル） - 6 - メチルフェニル] - 2 - メトキシ - 3 - ニトロベンズアミド（実施例 I 4）（5.1 g、9.57 mmol）の溶液に、塩化スズ（6.5 g、34.5 mmol）を周囲温度で加えた。混合物を0℃まで冷却し、濃縮塩酸水溶液（10 mL）を徐々に加えた。反応混合物を80℃で0.5時間撹拌した。イソプロパノールの全体積の3分の1を蒸発させた。濃縮混合物に水（100 mL）を加え、水酸化ナトリウム水溶液（4 N）を加えてpHを7～8に調整した。酢酸エチル（3×200 mL）で水相を3回抽出した。合わせた有機抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル2：1～1：1）により残渣を精製し、3 - アミノ - N - [2 - エチル - 4 - （1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル） - 6 - メチルフェニル] - 2 - メトキシベンズアミドを得た（2.3 g、収率48%）。

20

^1H NMR（400 MHz, CDCl_3 ）：9.12（bs, 1H），7.37（dd, 1H），7.26（s, 2H），6.91（t, 1H），6.80（dd, 1H），3.90（bs, 2H），3.80（s, 3H），2.60（q, 2H），2.24（s, 3H），1.11（t, 3H） ppm.

【0095】

30

同じ手順により、以下の化合物を作製した：

3 - アミノ - N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - （1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル） - フェニル] - 2 - メトキシベンズアミド

^1H NMR（400 MHz, CDCl_3 ）：7.73（bs, 1H），7.61（s, 1H），7.47（dd, 1H），6.98（t, 1H），6.88（dd, 1H），3.91（s, 3H），3.85（bs, 2H） ppm.

【0096】

3 - アミノ - N - [2, 6 - ジクロロ - 4 - （1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル） - フェニル] - 2 - メトキシベンズアミド

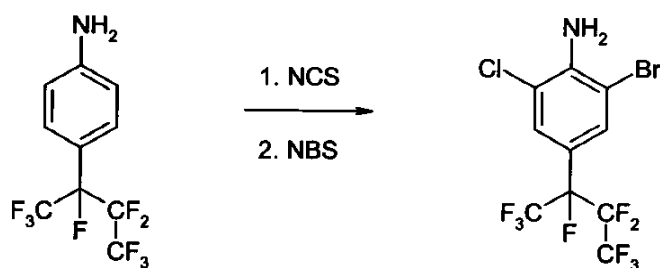
^1H NMR（400 MHz, CDCl_3 ）：7.65（s, 2H），7.54（d, 1H），7.10（t, 1H），6.98（d, 1H），3.98（s, 3H），3.93（bs, 2H） ppm.

40

【0097】

実施例 I 6： 2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - （1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル） - フェニルアミン

【化 16】



10

4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル)フェニルアミン(欧州特許第1,006,102号に従って調製)(175.8g、565mmol)をアセトニトリル(1000mL)に溶解し、N-クロロ-スクシンイミド(「NCS」)(76.2g、570.7mmol)を加えた。反応混合物を90分加熱還流した。反応混合物を真空下で濃縮し、ジエチルエーテルに残渣を懸濁させ、濾過により固体を除去した。濾液を濃縮し、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離液:シクロヘキサン/ジクロロメタン9:1)により残渣を精製し、2-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニルアミンを得た。N-ブロモスクシンイミド(「NBS」)(100.5g、565mmol)を試薬として使用して、同じ手順を繰り返した。今回は、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離液:シクロヘキサン/ジクロロメタン2:1)により残渣を精製し、2-ブ

20

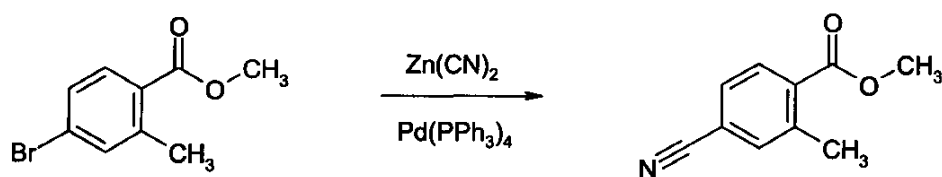
ロモ-6-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニルアミンを得た(143.3g、収率59.7%)。

^1H NMR (400MHz, CDCl_3): 7.70 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 4.82 (s, 2H) ppm.

【0098】

実施例 I 7: 4-シアノ-2-メチル安息香酸メチルエステル

【化 17】



30

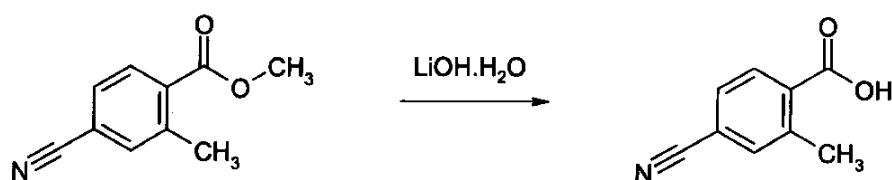
窒素雰囲気下のN,N-ジメチルホルムアミド(4L)中の4-ブromo-2-メチル安息香酸(108g、471mmol)の溶液に、シアン化亜鉛(II)(88.5g、753.6mmol)およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(65g、56.60mmol)を加えた。反応混合物を100℃で16時間攪拌した。反応混合物をトルエンで希釈し、相を分離した。水相をトルエンで2回抽出した。合わせた有機相を鹼水および飽和水酸化アンモニウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離液:酢酸エチル/シクロヘキサン1:5)により残渣を精製し、4-シアノ-2-メチル安息香酸メチルエステルを得た(73g、収率89%)。 ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): 7.78 (d, 1H), 7.52 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 2.62 (s, 3H) ppm.

40

【0099】

実施例 I 8: 4-シアノ-2-メチル安息香酸

【化 18】



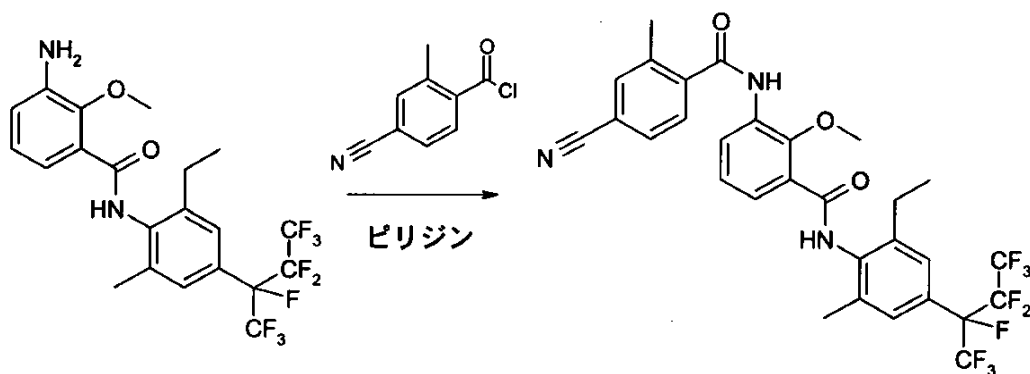
水 (0.360 mL) およびテトラヒドロフラン (1.4 L) の混合物中の 4 - シアノ - 2 - メチル安息香酸 (実施例 I 7) (61 g、348 mmol) の溶液に、水酸化リチウム水和物 (31.4 g、748.2 mmol) を加えた。反応混合物を周囲温度で 3 時間攪拌した。反応混合物を濃縮した。塩酸水溶液 (1 N) の添加により残渣を酸性化し、メタノールおよびクロロホルムの混合物 (5 : 95) で抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。酢酸エチルおよびシクロヘキサンの混合物中で残渣を結晶化し、4 - シアノ - 2 - メチル安息香酸を得た (55.5 g、収率 99%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) : 7.89 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 2.51 (s, 3H) ppm.

【0100】

実施例 P 1 : N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (4 - シアノ - 2 - メチルベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表 A の化合物番号 A 5)

ピリジン

【化 19】



窒素雰囲気下のジクロロメタン (5 mL) 中の 4 - シアノ - 2 - メチル安息香酸 (実施例 I 8) (0.141 g、0.8 mmol) および N, N - ジメチルホルムアミド (2 滴) の溶液に、塩化オキサリル (0.074 mL、0.88 mmol) を加えた。反応混合物を周囲温度で 1 時間攪拌し、次いで 60 °C で 1.5 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残渣をテトラヒドロフラン (10 mL) に溶解した。その溶液を、テトラヒドロフラン (10 mL) 中の 3 - アミノ - N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチル - プロピル) - 6 - メチルフェニル] - 2 - メトキシベンズアミド (実施例 I 5) (0.37 g、0.73 mmol) およびピリジン (0.12 mL、1.46 mmol) の溶液に滴下して加えた。反応混合物を周囲温度で 16 時間攪拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液 (1 M) に注入し、酢酸エチルで混合物を 3 回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー (溶離液 : 酢酸エチル / シクロヘキサン 1 : 3) により残

渣を精製し、表Aの化合物番号A5を得た(0.240g、収率51%)。M. p. 104~105℃。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 8.68(d, 1H), 8.62(s, 1H), 8.01(s, 1H), 7.92(d, 1H), 7.66(m, 3H), 7.41(m, 3H), 4.00(s, 3H), 2.72(q, 2H), 2.62(s, 3H), 2.39(s, 3H), 1.25(t, 3H) ppm.

【0101】

同じ手順により、以下の化合物を作製した:

N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-3-(4-フルオロ-2-クロロベンゾイルアミノ)-2-メトキシベンズアミド(表Aの化合物番号A3)

10

¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 8.76(m, 2H), 8.71(d, 1H), 7.98(m, 1H), 7.71(dd, 1H), 7.39(m, 3H), 7.27(dd, 1H), 7.18(m, 1H), 4.03(s, 3H), 2.73(q, 2H), 2.39(s, 3H), 1.25(t, 3H) ppm.

【0102】

N-[2-ブromo-6-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-3-(4-フルオロ-2-クロロベンゾイルアミノ)-2-メトキシベンズアミド(表Bの化合物番号B2)

M. p. 178~179℃。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 9.12(bs, 1H), 8.79(bs, 1H), 8.73(d, 1H), 7.79-7.72(m, 2H), 7.84(s, 1H), 7.72(s, 1H), 7.38(t, 1H), 7.25(m, 1H), 7.17(m, 1H), 4.07(s, 3H) ppm.

20

【0103】

N-[2-ブromo-6-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-3-(4-シアノ-2-メチルベンゾイルアミノ)-2-メトキシベンズアミド(表Bの化合物番号B1)

M. p. 109~110℃。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 9.04(bs, 1H), 8.69(d, 1H), 8.10(s, 1H), 7.93(dd, 1H), 7.84(s, 1H), 7.72(s, 1H), 7.63(m, 3H), 7.40(t, 1H), 4.04(s, 3H), 2.61(s, 3H) ppm.

30

【0104】

N-[2,6-ジクロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-3-(4-フルオロ-2-クロロベンゾイルアミノ)-2-メトキシベンズアミド(表Cの化合物番号C1)

¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 9.12(bs, 1H), 8.79-8.72(m, 2H), 7.97(m, 1H), 7.91(dd, 1H), 7.68(s, 2H), 7.48(t, 1H), 7.25(m, 1H), 7.16(m, 1H), 4.04(s, 3H) ppm.

【0105】

N-[2,6-ジクロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)フェニル]-3-(4-シアノ-2-メチルベンゾイルアミノ)-2-メトキシベンズアミド(表Cの化合物番号C2)

¹H NMR(400MHz, CDCl₃): 8.99(bs, 1H), 8.70(d, 1H), 8.02(s, 1H), 7.92(dd, 1H), 7.68(s, 2H), 7.62(s, 3H), 7.40(t, 1H), 4.02(s, 3H), 2.60(s, 3H) ppm.

40

【0106】

塩化アシルを直接使用したことと、ピリジンの代わりにトリエチルアミンを使用したことを除いて、同じ手順により、以下の化合物を作製した:

50

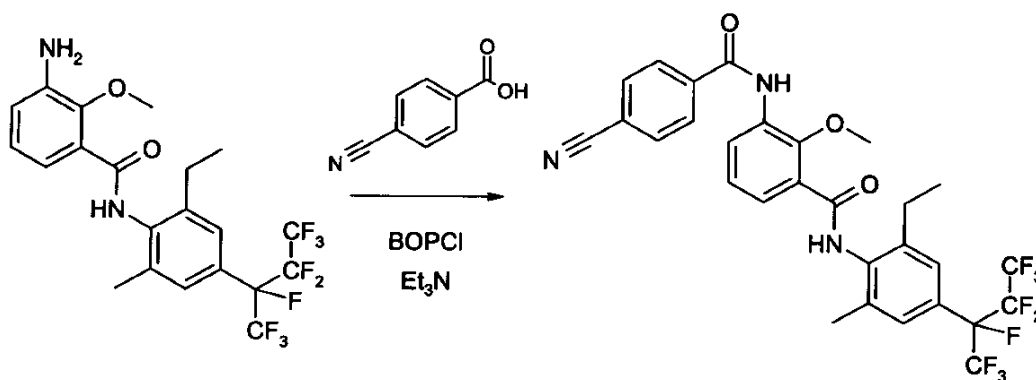
N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (4 - フルオロベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A 1)

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 8.68 (s, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.89 (m, 2H), 7.80 (dd, 1H), 7.30 (m, 3H), 7.17 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.15 (t, 3H).

【0107】

実施例 P 2 : N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチル - フェニル] - 3 - (4 - シアノベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド
(表Aの化合物番号A 4)

【化20】



テトラヒドロフラン (1.2 mL) 中の 3 - アミノ - N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチル - プロピル) - 6 - メチルフェニル] - 2 - メトキシベンズアミド (実施例 I 5) (30 mg、0.06 mmol) の溶液に、トリエチルアミン (25 μl 、0.18 mmol) を加えた。4 - シアノ安息香酸 (17.6 mg、0.12 mmol) およびビス (2 - オキソ - 3 - オキサゾリジニル) ホスホン酸クロリド (「BOP - Cl」) (30.4 mg、0.12 mmol) を加えた。反応混合物を 6 時間加熱還流した。反応混合物を周囲温度まで冷却して、濃縮した。残渣をジクロロメタンに溶解し、塩酸水溶液 (1 N) および炭酸水素ナトリウム水溶液 (飽和) で洗浄した。有機抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー (溶離液：シクロヘキサン / 酢酸エチル 5 : 3) により残渣を精製し、表Aの化合物番号A 4を得た (35 mg、収率 93%)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 8.56 (m, 2H), 8.48 (bs, 1H), 7.97 (m, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.30 (m, 3H), 3.94 (s, 3H), 2.65 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.13 (t, 3H) ppm.

【0108】

同じ手順により、以下の化合物を作製した：

N - [2 - エチル - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - 6 - メチルフェニル] - 3 - (2 - メチル - 3 - ニトロベンゾイルアミノ) - 2 - メトキシベンズアミド (表Aの化合物番号A 2)

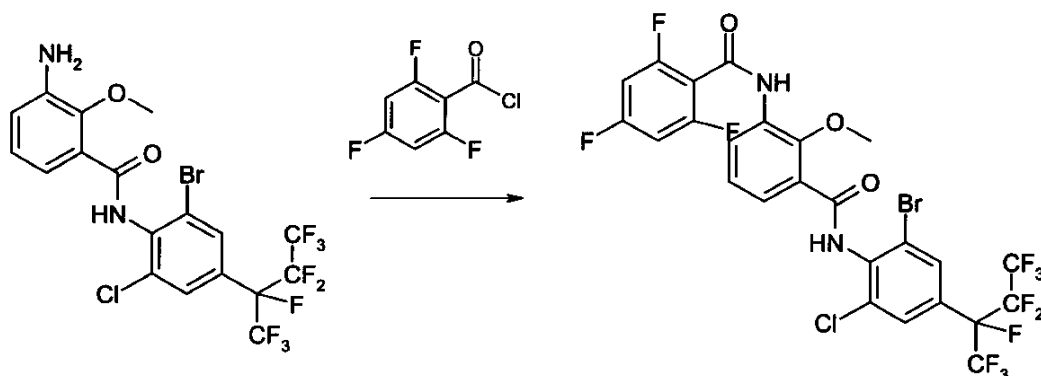
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : 8.62 (d, 1H), 8.53 (s, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.30 (m, 3H), 3.91 (s, 3H), 2.64 (q, 2H), 2

. 59 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.14 (t, 3H) ppm.

【0109】

実施例 P3: N - {3 - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) - フェニルカルバモイル] - 2 - メトキシフェニル} - 2, 4, 6 - トリフルオロベンズアミン

【化21】



10

窒素雰囲気下のジクロロメタン (50 mL) 中の 2, 4, 6 - トリフルオロ安息香酸 (8.114 g、46.08 mmol) および N, N - ジメチルホルムアミド (数滴) の溶液に、塩化オキサリル (4.55 mL、53.76 mmol) を加えた。反応混合物を周囲温度で 1 時間攪拌し、次いで 60℃ で 1.5 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残渣をテトラヒドロフラン (200 mL) に溶解した。その溶液を、テトラヒドロフラン (200 mL) 中の 3 - アミノ - N - [2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (1, 2, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - 1 - トリフルオロメチルプロピル) フェニル] - 2 - メトキシベンズアミド (実施例 I 5) (22.03 g、38.40 mmol) およびピリジン (6.18 mL、76.80 mmol) の溶液に滴下して加えた。反応混合物を周囲温度で 2 時間攪拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液 (1M) に注入し、酢酸エチルで混合物を 3 回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濃縮した。シリカゲル上の濾過により残渣を精製し、表 B の化合物番号 B189 を得た (28.0 g、収率 99%)。M. p. 179℃。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.14 (s, 1H), 8.72 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.97 (q, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.41 (t, 1H), 6.88 (t, 1H), 4.08 (s, 3H) ppm.

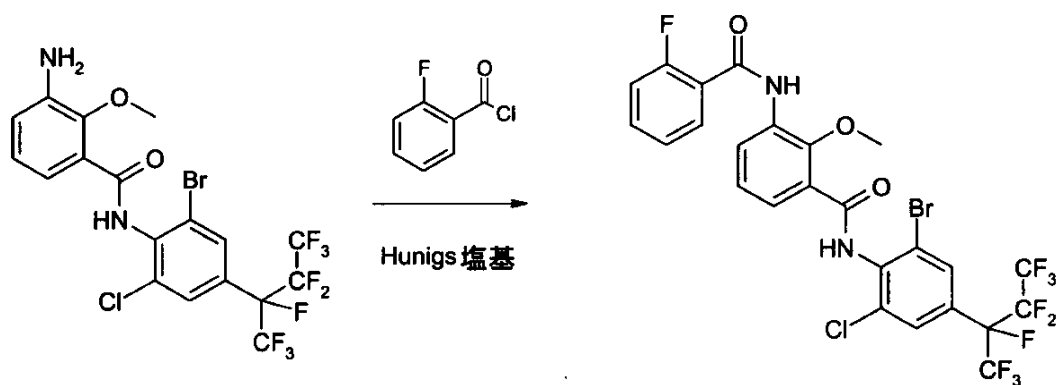
【0110】

実施例 P4: パラレル合成に適した酸塩化物からのベンズアミドの調製
ヒューニツヒ塩基

20

30

【化 2 2】



10

溶液Aは、アミノ誘導体（0.78 mmol）、例えば、表Bの化合物番号B3の場合、3-アミノ-N-[2-クロロ-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-ブロモフェニル]-2-メトキシベンズアミド（実施例I5）を、トルエン（15.6 mL）に溶解することによって調製した。溶液Bは、酸塩化物（45 μmol）、例えば、表Bの化合物番号B3の場合、2-フルオロベンゾイルクロリドを、トルエン（0.36 mL）に溶解することによって調製した。溶液A（0.6 mL、30 μmol）をウェルに入れ、溶液B（0.36 mL、45 μmol）およびジイソプロピルエチルアミン（「ヒューニッヒ塩基」）（30 μl、150 μmol）を連続してウェルに加えた。反応混合物を80℃で16時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、混合物をアセトニトリル（0.6 mL）およびN,N-ジメチルアセトアミド（0.2 mL）の混合物で希釈し、次いでHPLCで精製して所望の化合物を得た。この方法を使用して、多数の化合物を平行して調製した。

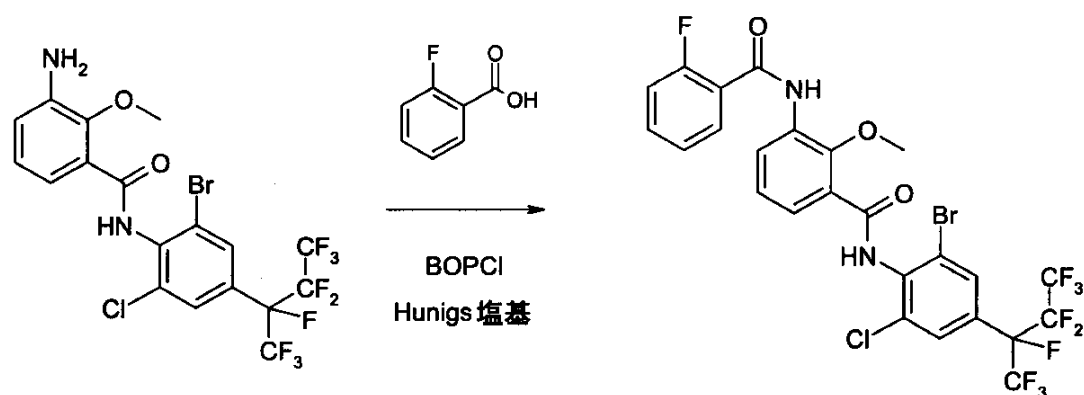
20

【0111】

実施例P5： パラレル合成に適したカルボン酸からのベンズアミドの調製

ヒューニッヒ塩基

【化 2 3】



30

40

溶液Aは、アミノ誘導体（0.65 mmol）、例えば、表Aの化合物番号A9の場合、3-アミノ-N-[2-エチル-4-(1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-トリフルオロメチルプロピル)-6-メチルフェニル]-2-メトキシベンズアミド（実施例I5）を、N,N-ジメチルアセトアミド（「DMA」）（9.6 mL）に溶解することによって調製した。溶液Bは、カルボン酸（37.5 μmol）、例えば、表Aの化合物番号A9の場合、2-クロロ安息香酸を、N,N-ジメチルアセトアミド（「DMA

50

」) (0.38 mL) に溶解することによって調製した。溶液 C は、ビス (2 - オキソ - 3 - オキサゾリジニル) ホスホン酸クロリド (「BOP - Cl」) (1.95 mmol) を N, N - ジメチルアセトアミド (「DMA」) (7.8 mL) に溶解することによって調製した。溶液 A (0.4 mL、0.025 mmol) をウェルに入れ、溶液 B (0.38 mL、37.5 μ mol)、溶液 C (0.2 mL、50 μ mol)、およびジイソプロピルエチルアミン (「ヒューニツヒ塩基」) (40 μ l、200 μ mol) を連続してウェルに加えた。反応混合物を 100 °C で 16 時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、混合物をアセトニトリル (0.6 mL) および N, N - ジメチルアセトアミド (0.2 mL) の混合物で希釈し、次いで HPLC で精製して所望の化合物を得た。

この方法を使用して、多数の化合物を平行して調製した。

【0112】

以下の HPLC - MS 法を表 A ~ 表 L の化合物の分析に使用した。

方法 1 :

【表 1】

MS	Waters社製ZQ質量分析計(単一四重極質量分析計)、イオン化法: エレクトロスプレー、極性:正イオン化、キャピラリー(kV) 3. 00、コーン(V) 30. 00、抽出器(V) 3. 00、ソース温度(℃) 100、脱溶媒温度(℃) 200、コーンガス流量(L/時) 200、脱溶媒ガス流量(L/時) 250、質量範囲:150~800Da			
LC	Agilent社製1100erシリーズHPLC:クォータナリポンプ、加熱カラムコンパートメントおよびヨードアレイ検出器 カラム:Waters Atlantis dc18、長さ:20 mm、内径:3 mm、粒径:3μm、温度(℃) 40、DAD波長範囲(nm):200~500、溶媒勾配:A=水中の0.1%ギ酸およびB:アセトニトリル中の0.1%ギ酸			
	時間(分)	A%	B%	流量(mL/分)
	0. 0	80	20	1. 7
	2. 5	0. 0	100	1. 7
	2. 8	0. 0	100	1. 7
	2. 9	80	20	1. 7

方法 2 :

【表 2】

MS	Waters社製ZQ質量分析計(単一四重極質量分析計)、イオン化法:エレクトロスプレー、極性:正イオン化、キャピラリー(kV) 3. 00、コーン(V) 30. 00、抽出器(V) 3. 00、ソース温度(℃) 100、脱溶媒温度(℃) 200、コーンガス流量(L/時) 200、脱溶媒ガス流量(L/時) 250、質量範囲:150~800Da			
LC	Agilent社製1100erシリーズHPLC:クォータナリポンプ、加熱カラムコンパートメントおよびヨードアレイ検出器 カラム:Waters Atlantis dc18、長さ:20 mm、内径:3 mm、粒径:3μm、温度(℃) 40、DAD波長範囲(nm):200~500、溶媒勾配:A=水中の0.1%ギ酸およびB:アセトニトリル中の0.1%ギ酸			
	時間(分)	A%	B%	流量(mL/分)
	0. 0	90	10	1. 7
	5. 5	0. 0	100	1. 7
	5. 8	0. 0	100	1. 7
	5. 9	90	10	1. 7

方法 3 :

【表 3】

MS	Waters社製ZQ質量分析計(単一四重極質量分析計) 機器パラメータ:イオン化法:エレクトロスプレー、極性:負イオン キャピラリー (kV) 3.00、コーン (V) 30.00、抽出器 (V) 2.00、ソース温度 (°C) 100 、脱溶媒温度 (°C) 250、コーンガス流量 (L/時) 50、脱溶媒ガス流量 (L/時) 400、 質量範囲:150~1000Da			
LC	Agilent社製HP 1100 HPLC:溶媒脱気装置、クォータナリポンプ (ZCQ) /バイナリ ポンプ (ZDQ)、加熱カラムコンパートメントおよびヨードアレイ検出器 カラム:Phenomenex Gemini C18、3 μ m粒径、110オングストローム、30×3mm、 温度:60°C。DAD波長範囲 (nm) :200~500、溶媒勾配:A=水+0.05% HCOOH B=アセト ニトリル/メタノール (4:1、v:v)+0.04%HCOOH			
	時間 (分)	A%	B%	流量 (mL/分)
	0.00	95.0	5.0	1.7
	2.00	0.00	100.00	1.7
	2.80	0.00	100.00	1.7
	2.90	95.0	5.0	1.7
	3.00	95.0	5.0	1.7

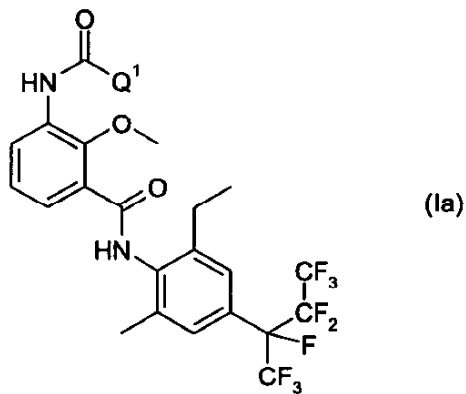
方法 4 :

【表 4】

MS	Waters社製ZQ質量分析計(単一四重極質量分析計) 機器パラメータ:イオン化法:エレクトロスプレー、極性:負イオン キャピラリー (kV) 3. 00、コーン (V) 30. 00、抽出器 (V) 2. 00、ソース温度 (°C) 100 、脱溶媒温度 (°C) 250、コーンガス流量 (L/時) 50、脱溶媒ガス流量 (L/時) 400、 質量範囲: 100~900Da			
LC	Agilent社製HP1100HPLC:溶媒脱気装置、クォータナリポンプ (ZCQ) /バイナリポン プ (ZDQ)、加熱カラムコンパートメントおよびヨードアレイ検出器 カラム:Phenomenex Gemini C18、3μm粒径、110オングストローム、30×3 mm 、温度:60°C、DAD波長範囲 (nm) :200~500、溶媒勾配: A=水+0. 05% HCOOH、B= アセトニトリル/メタノール (4:1, v:v)+0. 04 % HCOOH			
	時間 (分)	A%	B%	流量 (mL/分)
	0. 00	95. 0	5. 0	1. 7
	2. 00	0. 00	100. 00	1. 7
	2. 80	0. 00	100. 00	1. 7
	2. 90	95. 0	5. 0	1. 7
	3. 00	95. 0	5. 0	1. 7

表 A :

【化 2 4】

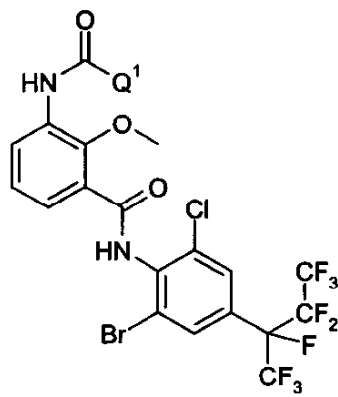


【表 5】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
A1	4-フルオロフェニル	3.87	624.8		2
A2	2-メチル-3-ニトロフェニル	-	-		
A3	2-クロロ-4-フルオロフェニル	-	-		
A4	4-シアノフェニル	3.77	631.9		2
A5	4-シアノ-2-メチルフェニル	-	-	104	
A6	2-クロロピリド-3-イル	3.65	641.8		2
A7	2-フルオロピリド-3-イル	3.79	625.8		2
A8	3-クロロフェニル	4.04	640.8		2
A9	2-クロロフェニル	3.94	640.8		2
A10	2-クロロピリド-4-イル	3.76	641.8		2
A11	5-ブロモピリド-3-イル	3.75	687.7		2
A12	5-ブロモフラン-2-イル	3.98	676.7		2
A13	2-ブロモフェニル	3.94	686.7		2
A14	3-クロロ-5-トリフルオロメチル ピリド-2-イル	4.3	709.8		2
A15	2-フルオロ-3-トリフルオロメチル フェニル	4.24	692.8		2
A16	2,5-ジクロロフェニル	4.13	674.8		2
A17	6-クロロピリド-3-イル	3.67	641.8		2
A18	4-ニトロフェニル	3.86	651.8		2
A19	フェニル	3.84	606.8		2
A20	2,3-ジフルオロフェニル	4.07	642.8		2
A21	5-クロロチオベン-2-イル	4.07	646.8		2
A22	2-メチル-4-ニトロフェニル			175	

表 B :

【化 2 5】



(Ib)

【表 6】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B1	4-シアノ-2-メチルフェニル	-	-		
B2	2-クロロ-4-フルオロフェニル	2.2	730.7		1
B3	2-フルオロフェニル	2.23	696.6		1
B4	2-メチルフェニル	2.17	692.7		1
B5	2-クロロフェニル	2.18	712.7		1
B6	4-シアノフェニル	2.07	703.7		1
B7	4-ニトロフェニル	2.06	722.0		1
B8	4-メチルフェニル	2.21	692.7		1
B9	4-フルオロ-2-メチルフェニル	2.18	710.7		1
B10	5-クロロ-2-フルオロフェニル	2.34	730.6		1
B11	2-クロロ-4-ニトロフェニル	2.19	757.7		1
B12	フラン-2-イル	2.06	668.7		1
B13	4-トリフルオロメトキシフェニル	2.29	762.7		1
B14	4-フルオロ-3-トリフルオロ- メチルフェニル	2.27	764.7		1
B15	4-トリフルオロメチルフェニル	2.05	746.7		1
B16	2-トリフルオロメトキシフェニル	2.26	762.7		1
B17	2-メトキシフェニル	2.28	708.7		1
B18	フェニル	2.12	678.6		1
B19	4-フルオロフェニル	2.13	696.7		1
B20	2-トリフルオロメチルフェニル	2.17	746.7		1
B21	4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5- -イル	2.05	700.6		1
B22	2,3-ジフルオロフェニル	2.25	714.7		1
B23	2,4-ジフルオロフェニル	2.26	714.7		1
B24	2-フルオロ-5-トリフルオロメチル フェニル	2.34	764.7		1
B25	4-イソプロピルフェニル	4.55	719.07		2
B26	4-メチルスルファニルフェニル	4.27	722.99		2
B27	2,5-ジクロロフェニル	4.44	744.97		2
B28	4-メトキシフェニル	4.1	707		2
B29	2,4,5-トリフルオロ-3- クロロフェニル	4.59	764.98		2
B30	4-(ピロール-1-イル)フェニル	4.35	742.06		2
B31	4-(1,2,3-チアジアゾール-4-イル) フェニル	4.18	761.02		2
B32	(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4] ジオキセピン)-7-イル	4.16	749.06		2

10

20

30

40

【表 7】

化合物 番号	Q'	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B33	4 - ビフェニル	4.54	753.08		2
B34	3 - メチルピリジン - 2 - イル	4.55	692		2
B35	2 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル フェニル	4.49	763		2
B36	2 - プロモフェニル	4.18	754.94		2
B37	ピリジン - 3 - イル	3.57	677.98		2
B38	4 - メトキシチオベン - 3 - イル	4.41	712.99		2
B39	1, 2, 3 - チアジアゾール - 4 - イル	4.07	684.96		2
B41	5 - フェニルオキサゾール - 4 - イル	4.76	744.05		2
B42	2, 5 - ジメチル - 2H - ピラゾール - 3 - イル	3.91	695.04		2
B43	4 - メチル - 2 - フェニルピリミジン - 5 - イル	4.41	769.07		2
B44	チオベン - 2 - イル	4.07	682.96		2
B45	2 - メチルスルファニルピリジン - 3 - イル	4.1	723.99		2
B46	5 - メチル - 3 - フェニル イソキサゾール - 4 - イル	4.39	758.06		2
B47	4 - メチル - 2 - フェニルチアゾール - 5 - イル	4.6	774.06		2
B48	5 - ピリジン - 2 - イルチオベン - 2 - イル	4.22	760.02		2
B49	5 - フェニルフラン - 2 - イル	4.54	743.02		2
B50	5 - メチル - 1 - フェニル - 1H - ピラゾール - 4 - イル	4.17	757.06		2
B51	6 - モルホリン - 4 - イル - ピラジン - 2 - イル	4.03	763.92		2
B52	5 - プロモフラン - 2 - イル	4.26	744.84		2
B53	ピリジン - 2 - イル	4.46	677.9		2
B54	ピリジン - 4 - イル	3.57	677.9		2
B55	N - オキソピリジン - 3 - イル	3.23	693.91		2
B56	ピラジン - 2 - イル	4.03	678.91		2
B57	3 - プロモチオベン - 2 - イル	4.84	760.8		2
B58	2, 5 - ジメチルフラン - 3 - イル	4.29	694.91		2
B61	5 - ニトロフラン - 2 - イル	4.03	711.88		2
B62	2 - クロロ - 5 - ニトロフェニル	4.29	755.9		2
B63	2, 5 - ジメチルフラン - 3 - イル	4.36	775.84		2
B64	2 - ニトロ - 4 - クロロフェニル	4.26	755.91		2
B65	3 - メチル - 4 - プロモフェニル	4.54	768.9		2
B66	3 - クロロピリジン - 4 - イル	3.87	711.91		2
B67	5 - クロロチオベン - 2 - イル	4.36	716.85		2
B68	3 - クロロ - 5 - ヨードフェニル	4.55	836.84		2
B69	2 - メチル - 3 - ニトロフェニル	4.11	735.96		2
B70	3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル フェニル	4.42	778.92		2
B71	ピリミジン - 2 - イル	3.76	678.91		2
B72	2 - クロロ - 5 - メチルフェニル	4.39	724.9		2
B73	2 - クロロ - 4, 5 - ジフルオロフェニル	4.33	746.88		2

10

20

30

40

【表 8】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B74	2-ニトロ-5-メチルフェニル	4.13	735.94		2
B75	2,6-ジクロロ-5-フルオロピリジン -3-イル	4.37	763.86		2
B76	4-プロモ-2-エチル-5-メチル-2H -ピラゾール-3-イル	4.59	786.91		2
B77	4-フルオロ-3-ニトロフェニル	4.13	739.92		2
B78	2-ピリジン-3-イルチアゾール-4- イル	4.26	760.91		2
B80	2-ニトロフェニル	4.04	721.9		2
B81	2-トリフルオロメチルピリジン-3- イル	3.97	745.92		2
B82	3-メチルピリジン-4-イル	3.45	691.94		2
B83	5-プロモ-2-クロロフェニル	4.52	788.81		2
B84	3-プロモ-4-メチルフェニル	4.52	768.87		2
B85	2-プロモ-3-ニトロフェニル	4.13	799.85		2
B86	2-メチル-3,5-ジニトロフェニル	4.24	780.97		2
B87	3-メチル-2-ニトロフェニル	4.11	735.9		2
B88	3-メチルチオペン-2-イル	4.31	696.87		2
B89	3-メトキシイソキサゾール-5-イル	4.04	697.88		2
B90	6-クロロ-1-オキシピリジン-2- イル	4.12	727.89		2
B91	2-ヒドロキシ-3,5-トリクロロ フェニル	4.2	760.84		2
B92	1-メチル-5-トリフルオロメチル- 1H-ピラゾール-3-イル	4.46	748.9		2
B93	3-クロロ-2-メチルピリジン-4- イル	3.98	725.88		2
B94	4-メチルオキサゾール-5-イル	3.85	681.88		2
B95	2-メトキシメチル-4-メチル チアゾール-5-イル	4.02	741.93		2
B96	2,4-ジメチルチアゾール-5-イル	3.96	711.91		2
B97	2,6-ジクロロピリジン-4-イル	4.4	745.84		2
B98	3-メチルイソチアゾール-4-イル	3.88	697.88		2
B99	2-メチル-3-カルボン酸メチルエス テル-4-メチルスルファニルフェニル	4.28	794.94		2
B100	1,5-ジメチル-1H-ピラゾール-3- イル	4.15	694.9		2
B101	2-クロロ-6-ニトロフェニル	4.16	755.86		2
B102	4-クロロ-2-フルオロ-5-ニトロ フェニル	4.33	773.92		2
B103	4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ- 1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル	4.4	780.87		2
B104	4-メチル-2-トリフルオロメチル チアゾール-5-イル	4.42	765.87		2
B105	2-クロロ-4-メチルチアゾール-5- イル	4.36	731.83		2

10

20

30

40

【表 9】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B106	2,3-ジクロロ-4-(2-メトキシ- エトキシ)フェニル	4.38	818.88		2
B107	5-シアノ-6-メチルピリジン-2- イル	4.45	716.9		2
B108	2-メタンスルホニル-4- トリフルオロメチルフェニル	4.13	822.89		2
B109	2,4-ジクロロ-3-メトキシフェニル	4.46	774.84		2
B110	3-シアノメチルフェニル	3.95	715.89		2
B111	ピリミジン-5-イル	3.55	678.85		2
B112	5-tert-ブチル-2-メチル-2H- ピラゾール-3-イル	4.41	736.95		2
B113	2-メチル-5-トリフルオロメチル- 2H-ピラゾール-3-イル	4.29	748.9		2
B114	2-クロロ-4-メタンスルホニル-3- メトキシフェニル	4.03	818.87		2
B115	3-クロロ-2-トリフルオロメチル- ピリジン-4-イル	4.3	779.85		2
B116	4-メチルスルファニル-2- ニトロフェニル	4.2	767.85		2
B117	3-シアノ-1-メチル-1H- ピラゾール-4-イル	3.82	705.98		2
B118	2-(2-クロロフェニル)-4-トリフル オロメチル-チアゾール-5-イル	4.85	861.85		2
B119	4-メタンスルホニル-3-メトキシ メチル-2-メチルフェニル	3.91	812.93		2
B120	3-[ジエトキシホスフィニル]オキシ フェニル	4.09	828.93		2
B121	2-イソプロピルスルファニルピリジン -3-イル	4.44	751.93		2
B122	2-(3-エトキシプロピル)-6-トリ フルオロメチル-ピリジン-3-イル	4.48	831.96		2
B123	4'-クロロ-4-メチルビフェニル-3 -イル	4.81	800.91		2
B124	チオペン-3-イル	4.02	682.83		2
B125	2-メチルスルファニル-4-トリ フルオロメチルフェニル	4.48	790.86		2
B126	4-トリフルオロメチルピリジン-5- イル	3.96	745.86		2
B127	2-メチル-6-トリフルオロメチル ピリジン-3-イル	4.19	759.89		2
B128	2,6-ジクロロニコチン-3-イル	4.31	745.8		2
B129	6-メトキシ-3-プロモ-2-メチル フェニル	4.49	798.83		2
B130	2-クロロ-4-フルオロ-5-ニトロ フェニル	4.31	773.84		2
B131	3-ジフルオロメチル-1-メチル- 1H-ピラゾール-4-イル	3.9	730.88		2
B132	2-メトキシピリジン-3-イル	4.47	707.87		2

10

20

30

40

【表 10】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B133	4-クロロ-2-メチル-5-トリフル オロメチル-2H-ピラゾール-3-イル	4.64	782.84		2
B134	2-メチル-4-トリフルオロメチル チアゾール-5-イル	4.19	765.83		2
B135	2-クロロ-4-プロモフェニル	4.55	788.8		2
B136	4-クロロ-1-メチル-5-トリフル オロメチル-1H-ピラゾール-3-イル	4.56	782.84		2
B137	5-メチルチオペン-2-イル	4.2	696.82		2
B138	4-プロモ-2-メチルフェニル	4.44	768.8		2
B139	4-プロモ-3-メトキシ-2-メチル フェニル	4.42	798.83		2
B140	5-tert-ブチル-2- メトキシフェニル	4.92	762.94		2
B141	3-クロロ-5-トリフルオロメチル ピリジン-2-イル	4.57	779.82		2
B142	5-クロロ-1,3-ジメチル-1H- ピラゾール-4-イル	4.14	728.85		2
B143	4,5-ジクロロイソチアゾール-3- イル	4.63	751.75		2
B144	5-メチル-2-トリフルオロメチル フラン-3-イル	4.36	748.83		2
B145	3-クロロチオペン-2-イル	4.61	716.78		2
B146	2-クロロ-6-メトキシピリジン-4- イル	4.32	741.83		2
B147	5-クロロ-4-メトキシチオペン-3- イル	4.62	746.8		2
B148	2-フルオロ-5-ニトロフェニル	4.34	739.85		2
B149	3-クロロ-2-フルオロ-6-トリ フルオロメチルフェニル	4.48	796.81		2
B150	6-ジフルオロメチル-2-メトキシ メチルピリジン-3-イル	4.09	771.9		2
B151	2-フルオロピリジン-4-イル	3.88	695.84		2
B152	1-メチル-3-トリフルオロメチル- 1H-ピラゾール-4-イル	4.02	748.85		2
B153	2,5-ジフルオロフェニル	4.1	712.93		2
B154	2-クロロ-5-フルオロフェニル	4.19	728.91		2
B155	2,4-ジクロロフェニル	4.39	744.89		2
B156	2-メチル-3-クロロフェニル	4.39	724.89		2
B157	3,5-ジメチル-イソキサゾール-4- イル	3.96	695.86		2
B158	2,6-ジクロロフェニル			116	
B159	2-クロロ-4-プロモ-6-メチル フェニル			114	
B160	2-ヒドロキシル-3,5-ジクロロ フェニル			200	
B161	2-ヨード-3-メチル-4-ニトロ フェニル			175	

【表 1 1】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B162	2-ブロモ-3-メチル-4-ニトロ フェニル			172	
B163	2-クロロ-3-メチル-4-ニトロ フェニル			127	
B164	2,6-ジメトキシフェニル			105	
B165	3,5-ジメチル-4-ニトロフェニル			218	
B166	2-メトキシ-6-フルオロフェニル			112	
B167	2-フルオロ-4-トリフルオロ メチルフェニル			183	
B168	3,5-ジフルオロフェニル			83	
B169	2,5-ジフルオロフェニル			154	
B170	3-クロロ-4-ニトロフェニル			95	
B171	3-アセテート-4-ニトロフェニル			100	
B172	2,6-ジフルオロフェニル			177	
B173	3-エトキシ-4-ニトロフェニル			238	
B174	3-アミノ-4-ニトロフェニル			205	
B175	3-(N,N-ジメチルアミノ)-4-ニトロ フェニル			181	
B176	2,6-ジフルオロ-4-シアノフェニル			214	
B177	2-メトキシ-4-ニトロフェニル			190	
B178	2-トリフルオロメチル-4-ニトロ フェニル			140	
B179	3-トリフルオロメチル-4-ニトロ フェニル			142	
B180	2,4-ジニトロフェニル			246	
B181	3-ヒドロキシル-4-ニトロフェニル			185	
B182	2-クロロ-4-メチルフェニル			172	
B183	2-クロロ-3-ニトロフェニル			123	
B184	2,3-ジクロロフェニル			136	
B185	3,5-ジクロロピリジン-2-イル			181	
B186	2,5-ジクロロチオフェン-3-イル			188	
B187	5-ブロモピリミジン-2-イル			204	
B188	3-トリフルオロメチルピリジン-2- イル			175	
B189	2,4,6-トリフルオロフェニル			179	
B190	3-メチル-4-ニトロフェニル			107	
B191	2-フルオロ-4-ニトロフェニル			212	
B192	3-フルオロ-4-ニトロフェニル			104	
B193	3-ニトロフェニル			98	
B194	2-フルオロ-ピリジン-3-イル			167	
B195	3,4-ジニトロフェニル			114	
B196	2-メチル-4-ニトロフェニル			104	
B197	2-フルオロ-4-ニトロフェニル			199	
B198	2-クロロ-4-シアノフェニル			211	
B202	2-クロロ-ピリジン-3-イル	2.05	710		4
B203	2-メトキシ-4-シアノ-6- ヒドロキシフェニル	2.1	599		4

【表 1 2】

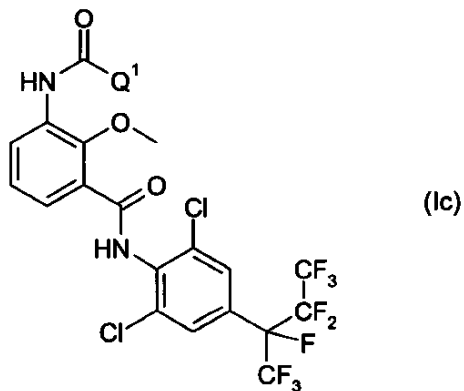
化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
B204	4 - シアノ - ピリジン - 3 - イル	2. 04	701		4
B205	3 - フルオロ - 4 - シアノフェニル	2. 19	826		3
B206	3 - ブロモ - 4 - シアノフェニル	2. 18	778		3
B207	3 - メトキシ - 4 - ニトロフェニル	2. 12	750		4
B208	5 - シアノピリジン - 2 - イル			208 - 210	
B209	4 - ブロモ - 2, 6 - ジクロロフェニル			250	
B210	2, 4 - ジクロロピリミジン - 5 - イル			114 - 115	
B211	2, 4 - ジクロロ - 6 - メチルフェニル			113 - 118	
B212	2 - メチル - 4 - フルオロ - 5 - ニトロ フェニル			83 - 84	
B213	2 - メチル - 4 - シアノ - 5 - 5 - ニトロ フェニル			158 - 161	

10

20

表 C :

【化 2 6】



30

【表 1 3】

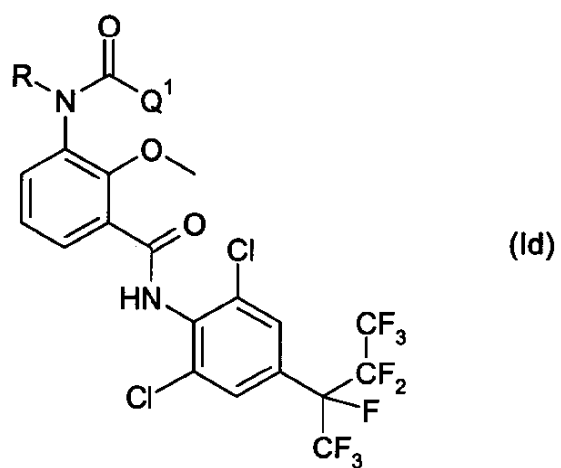
化合物 番号	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
C1	2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル	2.19	686.7	1
C2	4 - シアノ - 2 - メチルフェニル	-	-	
C3	2 - フルオロフェニル	2.24	650.8	1
C4	2 - メチルフェニル	2.16	646.8	1
C5	2 - クロロフェニル	2.17	666.7	1
C6	4 - シアノフェニル	2.05	657.8	1
C7	4 - ニトロフェニル	2.05	677.9	1
C8	4 - メチルフェニル	2.2	646.8	1
C9	4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル	2.18	664.8	1
C10	5 - クロロ - 2 - フルオロフェニル	2.34	686.7	1

【表 1 4】

化合物 番号	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
C11	2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル	2. 16	713. 7	1
C12	フラン - 2 - イル	2. 05	622. 8	1
C13	4 - トリフルオロメトキシフェニル	2. 28	716. 8	1
C14	4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル フェニル	2. 27	718. 8	1
C15	4 - トリフルオロメチルフェニル	2. 05	700. 8	1
C16	2 - トリフルオロメトキシフェニル	2. 26	716. 8	1
C17	2 - メトキシフェニル	2. 27	662. 8	1
C18	フェニル	2. 12	634. 7	1
C19	4 - フルオロフェニル	2. 13	650. 8	1
C20	2 - トリフルオロメチルフェニル	2. 17	700. 7	1
C21	4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イル	2. 04	654. 7	1
C22	2, 3 - ジフルオロフェニル	2. 24	668. 7	1
C23	2, 4 - ジフルオロフェニル	2. 25	668. 7	1
C24	2 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチル フェニル	2. 34	718. 7	1
C25	2 - メチル - 4 - ニトロフェニル	2. 15	690	3
C26	2, 4 - ジクロロフェニル	2. 22	699	3
C27	2, 3 - ジクロロフェニル	2. 2	699	3
C28	3 - ニトロフェニル	2. 13	676	3
C29	2 - クロロピリジン - 3 - イル	2. 07	666	3
C30	3, 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル	2. 09	650	3
C31	2 - フルオロ - 4 - シアノフェニル	2. 14	674	3
C32	2 - メチル - 3 - クロロフェニル	2. 21	679	3
C33	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル	2. 15	685	3
C34	2 - フルオロピリジン - 3 - イル	2. 12	650	3
C35	3 - メチル - 4 - ニトロフェニル	2. 17	690	3
C36	2 - フルオロ - 4 - ニトロフェニル	2. 17	694	3
C37	3 - フルオロ - 4 - ニトロフェニル	2. 14	694	3
C38	3, 4 - ジニトロフェニル	2. 14	721	3
C39	3 - ヒドロキシ - 4 - ニトロフェニル	2. 11	692	3
C40	2 - クロロ - 4 - シアノフェニル	2. 13	690	3
C41	3 - フルオロ - 4 - シアノフェニル	2. 12	674	3
C42	4 - フルオロ - 3 - シアノフェニル	2. 11	674	3
C43	2 - クロロ - 4 - メチルフェニル	2. 21	679	3
C44	2 - クロロ - 3 - ニトロフェニル	2. 14	710	3

表 D :

【化 2 7】



【表 15】

化合物 番号	Q ¹	R ¹	RT (分)	MH ⁺	LC-MS法
D1	フェニル	Me	3.92	646.98	2
D2	フェニル	Et	4.07	660.95	2
D3	4-シアノフェニル	Me	3.8	671.94	2
D4	4-シアノフェニル	Et	3.96	685.97	2
D5	4-フルオロ-2クロロフェニル	Me	4.1	698.9	2
D6	4-フルオロ-2クロロフェニル	Et	4.23	712.87	2
D7	2-フルオロフェニル	Me	3.94	664.88	2
D8	2-メチルフェニル	Me	4.02	660.96	2
D9	2-クロロフェニル	Me	4.05	682.92	2
D10	4-メチルフェニル	Me	4.06	660.97	2
D11	4-フルオロ-2-メチルフェニル	Me	4.04	678.96	2
D12	5-クロロ-2-フルオロフェニル	Me	4.13	698.93	2
D13	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Me	4.08	725.94	2
D14	フラン-2-イル	Me	3.75	636.92	2
D15	4-トリフルオロメトキシ フェニル	Me	4.26	730.94	2
D16	4-フルオロ-3-トリフルオロ メチルフェニル	Me	4.23	732.95	2
D17	4-トリフルオロメチルフェニル	Me	4.19	714.95	2
D18	2-トリフルオロメトキシ フェニル	Me	4.21	730.94	2
D19	2-メトキシフェニル	Me	3.9	676.97	2
D20	4-フルオロフェニル	Me	3.95	664.96	2
D21	2-トリフルオロメチルフェニル	Me	4.15	714.95	2
D22	4-メチル-1,2,3-チアジア ゾール-5-イル	Me	3.79	668.94	2
D23	2,3-ジフルオロフェニル	Me	3.97	682.94	2
D24	2,4-ジフルオロフェニル	Me	4.01	682.96	2
D25	2-フルオロ-5-トリフルオロ メチルフェニル	Me	4.22	732.95	2
D26	2-フルオロフェニル	Et	4.1	678.97	2
D27	2-メチルフェニル	Et	4.17	674.99	2
D28	2-クロロフェニル	Et	4.18	694.94	2

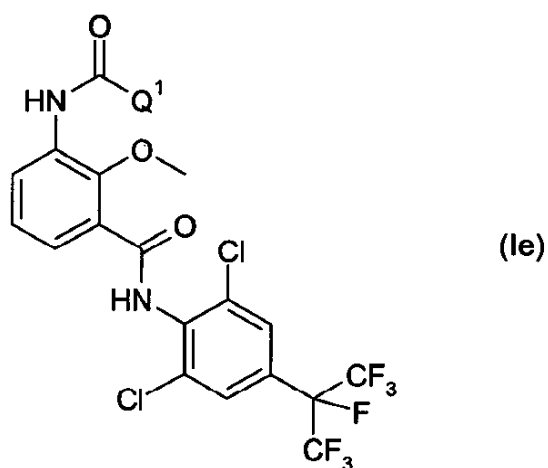
10

20

30

【表 16】

化合物 番号	Q ¹	R ¹	RT (分)	MH ⁺	LC-MS法
D29	4-メチルフェニル	Et	4.2	674.99	2
D30	4-フルオロ-2-メチルフェニル	Et	4.19	692.99	2
D31	5-クロロ-2-フルオロフェニル	Et	4.29	712.94	2
D32	2-クロロ-4-ニトロフェニル	Et	4.22	739.84	2
D33	フラン-2-イル	Et	3.93	650.95	2
D34	4-トリフルオロメトキシ フェニル	Et	4.4	744.96	2
D35	4-フルオロ-3-トリフルオロ メチルフェニル	Et	4.34	746.92	2
D36	4-トリフルオロメチルフェニル	Et	4.34	728.93	2
D37	2-トリフルオロメトキシ フェニル	Et	4.34	744.91	2
D38	2-メトキシフェニル	Et	4.05	690.93	2
D39	4-フルオロフェニル	Et	4.11	678.95	2
D40	2-トリフルオロメチルフェニル	Et	4.26	728.92	2
D41	2,3-ジフルオロフェニル	Et	4.14	696.89	2
D42	2,4-ジフルオロフェニル	Et	4.14	696.89	2
D43	2-フルオロ-5-トリフルオロ メチルフェニル	Et	4.34	746.92	2
D44	2-クロロ-4-シアノフェニル	Me	2.11	704	4
D45	2-クロロ-4-シアノフェニル	Et	2.13	718	4
D46	4-ニトロフェニル	Me	2.1	690	4
D47	4-ニトロフェニル	Et	2.15	704	4
D48	2,6-ジフルオロフェニル	Me	2.12	681	4
D49	2,6-ジフルオロフェニル	Et	2.17	696	4

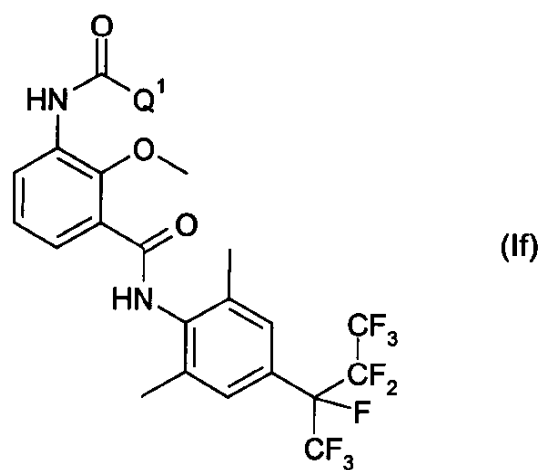
表 E :
【化 28】

【表 17】

化合物 番号	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
E1	2-フルオロフェニル	4.27	600.78		2
E2	2-メチルフェニル	4.13	596.83		2
E3	2-クロロフェニル	4.11	616.78		2
E4	4-シアノフェニル	3.87	607.81		2
E5	4-ニトロフェニル	4.06	627.82		2
E6	4-メチルフェニル	4.17	596.86		2
E7	4-フルオロ-2-メチルフェニル	4.12	614.83		2
E8	5-クロロ-2-フルオロフェニル	4.46	634.78		2
E9	2-クロロ-4-ニトロフェニル	4.19	661.78		2
E10	フラン-2-イル	3.87	572.85		2
E11	4-トリフルオロメトキシフェニル	4.35	666.82		2
E12	4-フルオロ-3-トリフルオロ メチルフェニル	4.31	668.82		2
E13	4-トリフルオロメチルフェニル	4.3	650.85		2
E14	2-トリフルオロメトキシフェニル	4.3	666.87		2
E15	2-メトキシフェニル	4.29	612.87		2
E16	フェニル	4	582.87		2
E17	4-フルオロフェニル	4.04	600.85		2
E18	2-トリフルオロメチルフェニル	4.13	650.88		2
E19	2-クロロ-4-フルオロフェニル	4.16	634.82		2
E20	4-メチル-1,2,3-チアジア ゾール-5-イル	3.81	604.82		2
E21	2,3-ジフルオロフェニル	4.24	618.85		2
E22	2,4-ジフルオロフェニル	4.31	618.85		2
E23	2-フルオロ-5-トリフルオロ メチルフェニル	4.48	668.86		2
E24	2,5-ジフルオロ-4-シアノ フェニル			192	
E25	2-メチル-4-シアノフェニル	2.08	620		4
E26	3-メチル-4-ニトロフェニル	2.13	640		4
E27	2-メチル-4-ニトロフェニル	2.11	640		4
E28	2,4,6-トリフルオロフェニル	2.11	635		4
E29	2,6-ジフルオロフェニル	2.09	617		4

表 F :

【化 2 9】

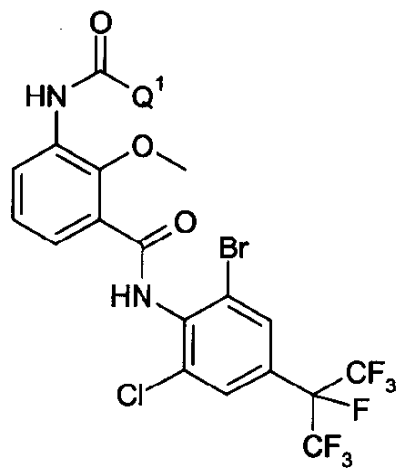


【表 18】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
F1	2 - フルオロフェニル	4.2	610.92		2
F2	2 - メチルフェニル	4.05	606.96		2
F3	2 - クロロフェニル	4.07	626.9		2
F4	フラン - 2 - イル	3.85	582.98		2
F5	4 - トリフルオロメトキシフェニル	4.3	676.94		2
F6	3 - トリフルオロメチル - 4 - フルオロ フェニル	4.28	678.96		2
F7	4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イル	3.8	614.95		2
F8	2, 3 - ジフルオロフェニル	4.2	628.96		2
F9	2, 4 - ジフルオロフェニル	4.23	628.97		2
F10	2, 4, 6 - トリメチルフェニル	4.29	635.03		2
F11	2, 3 - ジメチルフェニル	4.17	621.05		2
F12	2 - フルオロ - 5 - クロロフェニル	4.42	644.97		2
F13	2 - フルオロ - 4 - クロロフェニル	4.42	644.97		2
F14	2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチル フェニル	4.43	679		2
F15	2, 4 - ジクロロフェニル	4.29	660.95		2
F16	2 - クロロ - 4 - メタンスルホニル フェニル	3.78	704.95		2
F17	3, 4 - ジクロロフェニル	4.38	660.91		2
F18	4 - メタンスルホニルフェニル	3.64	670.96		2
F19	4 - クロロフェニル	4.19	626.97		2
F20	3 - フルオロフェニル	4.05	611		2
F21	3 - シアノフェニル	3.9	618		2
F22	3 - メトキシフェニル	4.03	623		2
F23	3 - メチル - 4 - ニトロフェニル			179	
F24	2 - メチル - 4 - ニトロフェニル			203	
F25	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル			194	
F26	4 - トリフルオロメチルフェニル			163	
F27	2 - メチル - 4 - フルオロフェニル			178	
F28	2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル			207	
F29	4 - ニトロフェニル			105	
F30	2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル			164	

表 G :

【化 3 0】



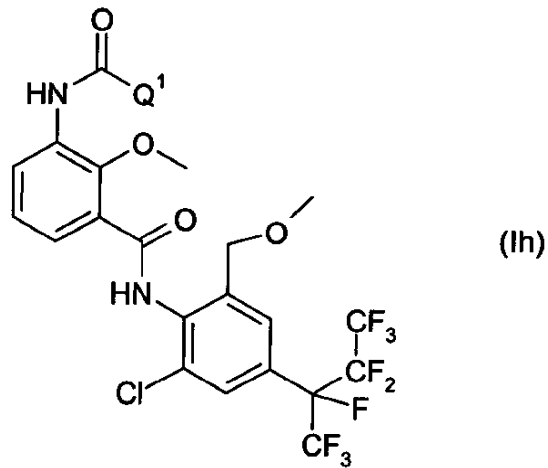
(Ig)

【表 19】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
G1	2 - メチル - 4 - シアノフェニル			190	
G2	2 - クロロ - 4 - シアノフェニル			211	
G3	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル			181	
G4	2, 6 - ジフルオロ - 4 - シアノ フェニル			118	
G5	2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル	4. 23	679. 1	183	2
G6	2 - フルオロフェニル	4. 3	645. 15		2
G7	2 - メチルフェニル	4. 15	641. 19		2
G8	2 - クロロフェニル	4. 17	661. 13		2
G9	4 - シアノフェニル	3. 93	652. 17		2
G10	4 - ニトロフェニル	4. 08	672. 14		2
G11	4 - メチルフェニル	4. 23	641. 19		2
G12	4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル	4. 19	659. 17		2
G13	5 - クロロ - 2 - フルオロフェニル	4. 52	679. 12		2
G14	2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル	4. 2	706. 1		2
G15	フラン - 2 - イル	3. 94	617. 14		2
G16	4 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 41	711. 11		2
G17	4 - フルオロ - 3 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 4	713. 12		2
G18	4 - トリフルオロメチルフェニル	4. 36	695. 12		2
G19	2 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 37	711. 11		2
G20	2 - メトキシフェニル	4. 43	657. 17		2
G21	フェニル	4. 07	627. 15		2
G22	4 - フルオロフェニル	4. 09	645. 15		2
G23	2 - トリフルオロメチルフェニル	4. 18	695. 12		2
G24	4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジア ゾール - 5 - イル	3. 88	649. 12		2
G25	2, 3 - ジフルオロフェニル	4. 3	663. 15		2
G26	2, 4 - ジフルオロフェニル	4. 34	663. 15		2
G27	2 - フルオロ - 5 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 54	713. 12		2

表 H :

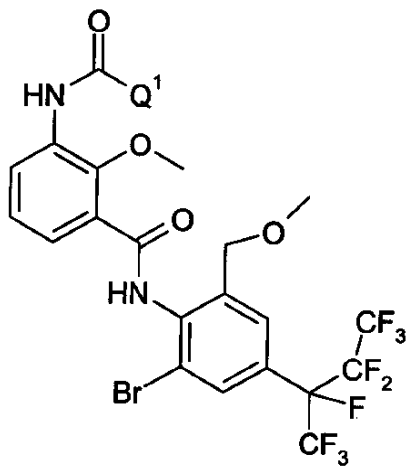
【化 3 1】



【表 2 0】

化合物 番号	Q¹	RT (分)	MH⁺	MP (°C)	LC-MS法
H1	2-メチル-4-シアノフェニル			110	
H2	2,4,6-トリフルオロフェニル			138	
H3	2-フルオロフェニル	4.44	661.33		2
H4	2-メチルフェニル	4.32	657.37		2
H5	2-クロロフェニル	4.33	677.32		2
H6	4-シアノフェニル	4.12	668.35		2
H7	4-ニトロフェニル	4.22	688.35		2
H8	4-メチルフェニル	4.38	657.24		2
H9	4-フルオロ-2-メチルフェニル	4.35	675.36		2
H10	5-クロロ-2-フルオロフェニル	4.68	695.29		2
H11	2-クロロ-4-ニトロフェニル	4.34	722.28		2
H12	フラン-2-イル	4.13	633.33		2
H13	4-トリフルオロメトキシフェニル	4.55	727.29		2
H14	4-フルオロ-3-トリフルオロ メチルフェニル	4.51	729.3		2
H15	4-トリフルオロメチルフェニル	4.5	711.3		2
H16	2-トリフルオロメトキシフェニル	4.53	727.32		2
H17	2-メトキシフェニル	4.52	673.35		2
H18	フェニル	4.2	643.27		2
H19	4-フルオロフェニル	4.24	661.27		2
H20	2-トリフルオロメチルフェニル	4.34	711.3		2
H21	4-メチル-1,2,3-チアジアゾール -5-イル	4.04	665.3		2
H22	2,3-ジフルオロフェニル	4.48	679.32		2
H23	2,4-ジフルオロフェニル	4.48	679.29		2
H24	2-フルオロ-5-トリフルオロ メチルフェニル	4.66	729.3		2
H25	2-クロロ-4-フルオロフェニル	4.39	695.26	98	2

表 I :
【化 3 2】



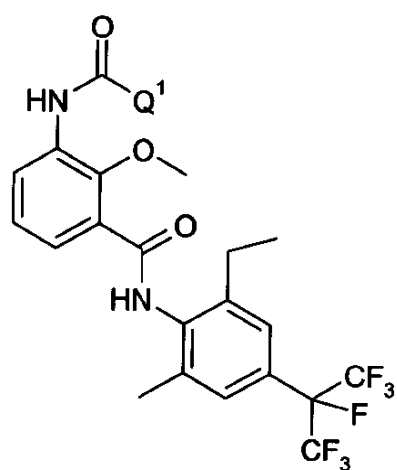
(ii)

【表 2 1】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
11	2 - メチル - 4 - シアノフェニル			130	-
12	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル			190	-
13	2 - フルオロフェニル	4. 47	705. 3		2
14	2 - メチルフェニル	4. 3	701. 3		2
15	2 - クロロフェニル	4. 33	721. 2		2
16	4 - シアノフェニル	4. 18	712. 3		2
17	4 - ニトロフェニル	4. 22	732. 3		2
18	4 - メチルフェニル	4. 39	701. 29		2
19	4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル	4. 39	719. 29		2
110	5 - クロロ - 2 - フルオロフェニル	4. 66	739. 24		2
111	2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル	4. 5	766. 26		2
112	フラン - 2 - イル	4. 12	677. 26		2
113	4 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 55	771. 28		2
114	4 - フルオロ - 3 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 51	773. 29		2
115	4 - トリフルオロメチルフェニル	4. 5	755. 29		2
116	2 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 54	771. 28		2
117	2 - メトキシフェニル	4. 52	717. 34		2
118	フェニル	4. 23	687. 32		2
119	4 - フルオロフェニル	4. 24	705. 32		2
120	2 - トリフルオロメチルフェニル	4. 34	755. 29		2
121	4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジア ゾール - 5 - イル	4. 05	709. 29		2
122	2, 3 - ジフルオロフェニル	4. 45	723. 27		2
123	2, 4 - ジフルオロフェニル	4. 5	723. 31		2
124	2 - フルオロ - 5 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 68	773. 29		2
125	2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル	4. 4	739. 26	113	2

表 J :

【化 3 3】



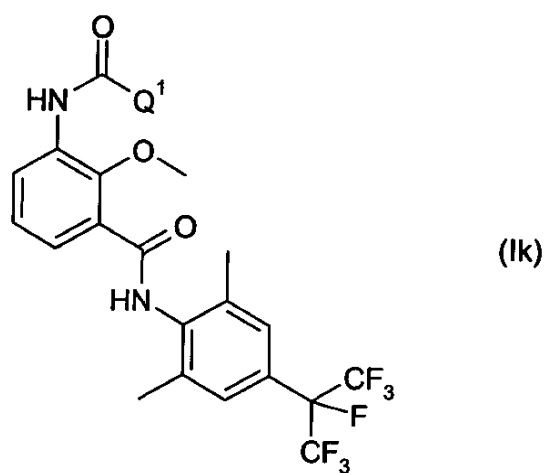
(lj)

【表 2 2】

化合物 番号.	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS法
J1	2 - クロロ - 4 - シアノフェニル			110	
J2	2, 6 - ジフルオロ - 4 - シアノ フェニル			113	
J3	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル			96	
J4	2 - メチル - 4 - シアノフェニル			102	
J5	2 - フルオロフェニル	4. 34	575. 36		2
J6	2 - メチルフェニル	4. 16	571. 33		2
J7	2 - クロロフェニル	4. 15	591. 35		2
J8	4 - シアノフェニル	3. 99	582. 38		2
J9	4 - ニトロフェニル	4. 07	602. 36		2
J10	4 - メチルフェニル	4. 22	571. 4		2
J11	4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル	4. 19	589. 4		2
J12	5 - クロロ - 2 - フルオロフェニル	4. 52	609. 32		2
J13	2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル	4. 23	636. 31		2
J14	フラン - 2 - イル	3. 95	547. 36		2
J15	4 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 41	641. 32		2
J16	4 - フルオロ - 3 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 4	643. 33		2
J17	4 - トリフルオロメチルフェニル	4. 37	625. 33		2
J18	2 - トリフルオロメトキシフェニル	4. 38	641. 32		2
J19	2 - メトキシフェニル	4. 37	587. 38		2
J20	フェニル	4. 08	557. 36		2
J21	4 - フルオロフェニル	4. 08	575. 36		2
J22	2 - トリフルオロメチルフェニル	4. 19	625. 33		2
J23	4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イル	3. 87	579. 33		2
J24	2, 3 - ジフルオロフェニル	4. 33	593. 36		2
J25	2, 4 - ジフルオロフェニル	4. 34	593. 36		2
J26	2 - フルオロ - 5 - トリフルオロ メチルフェニル	4. 54	643. 33		2
J27	2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル	4. 23	609. 29	88	2

表 K :

【化 3 4】



10

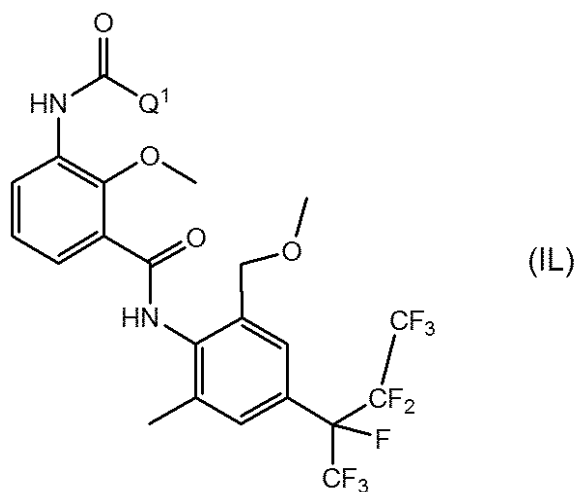
【表 2 3】

化合物 番号	Q¹	MP (°C)
K1	2, 4, 6 - トリフルオロフェニル	173
K2	4 - ニトロフェニル	190
K3	2 - クロロ - 4 - シアノフェニル	133
K4	2 - メチル - 4 - シアノフェニル	152

20

表 L :

【化 3 5】



30

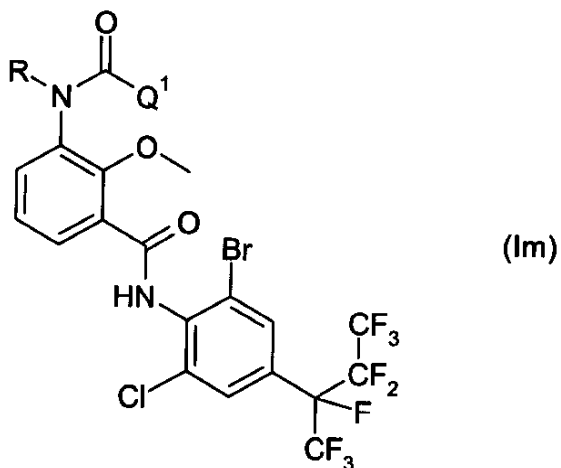
40

【表 2 4】

化合物 番号	Q ¹	RT (分)	MH ⁺	LC-MS法
L1	2-フルオロフェニル	4.34	639.5	2
L2	2-メチルフェニル	4.2	635.53	2
L3	2-クロロフェニル	4.21	655.45	2
L4	4-シアノフェニル	4.01	646.52	2
L5	4-ニトロフェニル	4.11	666.48	2
L6	4-メチルフェニル	4.26	635.52	2
L7	4-フルオロ-2-メチルフェニル	4.23	653.23	2
L8	5-クロロ-2-フルオロフェニル	4.53	673.43	2
L9	2-クロロ-4-ニトロフェニル	4.22	700.45	2
L10	フラン-2-イル	3.98	611.52	2
L11	4-トリフルオロメトキシフェニル	4.43	705.51	2
L12	4-フルオロ-3-トリフルオロ メチルフェニル	4.4	707.51	2
L13	4-トリフルオロメチルフェニル	4.38	689.52	2
L14	2-トリフルオロメトキシフェニル	4.4	705.29	2
L15	2-メトキシフェニル	4.41	651.52	2
L16	フェニル	4.1	621.4	2
L17	4-フルオロフェニル	4.13	639.5	2
L18	2-トリフルオロメチルフェニル	4.22	689.51	2
L19	2-クロロ-4-フルオロフェニル	4.25	673.48	2
L20	4-メチル-1,2,3-チアジアゾール -5-イル	3.93	643.46	2
L21	2,3-ジフルオロフェニル	4.33	657.02	2
L22	2,4-ジフルオロフェニル	4.36	657.51	2
L23	2-フルオロ-5-トリフルオロ メチルフェニル	4.55	707.51	2

表M：

【化 3 6】



【表 2 5】

化合物 番号	Q ¹	R	RT (分)	MH ⁺	LC-MS法
M1	2-メチル-4-シアノフェニル	Et	2.14	742	4
M2	3-メチル-4-ニトロフェニル	Et	2.17	762	4

生物学的実施例

【0113】

これらの実施例は、式 (I) の化合物の殺虫特性および殺ダニ特性を示す。検査は以下の通りに行った。

スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*) (エジプト産ハスモンヨトウ近縁種幼虫)

【0114】

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にワタのリーフディスクを配置し、220ppmの散布量で試験液を噴霧した。乾燥後、リーフディスクに5匹のL1幼虫を寄生させた。処理後(DAT)3日目に、死亡率、摂食行動、および成長抑制について試料を調べた。

【0115】

以下の化合物が、スポドプテラ・リトラリスを少なくとも80%駆除した：A1~A22、B202~B207、B188、B187、B186、B185、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B147、B146、B144、B142、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B105、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B92、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B71、B70、B69、B68、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B56、B55、B54、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B37、B36、B32、B31、B30、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B170、B169、B168、B167、B154、B172、B153、B180、B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B157、B198、B197、B196、B24、B23、B22、B21、B20、B19、B18、B17、B16、B15、B14、B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B3、B2、B1、C1~C15、C18~C23、C25~C36、D1~D13、D15、D17、D20、D23、D22、D26~D30、D32~D36、D39~D42、D44~D49、E1~E22、E24、E25~E29、F1~F9、F12、F13、F15~F30、G1~G5、K1~K4、M1、M2。

ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*) (ニセアメリカタバコガ幼虫)

【0116】

人工飼料上の24ウェルマイクロタイタープレート上に卵(0~24時齢)を配置し、ピペッティングにより200ppmの散布量の試験液(ウェルの濃度は18ppm)で処理した。4日間のインキュベーション期間後、卵死亡率、幼虫死亡率、および成長抑制に

ついて試料を調べた。

【0117】

以下の化合物が、ヘリオチス・ビレセンスを少なくとも80%駆除した：A1、A4、A6～A21、B202～B207、B188、B185、B163、B162、B161、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B146、B144、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B125、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B70、B69、B68、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B56、B55、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B36、B32、B31、B30、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B171、B170、B169、B168、B167、B172、B153、B180、B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B157、B198、B197、B23、B22、B21、B20、B19、B18、B17、B15、B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B3、B2、B1、C1～C23、C25～C29、C31～C35、D1～D7、D10～D13、D15、D16、D20、D22～D24、D26、D28～D30、D32、D35、D36、D39～D42、D44～D49、E1～E24、E25～E29、F1～F9、F12、F13、F15～F30、G1～G5、H1、H2、H25、I1、I2、I25、J2～J4、J27、K1～K4、M1、M2。

【0118】

プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (コナガ) 人工飼料を含む24ウェルマイクロタイタープレート (MTP) を、ピペッティングにより200ppmの散布量の試験液 (ウェルの濃度は18ppm) で処理した。乾燥後、MTPにL2幼虫を寄生させた (1ウェル当たり7～12匹)。6日間のインキュベーション期間後、幼虫死亡率および成長抑制について試料を調べた。

【0119】

以下の化合物が、プルテラ・キシロステラを少なくとも80%駆除した。：A1、A2、A4～A22、B202～B207、B187、B185、B164、B163、B162、B161、B160、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B146、B144、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B125、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B105、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B71、B69、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B57、B56、B55、B54、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B37、B36、B32、B31、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B171、B170、B169、B168、B154、B172、B153、B180、B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B198、B197、B196、B23、B22、B21、B20、B19、B18、B16、B15、B14、B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B3、B2、B1、C1～C9、C11～C13、C15、C18～C23、C25～C29、C31～C35、D1～D13、D15、D16、D20、D22～D24、D2

6～D30、D32、D36、D39～D42、D44～D49、E4～E22、E24、E25～E29、F1～F9、F11、F15～F27、F29、F30、G1～G5、H1、H2、H25、I1、I2、I25、J1～J4、J27、K1～K4、M1、M2。

ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) (ウリハムシ幼虫)

【0120】

人工飼料を含む24ウェルマイクロタイタープレート(MTP)を、ピペッティングにより200ppmの散布量の試験液(ウェルの濃度は18ppm)で処理した。乾燥後、MTPにL2幼虫を寄生させた(1ウェル当たり6～10匹)。5日間のインキュベーション期間後、幼虫死亡率および成長抑制について試料を調べた。

10

【0121】

以下の化合物が、ジアブロチカ・バルテアタを少なくとも80%駆除した：A1、A3～A13、A15～A20、A22、B202～B206、B187、B185、B163、B162、B161、B159、B158、B151、B150、B166、B146、B144、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B125、B120、B117、B116、B115、B113、B112、B111、B110、B109、B101、B100、B98、B97、B96、B93、B92、B89、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B74、B73、B72、B69、B67、B66、B64、B62、B61、B58、B56、B55、B54、B52、B45、B44、B42、B37、B36、B32、B30、B28、B27、B26、B25、B174、B170、B169、B168、B167、B154、B153、B180、B179、B178、B181、B184、B183、B156、B194、B155、B192、B22、B21、B20、B18、B9、B5、B4、B3、C1～C13、D15、C19～C23、C25～C29、C31～C36、D1～D13、D15～D17、D20～D23、D26～D30、D32、D36、D39、D42、D41、D44～D49、E1～E7、E8、E9、E11、E13、E16～E22、E24、E25～E29、F1、F3、F7～F9、F12、F15～F23、F24～F30、G1～G5、H2、H25、I1、I2、I25、J1～J4、J27、K1～K4、M2。

20

30

スリップス・タバキ (*Thrips tabaci*) (ネギアザミウマ)

【0122】

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にヒマワリのリーフディスクを配置し、220ppmの散布量で試験液を噴霧した。乾燥後、リーフディスクに混合齢のアブラムシ集団を寄生させた。7日間のインキュベーション期間後、死亡率について試料を調べた。

【0123】

以下の化合物が、スリップス・タバキを少なくとも80%駆除した：A2～A13、A17～A20、A22、B202、B204、B163、B162、B161、B151、B150、B146、B137、B135、B134、B127、B124、B115、B113、B112、B111、B110、B109、B101、B97、B93、B92、B89、B87、B82、B81、B80、B74、B73、B67、B66、B65、B64、B58、B55、B54、B52、B49、B46、B45、B44、B42、B37、B36、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B169、B168、B167、B154、B172、B153、B180、B178、B184、B183、B156、B155、B192、B191、B190、B21、B20、B9、B4、B1、C1～C9、C11、C13、C15、C18、C19、C20～C23、C25、C26、C29、C31、C33、D1～D5、D9、D12

40

50

、D15、D17、D20、D22、D23、D26～D30、D32～D36、D44～D49、E1～E7、E9、E11、E12、E13、E16～E22、E25、E27～E29、F3、F7、F8、F20、F21、F29、F30、H25、I2、I25、J27、K1、K2、M1。

テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ)
【0124】

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のマメのリーフディスクに、200 ppmの散布量で試験液を噴霧した。乾燥後、リーフディスクに混合齢のダニ集団を寄生させた。8日後、卵死亡率、幼虫死亡率、および成虫死亡率についてディスクを調べた。

10

【0125】

以下の化合物が、テトラニクス・ウルチカエを少なくとも80%駆除した：A2～A7、A10、A11、A16～A18、A22、B202、B204、B159、B158、B151、B150、B139、B138、B135、B134、B128、B127、B113、B111、B110、B109、B106、B104、B101、B98、B97、B96、B93、B82、B81、B80、B74、B73、B69、B67、B66、B65、B64、B61、B55、B54、B42、B36、B28、B26、B174、B176、B171、B170、B169、B168、B154、B172、B153、B180、B179、B178、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B198、B197、B196、B23、B21、B19、B15、B13、B11、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B2、B1、C2、C4～C9、C11、C12、C13、C15、C19～C23、C25、C26、C29、C33、D2～D6、D8、D11、D13、D20、D22、D32、D39、D44～D49、E4、E5、E7、E9、E12、E13、E17、E19、E20、E24、E25、E27～E29、F21、F18、F15、F7、F5、F1、F28、F27、F25、F24、F29、F30、G1～G5、J2、J27、K1～K4、M1。

20

ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)

【0126】

30

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にヒマワリのリーフディスクを配置し、200 ppmの散布量で試験液を噴霧した。乾燥後、リーフディスクに混合齢のアブラムシ集団を寄生させた。6DATのインキュベーション期間後、死亡率について試料を調べた。

【0127】

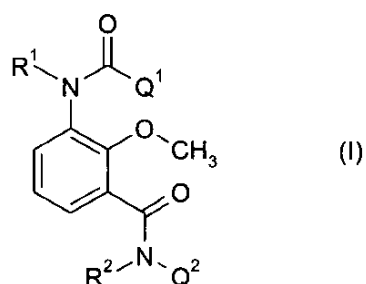
以下の化合物が、ミズス・ペルシカエを少なくとも80%駆除した：A3、A4、A10、A11、A13、A17、A18、A22、B204、B151、B150、B137、B124、B111、B106、B98、B93、B89、B82、B80、B66、B55、B54、B45、B44、B42、B37、B36、B28、B26、B174、B168、B153、B156、B155、B189、B19、B18、B15、B8、B7、B6、B5、B4、B2、C1、C4～C6、C8、C18、C19、D1～D4、D20、D21、D39、D45、D48、D49、E1、E2、E4～E6、E9、E11、E12、E13、E16、E17、E21、E25、E27～E29、F7、F30、G3、G4、G5、H1、H25、I2、I25、J27、K2、K27。

40

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式(I)

【化 1】



10

の化合物であって、式中、

Q^1 は、同じかまたは異なっているもよい1～5個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、アリールまたはヘテロシクリルであり、

Q^2 は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、

2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、

2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、

2, 6 - ジメチル - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、

2 - クロロ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニル、および

2 - ブロモ - 6 - メトキシメチル - 4 - (ノナフルオロブト - 2 - イル) フェニルから選択され、

R^1 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルコキシカルボニル、および $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)NH_2$ から選択され、

R^3 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、ヒドロキシル、アセトキシ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $CN - C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル - $C(O)O$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル - $S(O)_2$ 、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル NH 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2N$ 、 $(C_1 - C_4$ アルキル) $_2P(O)O$ 、フェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式複素環から選択される、化合物、またはその農薬として許容される塩もしくはN - オキシド。

30

〔2〕 Q^1 は、同じかまたは異なっているもよい1～5個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、ならびに窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5～6員の単環式ヘテロアリール基から選択される、前記〔1〕に記載の化合物。

40

〔3〕 Q^1 は、同じかまたは異なっているもよい1～3個の R^3 置換基によってそれぞれが任意選択的に置換された、フェニル、ビフェニル、フラニル、ピリジル、チエニル、チアジアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、およびピリミジニルから選択される、前記〔2〕に記載の化合物。

〔4〕 R^3 は、シアノ、ニトロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシル、アセトキシ、メチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、イソプロピルチオ、3 - エトキシ - n - プロピル、メトキシメチル、2 - メトキシエトキシ、 CH_2CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、フェニル、N - ピロリル、チアジアゾリル、およびピリジ

50

ルから選択される、前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載の化合物。

〔5〕 R^3 は、シアノ、ニトロ、ブromo、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、前記〔4〕に記載の化合物。

〔6〕 R^1 および R^2 は、両方とも水素である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか1項に記載の化合物。

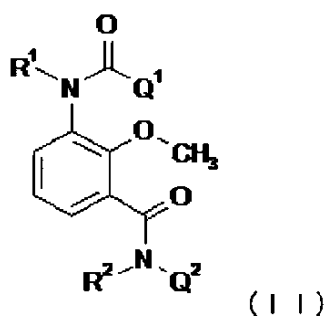
〔7〕 Q^2 は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、
2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニル、および
2, 6 - ジクロロ - 4 - (ノナフルオロ - ブト - 2 - イル) フェニルから選択される、前記〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載の化合物。

10

〔8〕式 (I I)

【化 2】



20

の化合物であって、式中、

Q^1 は、前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載される通りであり、

R^1 および R^2 は、前記〔1〕または前記〔6〕のいずれかに記載される通りであり、

R^3 は、前記〔1〕、〔4〕、または〔5〕のいずれか1項に記載される通りであり、

Q^2 は、

2 - エチル - 6 - メチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
2 - ブロモ - 6 - クロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
2, 6 - ジクロロ - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、
2, 6 - ジメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニル、および
2 - メチル - 6 - メトキシメチル - 4 - (ペルフルオロイソプロピル) フェニルから選択される、化合物、

30

またはその農薬として許容される塩もしくはN - オキシド。

〔9〕害虫、害虫の居場所、または害虫による攻撃を受けやすい植物に、前記〔1〕～〔8〕のいずれか1項に記載される、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、または殺軟体動物的に有効な量の式 (I) の化合物を施用することを含む、昆虫、ダニ、線虫、または軟体動物を駆除する方法。

40

〔10〕農薬として許容される希釈剤または担体とともに、前記〔1〕～〔8〕のいずれか1項に記載される、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、または殺軟体動物的に有効な量の式 (I) の化合物を含む、殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、または殺軟体動物性の組成物。

〔11〕1つ以上の追加の殺虫性、殺ダニ性、殺線虫性、または殺軟体動物性の化合物をさらに含む、前記〔10〕に記載の組成物。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

C 0 7 D 263/34 (2006.01)
 C 0 7 D 261/18 (2006.01)
 C 0 7 D 231/14 (2006.01)
 C 0 7 D 239/28 (2006.01)
 C 0 7 D 241/24 (2006.01)
 C 0 7 D 277/56 (2006.01)
 C 0 7 D 307/68 (2006.01)
 C 0 7 D 213/81 (2006.01)
 C 0 7 D 401/04 (2006.01)
 C 0 7 D 333/38 (2006.01)
 C 0 7 C 255/57 (2006.01)
 C 0 7 C 323/62 (2006.01)
 C 0 7 C 317/44 (2006.01)
 C 0 7 C 255/41 (2006.01)
 C 0 7 C 317/46 (2006.01)
 A 0 1 P 5/00 (2006.01)
 A 0 1 P 7/02 (2006.01)
 A 0 1 P 7/04 (2006.01)
 A 0 1 P 9/00 (2006.01)
 A 0 1 N 37/46 (2006.01)
 A 0 1 N 37/24 (2006.01)
 A 0 1 N 37/34 (2006.01)
 A 0 1 N 43/40 (2006.01)
 A 0 1 N 43/08 (2006.01)
 A 0 1 N 43/36 (2006.01)
 A 0 1 N 43/24 (2006.01)
 A 0 1 N 43/828 (2006.01)
 A 0 1 N 43/76 (2006.01)
 A 0 1 N 43/56 (2006.01)
 A 0 1 N 43/54 (2006.01)
 A 0 1 N 43/80 (2006.01)
 A 0 1 N 43/60 (2006.01)
 A 0 1 N 43/78 (2006.01)
 A 0 1 N 41/10 (2006.01)
 A 0 1 N 57/14 (2006.01)
 C 0 7 F 9/12 (2006.01)
 A 0 1 N 43/10 (2006.01)
 A 0 1 N 47/02 (2006.01)

F I

C 0 7 D 263/34
 C 0 7 D 261/18
 C 0 7 D 231/14
 C 0 7 D 239/28
 C 0 7 D 241/24
 C 0 7 D 277/56
 C 0 7 D 307/68
 C 0 7 D 213/81
 C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 333/38
 C 0 7 C 255/57
 C 0 7 C 323/62
 C 0 7 C 317/44
 C 0 7 C 255/41
 C 0 7 C 317/46
 A 0 1 P 5/00
 A 0 1 P 7/02
 A 0 1 P 7/04
 A 0 1 P 9/00
 A 0 1 N 37/46
 A 0 1 N 37/24 1 0 1
 A 0 1 N 37/34 1 0 3
 A 0 1 N 43/40 1 0 1 D
 A 0 1 N 43/08 F
 A 0 1 N 37/34 1 0 5
 A 0 1 N 43/36 A
 A 0 1 N 43/24
 A 0 1 N 43/82 1 0 2
 A 0 1 N 43/76
 A 0 1 N 43/56 C
 A 0 1 N 43/54 B
 A 0 1 N 43/40 1 0 1 E
 A 0 1 N 43/80 1 0 1
 A 0 1 N 43/56 D
 A 0 1 N 43/40 1 0 1 L
 A 0 1 N 43/60
 A 0 1 N 43/78 B
 A 0 1 N 43/80 1 0 2
 A 0 1 N 43/78 A
 A 0 1 N 37/34 1 1 0
 A 0 1 N 43/54 A
 A 0 1 N 41/10 B
 A 0 1 N 57/14 B
 C 0 7 F 9/12
 A 0 1 N 43/40 1 0 1 M
 A 0 1 N 43/10 F
 A 0 1 N 47/02

- (74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫
- (74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき
- (74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信
- (74)代理人 100196405
弁理士 小松 邦光
- (74)代理人 100099759
弁理士 青木 篤
- (74)代理人 100077517
弁理士 石田 敬
- (74)代理人 100087871
弁理士 福本 積
- (74)代理人 100087413
弁理士 古賀 哲次
- (74)代理人 100117019
弁理士 渡辺 陽一
- (74)代理人 100150810
弁理士 武居 良太郎
- (74)代理人 100141977
弁理士 中島 勝
- (72)発明者 ペーター マイエンフィッシュ
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラーセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 クリストファー リチャード アイレス ゴドフリー
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラーセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ピエール ジョセフ マルセル ジュン
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラーセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 オトマール フランツ ヒュッター
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラーセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ペーター レノルト
スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラーセ, シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチェンゲゼルシャフト

審査官 黒川 美陶

- (56)参考文献 国際公開第2008/000438 (WO, A1)
国際公開第2008/074427 (WO, A1)
国際公開第2005/021488 (WO, A1)
国際公開第2005/073165 (WO, A1)
国際公開第2007/013332 (WO, A1)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07C 237/42
CAplus/REGISTRY (STN)

