

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2017-502964

(P2017-502964A)

(43) 公表日 平成29年1月26日 (2017.1.26)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/14 (2006.01)	C O 7 D 401/14	4 C O 5 O
C O 7 D 403/14 (2006.01)	C O 7 D 403/14 C S P	4 C O 6 3
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	4 C O 8 6
A 6 1 K 31/4155 (2006.01)	A 6 1 K 31/4155	4 H O 1 1
C O 7 D 409/14 (2006.01)	C O 7 D 409/14	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 170 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2016-544062 (P2016-544062)
 (86) (22) 出願日 平成26年12月30日 (2014.12.30)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年8月24日 (2016.8.24)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2014/079440
 (87) 国際公開番号 W02015/101622
 (87) 国際公開日 平成27年7月9日 (2015.7.9)
 (31) 優先権主張番号 14150153.6
 (32) 優先日 平成26年1月3日 (2014.1.3)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 516153362
 バイエル・アニマル・ヘルス・ゲゼルシャ
 フト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツ
 ング
 ドイツ連邦共和国、51373・レーパー
 クーゼン、カイザー・ヴィルヘルム・アレ
 ー・10
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢敦
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

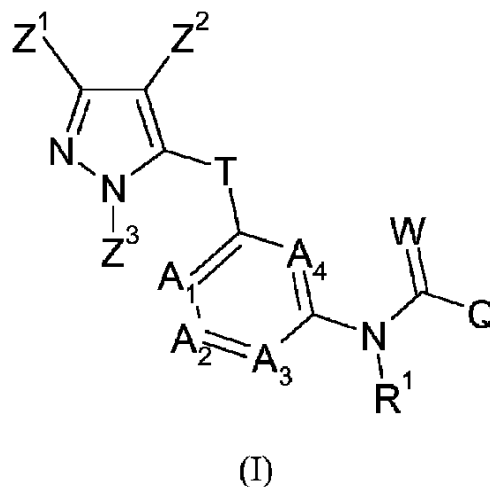
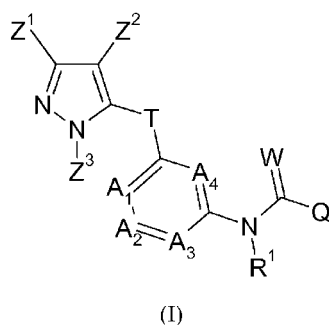
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺有害生物剤としての新規ピラゾリル-ヘテロアリアルアミド類

(57) 【要約】

本発明は、とりわけ、一般式 (I) [式中、ラジカル A_1-A_4 、T、W、Q、 R^1 及び Z^1-Z^3 は、本明細書中に記載されている意味を有する] で表されるピラゾリル-ヘテロアリアルアミドに関する。さらに、式 (I) で表される化合物を製造する方法も開示されている。本発明による化合物は、農業用途において昆虫類、クモ形類動物及び線虫類を防除するのに特に適しており、並びに、獣医学において外部寄生生物を防除するのに特に適している。

【化1】

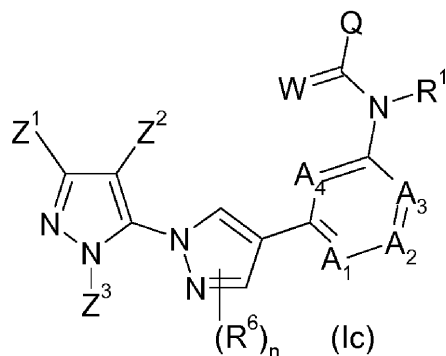


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I c)

【化 1】



10

〔式中、

R^1 は、水素、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、アリール ($C_1 - C_3$) -アルキル、ヘテロアリール ($C_1 - C_3$) -アルキルであり；

20

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの 3 つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $N - C_1 - C_6$ -アルコキシイミノ- $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $N - C_1 - C_6$ -アルキルアミノ又は N 、 N -ジ- $C_1 - C_6$ -アルキルアミノであり；

30

A_2 部分と A_3 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^3 と R^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に 5 員又は 6 員の環（ここで、該環は、0 個、1 個若しくは 2 個の窒素原子及び／又は 0 個若しくは 1 個の酸素原子及び／又は 0 個若しくは 1 個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A_1 部分と A_2 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と一緒に 5 員又は 6 員の環（ここで、該環は、0 個、1 個若しくは 2 個の窒素原子及び／又は 0 個若しくは 1 個の酸素原子及び／又は 0 個若しくは 1 個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；

40

W は、酸素又は硫黄であり；

Q は、水素、アミノであるか、又は、置換されていてもよい下記部分のうちの 1 つであり：アルキル、アルキルオキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシカルボニル、又は、 N -アルキルアミノ、 N -アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N -ジアルキルアミノ、アルキルスルホニルアミノ部分；又は、

Q は、 V で 1 ～ 5 置換されていてもよいアリール又は V で 1 ～ 5 置換されていてもよいヘテロアリールであり、ここで、

V は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、 N -アルコキシイミノアルキル、アルキルスルフ

50

アニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、N、N-ジアルキルアミノであり；

R⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルファニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルであり；及び、

nは、0-2の値を有し；

Z¹は、置換されていてもよいアルキル又はシクロアルキルであり；及び、

Z²は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいアルキル、アルキルカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルであり；及び、

10

Z³は、水素、又は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール若しくはヘタリールである]

で表される化合物。

【請求項2】

R¹が、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1-7置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₇-シクロアルキル、C₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、アリール(C₁-C₃)-アルキル、ヘテロアリール(C₁-C₃)-アルキルであり；

20

下記化学的部分が、以下の通りであり；

A₁が、CR²又は窒素であり；

A₂が、CR³又は窒素であり；

A₃が、CR⁴又は窒素であり；及び、

A₄が、CR⁵又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分A₁~A₄のうちの3つ以下であり；

R²、R³、R⁴及びR⁵が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1-7置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、N-C₁-C₆-アルコキシイミノ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルファニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、N-C₁-C₆-アルキルアミノ若しくはN、N-ジ-C₁-C₆-アルキルアミノであり；

30

Wが、酸素又は硫黄であり；

Qが、水素、アミノであるか、又は、独立してヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルバモイル、シクロアルキルカルバモイル若しくはフェニルで1-7置換されている以下の部分のうちの1つであり：C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₅-ヘテロシクリル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、アリール(C₁-C₃)-アルキル、ヘテロアリール(C₁-C₃)-アルキル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、N-C₁-C₄-アルキルアミノ、N-C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ-C₁-C₄-アルキルアミノ、C₁-C₄-アルキルスルホニルアミノ；又は、

40

Qが、水素、アミノであるか、又は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルオキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、5員若しくは6員のヘテロシクリル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアル

50

キル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6-C_{10} -アリール-
 (C_1-C_3) -アルキル、5員若しくは6員のヘテロアリール- (C_1-C_3) -アル
 キル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル [ここで、これらは、それぞれ、独立して、ヒ
 ドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、オキソ、ベンジルオキシ、 C_3-C_6 -シクロア
 ルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、シアノ、ヒドロキシカ
 ルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3-C_6 -シクロアルキルカルバモイル、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、フ
 ェニル (ここで、該フェニルは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロ
 アルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2
 又は3の置換基で置換されていてもよい)、フェニルチオ (ここで、該フェニルチオは、
 ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アル
 キルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されてい
 てもよい)、フェニルオキシ (ここで、該フェニルオキシは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アル
 コキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から
 独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、5員若しくは6員
 のヘテロアリール (例えば、ピラゾリル) (ここで、該ヘテロアリールは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる
 置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい) から
 なる群から選択される1、2、3、4、5、6又は7の置換基で置換されていてもよい] 10
 から選択される部分のうちの1つであり、又は、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N-
 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、 20

Qが、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、
 3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；
 又は、

Qが、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式ヘテロ環又は0、
 1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式炭素環であり；ここで、

Vが、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シア
 ノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1~7置換されていてもよい C_1-C_6
 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキ
 ニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコ
 キシ、N- C_1-C_6 -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキ
 ルスルファニル、 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
 、N、N-ジ- $(C_1-C_6$ -アルキル)アミノであり； 30

R^6 が、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで1
 ~7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -
 C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

nが、0-1の値を有し；

Z^1 が、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1~7置
 換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルであり；及び、 40

Z^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン
 、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1~7置換されている C_1-C_6
 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 C_1-C_6 -
 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であり；及び、

Z^3 が、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコ
 キシカルボニルで1~7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シク
 ロアルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -アルキニルであるか、又は、独立し
 てハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1~5置換されていてもよ
 いアリール若しくはヘタリールである； 50

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 が、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - アルケニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニルであり；

下記化学的部分が、以下の通りであり；

A_1 が、 CR^2 であり；

A_2 が、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 が、 CR^4 であり；及び、

A_4 が、 CR^5 であり；

W が、酸素であり；

R^6 が、 $C_1 - C_4$ - アルキルであり；

n が、0 - 1 の値を有し；

Z^1 が、いずれの場合にもハロゲン若しくはシアノで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_3 - C_6$ - シクロアルキルであり；

Z^2 が、いずれの場合にもハロゲン若しくはシアノで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_3 - C_6$ - シクロアルキルであり；

Z^3 が、水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルである；

請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、s - ブチル又は t - ブチルであり；

下記化学的部分が、以下の通りであり；

A_1 が、 CR^2 であり；

A_2 が、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 が、 CR^4 であり；及び、

A_4 が、 CR^5 であり；

W が、酸素であり；

R^6 が、水素であり；

Z^1 が、いずれの場合にもハロゲンで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキルであり；

Z^2 が、いずれの場合にもハロゲンで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキルであり；

Z^3 が、 $C_1 - C_6$ - アルキルである；

請求項 1、2 又は 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^2 及び R^5 が、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル及びメトキシであり；

R^3 及び R^4 が、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルである；

請求項 1 から 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R^2 及び R^5 が、それぞれ独立して、水素又はフッ素であり；

R^3 が、水素であり；及び、

R^4 が、水素、フッ素、塩素又はメチルである；

請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

Q が、

水素；

又は、

$C_1 - C_6$ - アルキル [ここで、該アルキルは、

10

20

30

40

50

フッ素、
 塩素、
 臭素、
 ヨウ素、
 シアノ、
 オキシ、
 メトキシ、
 ベンジルオキシ、
 エトキシ、
 N, N-ジメチルアミノ、

10

フェニルチオ（ここで、該フェニルチオは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

フェニルオキシ（ここで、該フェニルオキシは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

チオフェニル（ここで、該チオフェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

20

ピラゾリル（ここで、該ピラゾリルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、及び、

C_3-C_6 -シクロアルキル
 からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]
 ;
 又は、

C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、
 メトキシ、
 フッ素、
 塩素、
 臭素、
 ヨウ素、
 シアノ、
 メチル、

30

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル、トリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）

40

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]
 であり；

又は、

Qが、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：
 フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ブ

50

ロピル、ブチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである；
請求項1から6のいずれかに記載の化合物。

10

【請求項8】

Qが、

C₁-C₆-アルキル [ここで、該アルキルは、

フッ素、

オキシ、

メトキシ、

ベンジルオキシ、

エトキシ、

N, N-ジメチルアミノ、

フェニルチオ、

フェニルオキシ、

C₃-C₆-シクロアルキル、

フェニル (ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい)、

チオフェニル (ここで、該チオフェニルは、1、2、3又は4のトリフルオロメチル置換されていてもよい)、及び、

ピラゾリル (ここで、該ピラゾリルは、独立して、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい)

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

；

又は、

C₃-C₆-シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、

メトキシ、

塩素、

シアノ、

メチル、

フェニル (ここで、該フェニルは、独立して、塩素及びメチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい)

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

であり；

又は、

Qが、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、

20

30

40

50

チアジアゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル；ここで、

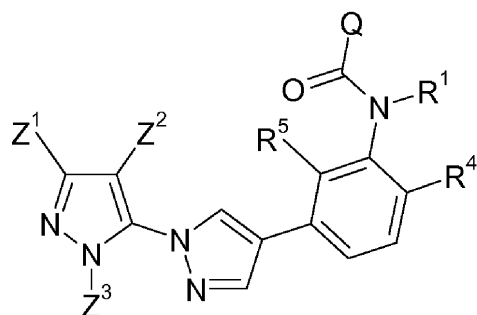
Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである；

請求項 1 から 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

前記化合物が、式 (Ic-1)

【化 2】



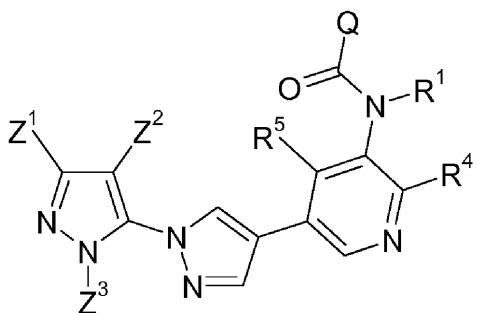
(Ic-1)

で表される化合物である、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、式 (Ic-2)

【化 3】



(Ic-2)

で表される化合物である、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

昆虫類、クモ形類動物及び線虫類を防除するための、請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の一般式 (I)、一般式 (Ia)、一般式 (Ib)、一般式 (Ic)、一般式 (Id)、一般式 (Ie)、一般式 (If)、一般式 (Ig)、一般式 (Ih)、一般式 (Ii) 及び一般式 (Ij) で表される化合物の使用。

【請求項 12】

請求項 1～10 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物を含んでいる医薬組成物。

【請求項 13】

薬物としての、請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 14】

動物における寄生生物を防除するための医薬組成物を製造するための、請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 15】

請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物並びに慣習的な増量剤及び／又は界面活性剤を含んでいる、作物保護組成物を製造する方法。

10

【請求項 16】

有害生物を防除する方法であって、請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物を有害生物及び／又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、前記方法。

【請求項 17】

植物の繁殖器官を保護するための、請求項 1～10 のいずれかに記載の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、新規ピラゾリルヘテロアリアルアミド類、それらを調製する方法、及び、害虫（特に、節足動物、とりわけ、昆虫類、クモ形類動物及び線虫類）を防除するためのそれらの使用に関する。

20

【背景技術】

【0002】

ハロゲンで置換されている特定の化合物が除草活性を示すことは知られている（cf. 「J. Org. Chem. 1997, 62 (17), 5908-5919」、 「J. Heterocycl. Chem. 1998, 35 (6), 1493-1499」、WO 2004/035545、WO 2004/106324、US 2006/069132、WO 2008/029084）。

【0003】

ハロゲンで置換されている特定の化合物が殺虫活性を示すことも知られている（EP 1 911 751、WO 2010/051926、WO 2012/069366、WO 2012/080376、WO 2012/107434、WO 2014/122083、WO 2014/135439、及び、WO 2014/135437）。

30

【0004】

さらに、ハロゲンで置換されている特定の化合物がサイトカイン阻害活性を示すことも知られている（WO 2000/07980）。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

【特許文献 1】国際特許出願公開第 2004/035545 号

40

【特許文献 2】国際特許出願公開第 2004/106324 号

【特許文献 3】米国特許出願公開第 2006/069132 号

【特許文献 4】国際特許出願公開第 2008/029084 号

【特許文献 5】欧州特許出願公開第 1911751 号

【特許文献 6】国際特許出願公開第 2010/051926 号

【特許文献 7】国際特許出願公開第 2012/069366 号

【特許文献 8】国際特許出願公開第 2012/080376 号

【特許文献 9】国際特許出願公開第 2012/107434 号

【特許文献 10】国際特許出願公開第 2014/122083 号

【特許文献 11】国際特許出願公開第 2014/135439 号

50

【特許文献 1 2】国際特許出願公開第 2 0 1 4 / 1 3 5 4 3 7 号

【特許文献 1 3】国際特許出願公開第 2 0 0 0 / 0 7 9 8 0 号

【非特許文献】

【0 0 0 6】

【非特許文献 1】J. Org. Chem. 1997, 62 (17), 5908
- 5919

【非特許文献 2】J. Heterocycl. Chem. 1998, 35 (6)
, 1493-1499

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

10

【0 0 0 7】

現代の作物保護組成物は、例えば、それらの作用のレベル、作用の持続期間及び作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。重要な問題は、毒性、及び、別の活性成分又は製剤助剤との組合せ可能性に関し、並びに、活性成分の合成の複雑さにも関する。さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由により、新規作物保護組成物の探求は、決して完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して少なくとも個々の性質に関して改善されている特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

【0 0 0 8】

本発明の目的は、さまざまな局面において殺有害生物剤 (pesticide) のスペクトルを拡大させ及び／又はそれらの活性を改善する化合物を提供することであった。

20

【課題を解決するための手段】

【0 0 0 9】

驚くべきことに、特定のピラゾリルヘテロアリアルアミド類並びにその N-オキシド及び塩が生物学的特性を有していて、害虫 (animal pest) を防除するのに特に適しており、従って、農薬分野及び動物衛生の分野において特に優れた有用性を有しているということが見いだされた。

【0 0 1 0】

類似した化合物は、WO 2 0 1 2 / 0 8 0 3 7 6 から既に知られている。この特許出願には、殺虫性化合物としての 1, 2, 3-トリアゾールベンズアニリド類が記載されている；他の種類のヘテロアロイルベンズアニリド類は記載されていない。

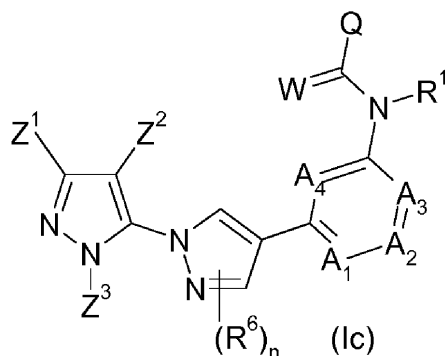
30

【0 0 1 1】

概要

本発明は、一般式 (Ic)

【化 1】



40

【0 0 1 2】

〔式中、

R¹ は、水素、置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、アリール (C₁ - C₃) - アルキル、ヘテロ

50

アリール ($C_1 - C_3$) - アルキルであり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $N - C_1 - C_6$ - アルコキシイミノ、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $N - C_1 - C_6$ - アルキルアミノ又は N 、 N - ジー $C_1 - C_6$ - アルキルアミノであり；

A_2 部分と A_3 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^3 と R^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A_1 部分と A_2 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；

W は、酸素又は硫黄であり；

Q は、水素、アミノであるか、又は、置換されていてもよい下記部分のうちの1つであり：アルキル、アルキルオキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシカルボニル、又は、 N - アルキルアミノ、 N - アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N - ジアルキルアミノ、アルキルスルホニルアミノ部分；又は、

Q は、 V で1～5置換されていてもよいアリール又は V で1～5置換されていてもよいヘテロアリールであり、ここで、

V は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、 N - アルコキシイミノアルキル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、 N 、 N - ジアルキルアミノであり；

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルであり；及び、

n は、0～2の値を有し（ $n = 0$ である場合、 R^6 は対応して H である）；

Z^1 は、置換されていてもよいアルキル又はシクロアルキルであり；及び、

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいアルキル、アルキルカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルであり；及び、

Z^3 は、水素、又は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール若しくはヘタリールである]

で表される化合物に関する。

【0013】

好ましい実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

R^1 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - アル

ケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ若しくはN、N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、アミノであるか、又は、独立してヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルバモイル、シクロアルキルカルバモイル、フェニルで1～7置換されている以下の部分のうちの1つであり： 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_2-C_5 -ヘテロシクリル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ；又は、

Qは、水素、アミノであるか、又は、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 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、5員若しくは6員のヘテロシクリル、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6-C_{10} -アリール- (C_1-C_3)-アルキル、5員若しくは6員のヘテロアリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル [ここで、これらは、それぞれ、独立して、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、オキソ、ベンジルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3-C_6 -シクロアルキルカルバモイル、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、フェニル (ここで、該フェニルは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、フェニルチオ (ここで、該フェニルチオは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、フェニルオキシ (ここで、該フェニルオキシは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、5員若しくは6員のヘテロアリール (例えば、ピラゾリル) (ここで、該ヘテロアリールは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる

10

20

30

40

50

置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい) からなる群から選択される1、2、3、4、5、6又は7の置換基で置換されていてもよい] から選択される部分のうちの1つであり、又は、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式ヘテロ環又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式炭素環であり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 N 、 N -ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノであり；

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

nは、0-1の値を有し；

Z^1 は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ又はアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルであり；及び、

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されている C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

Z^3 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -アルキニルであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～5置換されていてもよいアリール若しくはヘタリールである；

前記化合物に関する。

【0014】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

R^1 は、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -アルキニルであり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 であり；及び、

A_4 は、 CR^5 であり；

Wは、酸素であり；

R^6 は、 C_1-C_4 -アルキルであり；

nは、0-1の値を有し；

Z^1 は、いずれの場合にもハロゲン若しくはシアノで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル又は C_3-C_6 -シクロアルキルであり；

Z^2 は、いずれの場合にもハロゲン若しくはシアノで1～7置換されていてもよい C_1

10

20

30

40

50

—C₆—アルキル又はC₃—C₆—シクロアルキルであり；

Z³は、水素又はC₁—C₆—アルキルである；

前記化合物に関する。

【0015】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

R¹は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル又はt-ブチルであり、さらに好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A₁は、CR²であり；

A₂は、CR³又は窒素であり；

A₃は、CR⁴であり；及び、

A₄は、CR⁵であり；

Wは、酸素であり；

R⁶は、水素（n=0）であり；

Z¹は、いずれの場合にもハロゲンで1～7置換されていてもよいC₁—C₆—アルキルであり；

Z²は、いずれの場合にもハロゲンで1～7置換されていてもよいC₁—C₆—アルキルであり；

Z³は、C₁—C₆—アルキルである；

前記化合物に関する。

【0016】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル及びメトキシであり；

R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、C₁—C₄—アルキル、C₁—C₄—ハロアルキルである；

前記化合物に関する。

【0017】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素又はフッ素であり；

R³は、水素であり；及び、

R⁴は、水素、フッ素、塩素又はメチルである；

前記化合物に関する。

【0018】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

Qは、

水素；

又は、

C₁—C₆—アルキル [ここで、該アルキルは、

フッ素、

塩素、

臭素、

ヨウ素、

シアノ、

オキソ、

メトキシ、

10

20

30

40

50

ベンジルオキシ、

エトキシ、

N, N-ジ-C₁-C₄-アルキルアミノ、

フェニルチオ（ここで、該フェニルチオは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

フェニルオキシ（ここで、該フェニルオキシは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

チオフェニル（ここで、該チオフェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

ピラゾリル（ここで、該ピラゾリルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、及び、

C₃-C₆-シクロアルキル

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

；

又は、

C₃-C₆-シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、

メトキシ、

フッ素、

塩素、

臭素、

ヨウ素、

シアノ、

メチル、

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

であり；

又は、

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロ

10

20

30

40

50

ピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、 N -メトキシイミノメチル、1-(N -メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、 N , N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ（例えば、 N , N -ジメチルアミノ）である；

前記化合物に関する。

【0019】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、

Q は、

C_1-C_6 -アルキル [ここで、該アルキルは、

フッ素、

オキソ、

メトキシ、

ベンジルオキシ、

エトキシ、

N , N -ジメチルアミノ、

フェニルチオ、

フェニルオキシ、

C_3-C_6 -シクロアルキル、

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、フッ素、塩素及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、

チオフェニル（ここで、該チオフェニルは、1、2、3又は4のトリフルオロメチル置換されていてもよい）、及び、

ピラゾリル（ここで、該ピラゾリルは、独立して、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

；

又は、

C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、

メトキシ、

塩素、

シアノ、

メチル、

フェニル（ここで、該フェニルは、独立して、塩素、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]

であり；

又は、

Q は、0、1、2、3又は4の V 置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5- a]ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル；ここで、

V は、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル

10

20

30

40

50

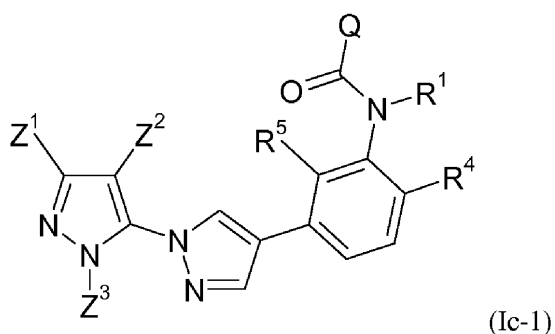
、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジ-C₁-C₄-アルキルアミノ（例えば、N, N-ジメチルアミノ）である；

前記化合物に関する。

【0020】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、該化合物が式（Ic-1）

【化2】



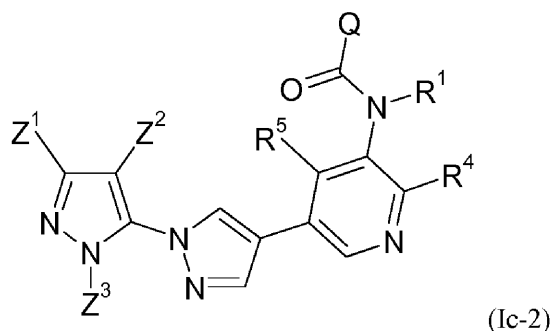
【0021】

で表される化合物である、前記化合物に関する。

【0022】

好ましいさらなる実施形態は、上記「概要」において記載されている本発明化合物において、該化合物が式（Ic-2）

【化3】



【0023】

で表される化合物である、前記化合物に関する。

【0024】

本発明は、さらにまた、昆虫類、クモ形類動物及び線虫類を防除するための本発明化合物（例えば、式（Ic）、式（Ic-1）又は式（Ic-2）で表される化合物）の使用；少なくとも1種類の本発明化合物を含んでいる医薬組成物；薬物として使用するための本発明化合物；動物における寄生生物を防除するための医薬組成物を製造するための本発

明化合物の使用；少なくとも1種類の本発明化合物並びに慣習的な増量剤及び／又は界面活性剤を含んでいる作物保護組成物を製造する方法；本発明化合物を有害生物及び／又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、有害生物を防除する方法；植物の繁殖器官（propagation material）を保護するための本発明化合物の使用も提供する。

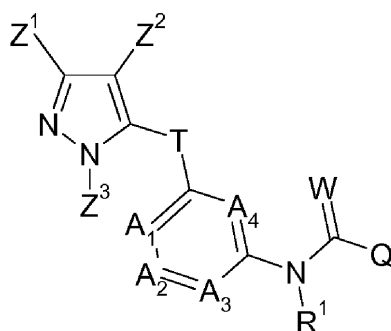
【発明を実施するための形態】

【0025】

詳細な説明

本発明のピラゾリルヘテロアリールアミド類は、一般式（I）

【化4】



(I)

【0026】

によって定義され、ここで、上記式中、

R¹ は、水素、置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－アルケニル、C₃－C₆－アルキニル、C₃－C₇－シクロアルキル、C₁－C₆－アルキルカルボニル、C₁－C₆－アルコキシカルボニル、アリール（C₁－C₃）－アルキル、ヘテロアリール（C₁－C₃）－アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり：

A₁ は、CR² 又は窒素であり；

A₂ は、CR³ 又は窒素であり；

A₃ は、CR⁴ 又は窒素であり；及び、

A₄ は、CR⁵ 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分A₁～A₄のうちの3つ以下であり；

R²、R³、R⁴ 及びR⁵ は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、N－C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₃－アルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、N－C₁－C₆－アルキルアミノ又はN、N－ジ－C₁－C₆－アルキルアミノであり；

A₂ 部分とA₃ 部分のいずれも窒素ではない場合、R³ とR⁴ はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A₁ 部分とA₂ 部分のいずれも窒素ではない場合、R² とR³ はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、アミノであるか、又は、置換されていてもよい下記部分のうちの1つであり：アルキル、アルキルオキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシカルボニル、又は、N-アルキルアミノ、N-アルキルカルボニルアミノ、N, N-ジアルキルアミノ、アルキルスルホニルアミノ部分；又は、

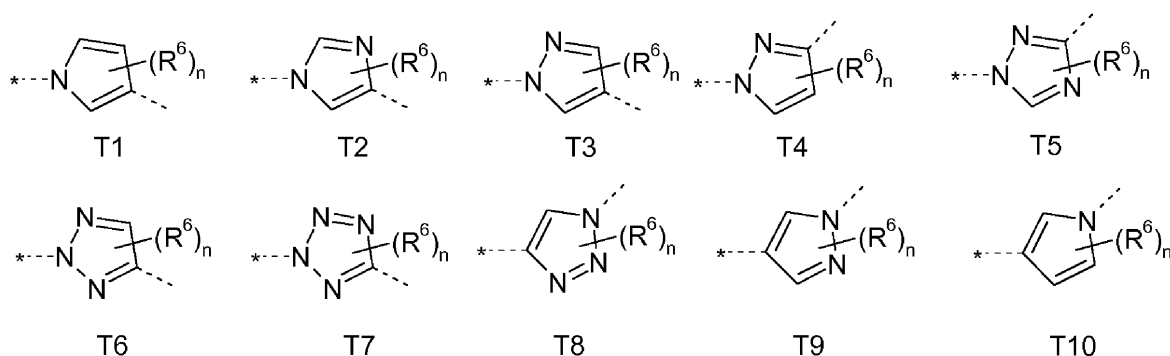
Qは、Vで1～5置換されていてもよいアリール又はVで1～5置換されていてもよいヘテロアリールであり、ここで、

Vは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、N, N-ジアルキルアミノであり；

10

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基（head group）への結合は星印で示されている）

【化5】



20

【0027】

ここで、

R⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルファニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルであり；及び、

30

nは、0-2の値を有し；

Z¹は、置換されていてもよいアルキル又はシクロアルキルであり；及び、

Z²は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいアルキル、アルキルカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルであり；及び、

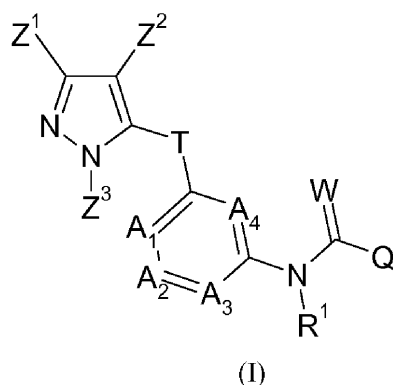
Z³は、水素、又は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール若しくはヘタリールである。

【0028】

好ましいのは、式(I)

【化6】

40



50

【0029】

〔式中、

R^1 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール(C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール(C_1-C_3)-アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり：

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 N -アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

A_2 部分と A_3 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^3 と R^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A_1 部分と A_2 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と一緒に6員環（ここで、該環は、0個、1個又は2個の窒素原子を含んでいる）を形成することができ；

W は、酸素又は硫黄であり；

Q は、水素、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 -アルコキシ若しくは C_1-C_6 -アルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_5 -ヘテロシクリル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6 -アリール- (C_1-C_3) -アルキル、5員若しくは6員のヘテロアリール、5員若しくは6員のヘテロアリール- (C_1-C_3) -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル部分であるか、又は、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、

Q は、0、1、2、3若しくは4の V 置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4の V 置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；

V は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 N 、 N -ジ- $(C_1-C_6$ -アルキル)アミノであり；

T は、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系 T_1-T_{10} のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

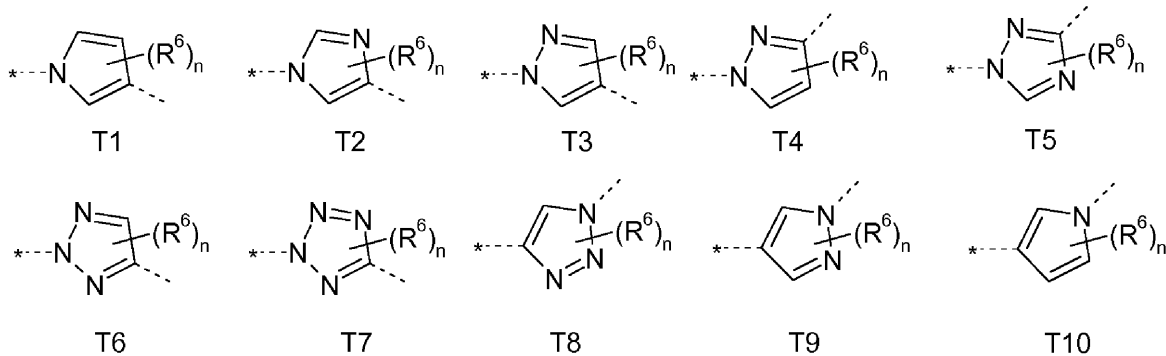
10

20

30

40

【化 7】



10

【0030】

ここで、

R^6 は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで 1～7 置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

n は、0～1 の値を有し；

Z^1 は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ又はアルコシカルボニルで 1～7 置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルであり；及び、

20

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコシカルボニルで 1～7 置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

Z^3 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコシカルボニルで 1～7 置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニルであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコシカルボニルで 1～5 置換されていてもよいアリール若しくはヘタリールである]

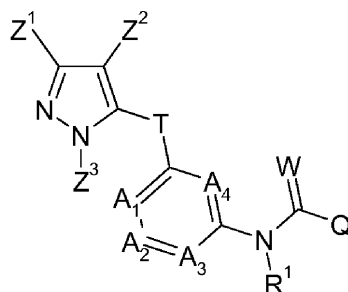
30

で表される化合物である。

【0031】

好ましいのは、さらにまた、式 (I)

【化 8】



(I)

40

【0032】

〔式中、

R^1 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコシカルボニルで 1～7 置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキル

50

カルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり：

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、N-アルコキシイミノアルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、N- C_1-C_6 -アルキルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

A_2 部分と A_3 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^3 と R^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A_1 部分と A_2 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と一緒に6員環（ここで、該環は、0個、1個又は2個の窒素原子を含んでいる）を形成することができ；

Qは、水素、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_5 -ヘテロシクリル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、アリール- (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル部分であるか、又は、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N- C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、

Qは、Vで1～5置換されていてもよいアリール又はVで1～5置換されていてもよいヘテロアリールであり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、N- C_1-C_6 -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、N、N-ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

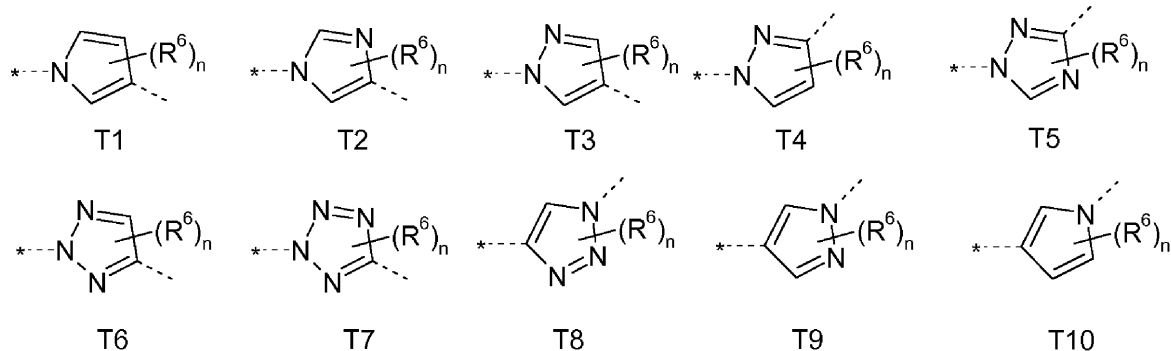
10

20

30

40

【化 9】



10

【0033】

ここで、

R⁶ は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで 1～7 置換されていてもよい C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルキルオキシ、C₁－C₆－アルキルカルボニル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニルであり；及び、

n は、0－1 の値を有し；

Z¹ は、置換されていてもよい C₁－C₆－ハロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－ハロシクロアルキルであり；及び、

20

Z² は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコシカルボニルで 1～7 置換されている C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルキルカルボニル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニルであり；及び、

Z³ は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコシカルボニルで 1～7 置換されていてもよい C₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－アルケニル、C₃－C₆－アルキニルであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコシカルボニルで 1～5 置換されていてもよいアリール又はヘタリールである]

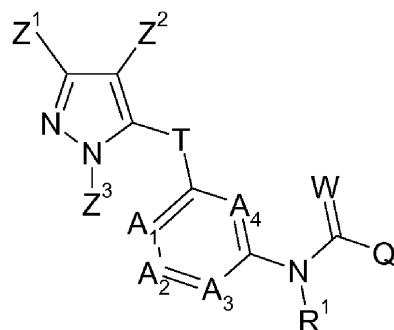
で表される化合物である。

30

【0034】

特に好ましいのは、式 (I)

【化 10】



(I)

40

【0035】

〔式中、

R¹ は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、メチルカルボ

50

ニル、エチルカルボニル、*n*-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、*s*-ブチルカルボニル、*t*-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー2-イルメチル、ピリダー3-イルメチル、ピリダー4-イルメチル、4-クロロピリダー3-イルメチルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A₁ は、CR² 又は窒素であり；

A₂ は、CR³ 又は窒素であり；

A₃ は、CR⁴ 又は窒素であり；及び、

A₄ は、CR⁵ 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 A₁ ~ A₄ のうちの3つ以下であり；

R² 及び R⁵ は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル及びメトキシであり；及び、

R³ 及び R⁴ は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、*N*-メトキシイミノメチル、1-(*N*-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであり；

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、*n*-ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(*N*-メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(*N*-シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、1, 1-ジメチルブター-2-イニル、3-クロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロパー-2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2

10

20

30

40

50

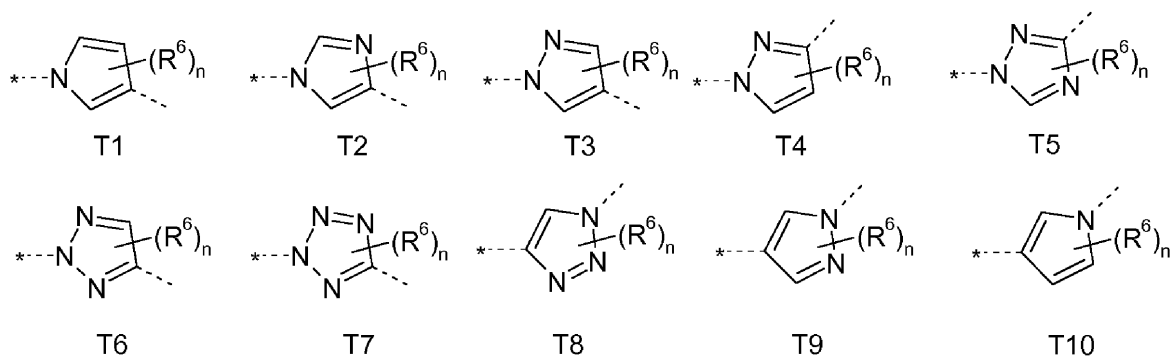
ー（メチルスルファニル）エチル、1－メチル－2－（エチルスルファニル）エチル、2－メチル－1－（メチルスルファニル）プロパン－2－イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、N－エチルアミノ、N－アリルアミノ、N，N－ジメチルアミノ、N，N－ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり；又は、

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1－フルオロエチル、2－フルオロエチル、2，2－ジフルオロエチル、2，2，2－トリフルオロエチル、1，2，2，2－テトラフルオロエチル、1－クロロ－1，2，2，2－テトラフルオロエチル、2，2，2－トリクロロエチル、2－クロロ－2，2－ジフルオロエチル、1，1－ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ－tert－ブチル、ヘプタフルオロ－n－プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ－n－ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n－プロポキシ、1－メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2，2，2－トリフルオロエトキシ、2－クロロ－2，2－ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N－メトキシイミノメチル、1－（N－メトキシイミノ）エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N，N－ジメチルアミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1－T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化11】



【0036】

ここで、

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、1－メチルエチル、tert－ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、2，2－ジフルオロエトキシ、2，2，2－トリフルオロエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニルであり；及び、

nは、0－1の値を有し；

Z¹は、メチル、エチル、1，1－ジメチルエチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブromoジクロロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1－フルオロエチル、1－フルオロ－1－メチルエチル、2－フルオロエチル、2，2－ジフルオロエチル、2，2，2－トリフルオロエチル、1，

2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-*t*-ブチル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-*n*-ブチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-プロモシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル (cyanpropyl)、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、シクロブチル及び2, 2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピルであり；及び、

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、1, 1-ジメチルエチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、プロモジクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-*t*-ブチル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-*n*-ブチル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルチオ、エチルスルフィニル、エチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルファニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ジクロロフルオロメチルスルファニル、ジクロロフルオロメチルスルフィニル、ジクロロフルオロメチルスルホニルであり；及び、

Z^3 は、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-プロピニル、1-ブチニル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルである]

で表される化合物である。

【0037】

とりわけ好ましいのは、一般式 (I) [式中、

Z^1 は、トリフルオロメチル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル又はペンタフルオロエチルであり；

Z^2 は、トリフルオロメチル、ニトロ、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、フッ素、塩素、臭素、シアノ又はヨウ素であり；

Z^3 は、メチル、エチル、*n*-プロピル又は水素であり；

R^1 は、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロボキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、*n*-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、*s*-ブチルカルボニル、*t*-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロボキシカルボニル、イソプロボキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー-2-イルメチル、ピリダー-3-イルメチル、ピリダー-4-イル-メチル、4-クロロピリダー-3-イル-メチルであり；

A_1 及び A_2 は、それぞれ、CHであり；

A_3 は、CR⁴であり；及び、

10

20

30

40

50

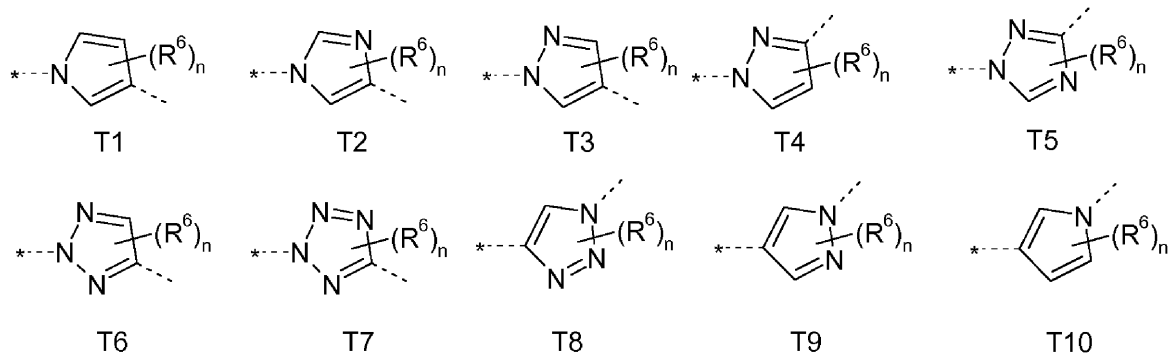
A_4 は、 CR^5 であり；

R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はシアノであり；

R^5 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はメトキシであり；

T は、以下に示されている 5 員ヘテロ芳香族系 T1-T10 のうちの 1 つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化 12】



10

【0038】

ここで、

R^6 は、水素 ($n=0$)、メチル、エチル、2-メチルエチル、2, 2-ジメチルエチル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノであり；

20

W は、酸素であり；

Q は、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、 n -ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N -メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N -シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、1, 1-ジメチルブター-2-イニル、3-クロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロパー-2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、 N -エチルアミノ、 N -アリルアミノ、 N , N -ジメチルアミノ、 N , N -ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり、最も好ましくは、

30

40

50

水素であり；又は、

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである]

で表される化合物である。

【0039】

さらにまた、とりわけ好ましいのは、一般式(I)〔式中、

Z¹は、トリフルオロメチル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル又はペンタフルオロエチルであり；

Z²は、トリフルオロメチル、ニトロ、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、フッ素、塩素、臭素、シアノ又はヨウ素であり；

Z³は、メチル、エチル、n-プロピル又は水素であり；

R¹は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー-2-イルメチル、ピリダー-3-イルメチル、ピリダー-4-イルメチル、4-クロロピリダー-3-イルメチルであり、最も好ましくは、水素であり；

A₁は、CHであり；

A₂は、窒素であり；

A₃は、CR⁴であり；及び、

A₄は、CR⁵であり；

R⁴は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はシアノであり；

R⁵は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はメトキシであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T₁-T₁₀のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

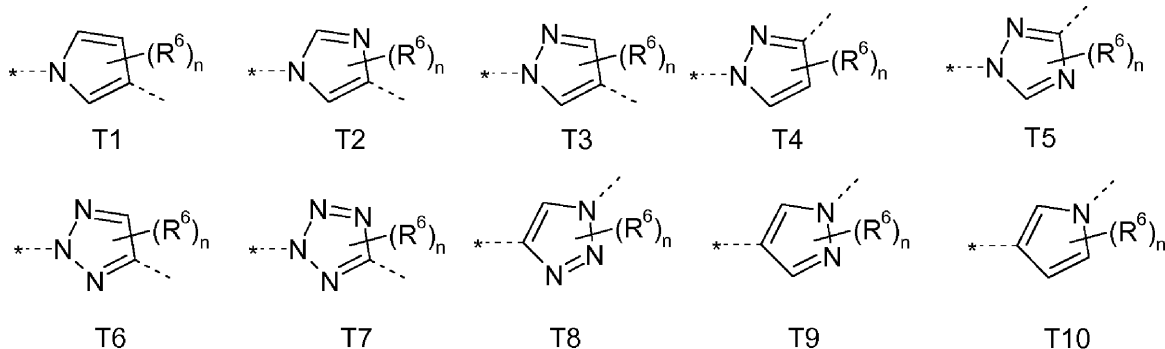
10

20

30

40

【化 1 3】



10

【0040】

ここで、

R^6 は、水素 ($n=0$)、メチル、エチル、2-メチルエチル、2,2-ジメチルエチル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノであり；

Wは、酸素であり；

Qは、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、 n -ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2,2-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、2,2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N -メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N -シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2,2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2,2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、1,1-ジメチルブター-2-イニル、3-クロロプロパー-2-エニル、3,3-ジクロロプロパー-2-エニル、3,3-ジクロロ-1,1-ジメチルプロパー-2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1,1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2,6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2,5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、 N -エチルアミノ、 N -アリルアミノ、 N 、 N -ジメチルアミノ、 N 、 N -ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり；又は、

20

30

40

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

50

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである〕
で表される化合物である。

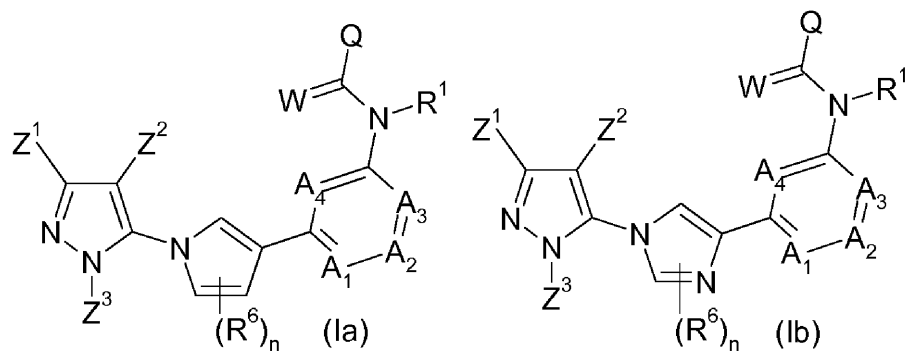
10

【0041】

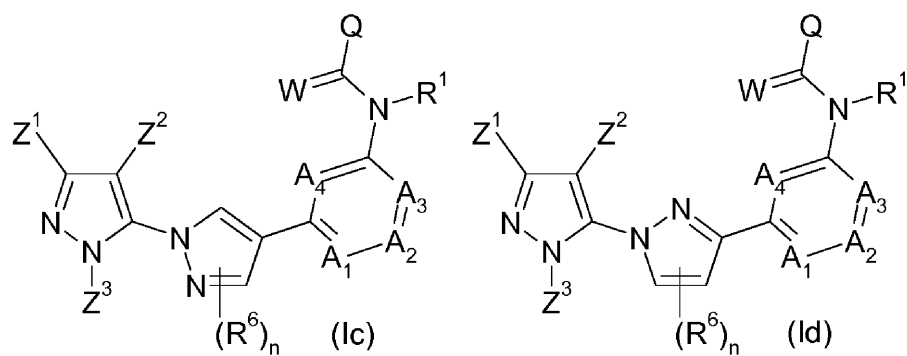
さらにまた、とりわけ好ましいのは、それぞれ、一般式(I a)、一般式(I b)、一般式(I c)、一般式(I d)、一般式(I e)、一般式(I f)、一般式(I g)、一般式(I h)、一般式(I i)及び一般式(I j)〔式中、 A_1-A_4 、n、W、Q、 R^1 及び Z^1-Z^3 ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである〕のうちの1つによって定義される化合物である。

20

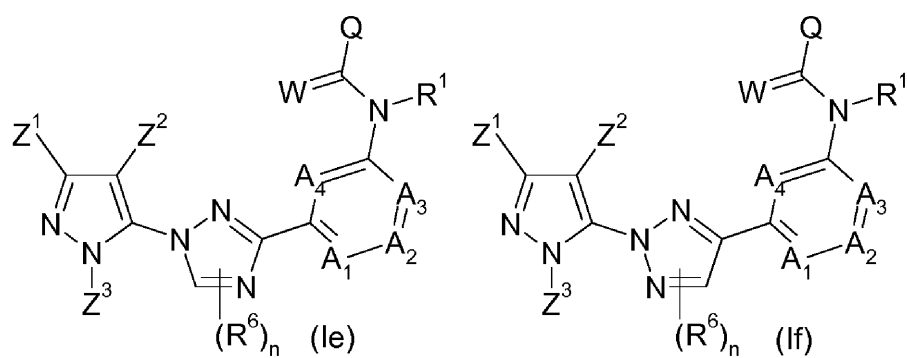
【化 1 4】



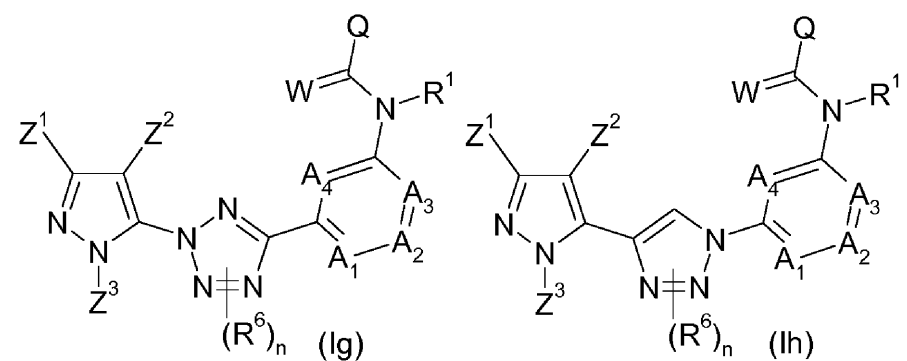
10



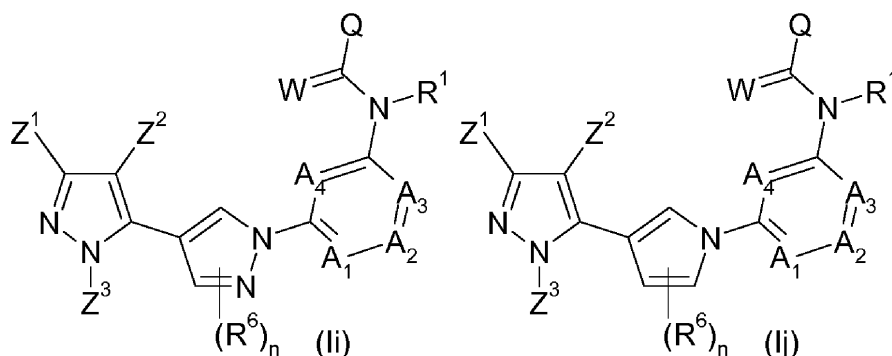
20



30



40



10

【0042】

極めて特に好ましいのは、一般式 (Ic) [式中、 Z^1 は、 CF_2CF_3 であり、 Z^2 は、 CF_3 であり、 Z^3 は、 CH_3 であり、 R^1 、 R^6 ラジカルは、水素 ($n=0$) であり、 A_1 、 A_2 は、 $C-H$ であり、 A_3 は、 $C-H$ 、 $C-Cl$ 、 $C-F$ であり、 A_4 は、 $C-H$ 、 $C-F$ 、 $C-OMe$ であり、 W は、酸素であり、及び、 Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである] で表される化合物である。

20

【0043】

極めて特に好ましいのは、一般式 (Ic) [式中、 Z^1 は、 CF_2CF_3 であり、 Z^2 は、 CF_3 であり、 Z^3 は、 CH_3 であり、 R^1 、 R^6 ラジカルは、水素 ($n=0$) であり、 A_1 は、 CH であり、 A_2 は、 N であり、 A_3 は、 $C-H$ 、 $C-Cl$ 、 $C-F$ 、 $C-CH_3$ であり、 A_4 は、 $C-H$ 、 $C-F$ 、 $C-OMe$ であり、 W は、酸素であり、及び、 Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである] で表される化合物である。

30

【0044】

極めて特に好ましいのは、一般式 (Ih) [式中、 Z^1 は、 CF_2CF_3 であり、 Z^2 は、 CF_3 であり、 Z^3 は、 CH_3 であり、 R^1 、 R^6 ラジカルは、水素 ($n=0$) であり、 A_1 、 A_2 は、 $C-H$ であり、 A_3 は、 $C-H$ 、 $C-Cl$ 、 $C-F$ であり、 A_4 は、 $C-H$ 、 $C-F$ 、 $C-OMe$ であり、 W は、酸素であり、及び、 Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである] で表される化合物である。

40

【0045】

極めて特に好ましいのは、一般式 (Ih) [式中、 Z^1 は、 CF_2CF_3 であり、 Z^2 は、 CF_3 であり、 Z^3 は、 CH_3 であり、 R^1 、 R^6 ラジカルは、水素 ($n=0$) であり、 A_1 は、 CH であり、 A_2 は、 N であり、 A_3 は、 $C-H$ 、 $C-Cl$ 、 $C-F$ 、 $C-$

50

C₃H₇であり、A₄は、C-H、C-F、C-OMeであり、Wは、酸素であり、及び、Qは、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである〕で表される化合物である。

【0046】

定義

10

本発明によれば、「アルキル」は、単独で、又は、化学基の一部として、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1, 2-ジメチルプロピル、1, 1-ジメチルプロピル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 2-ジメチルプロピル、1, 3-ジメチルブチル、1, 4-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチルブチル及び2-エチルブチルなどを表す。同様に好ましいのは、1～4個の炭素原子を有するアルキル、例えば、とりわけ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル又はt-ブチルなどである。本発明によるアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0047】

本発明によれば、「アルケニル」は、単独で、又は、化学基の一部として、好ましくは2～6個の炭素原子及び少なくとも1の二重結合を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、ビニル、2-プロペニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル及び1-エチル-2-メチル-2-プロペニルなどを表す。同様に好ましいのは、2～4個の炭素原子を有するアルケニル、例えば、とりわけ、2-プロペニル、2-ブテニル又は1-メチル-2-プロペニルなどである。本発明によるアルケニルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

40

【0048】

本発明によれば、「アルキニル」は、単独で、又は、化学基の一部として、好ましくは2～6個の炭素原子及び少なくとも1の三重結合を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-

50

メチル-3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル及び2, 5-ヘキサジイニルなどを表す。同様に好ましいのは、2~4個の炭素原子を有するアルキニル、例えば、とりわけ、エチニル、2-プロピニル又は2-ブチニル-2-プロペニルなどである。本発明によるアルキニルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0049】

本発明によれば、「シクロアルキル」は、単独で、又は、化学基の一部として、好ましくは3~10個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式の炭化水素、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビスシクロ[2. 2. 1]ヘプチル、ビスシクロ[2. 2. 2]オクチル又はアダマンチルなどを表す。同様に好ましいのは、3個、4個、5個、6個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピル又はシクロブチルなどである。本発明によるシクロアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0050】

本発明によれば、「アルキルシクロアルキル」は、好ましくは4~10個又は4~7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のアルキルシクロアルキル、例えば、エチルシクロプロピル、イソプロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチル及び4-メチルシクロヘキシルなどを表す。同様に好ましいのは、4個、5個又は7個の炭素原子を有するアルキルシクロアルキル、例えば、とりわけ、エチルシクロプロピル又は4-メチルシクロヘキシルなどである。本発明によるアルキルシクロアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0051】

本発明によれば、「シクロアルキルアルキル」は、好ましくは4~10個又は4~7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のシクロアルキルアルキル、例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル及びシクロペンチルエチルなどを表す。同様に好ましいのは、4個、5個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピルメチル又はシクロブチルメチルなどである。本発明によるシクロアルキルアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0052】

本発明によれば、「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し、特に、フッ素、塩素又は臭素を表す。

【0053】

本発明によるハロゲンで置換されている化学基（例えば、ハロアルキル、ハロシクロアルキル、ハロアルキルオキシ、ハロアルキルスルファニル、ハロアルキルスルフィニル又はハロアルキルスルホニル）は、ハロゲンで、1置換されているか、又は、置換基の可能な最大数まで多置換されている。ハロゲンで多置換されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なっているもよく、そして、全てが1個の炭素原子に結合していてもよい。これに関連して、ハロゲンは、特に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、好ましくは、フッ素、塩素又は臭素であり、さらに好ましくは、フッ素である。

40

【0054】

本発明によれば、「ハロシクロアルキル」は、好ましくは3~10個の炭素原子を有す

50

る、単環式、二環式又は三環式のハロシクロアルキル、例えば、とりわけ、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル又は1-フルオロシクロブチルなどを表す。同様に好ましいのは、3個、5個又は7個の炭素原子を有するハロシクロアルキルである。本発明によるハロシクロアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0055】

本発明によれば、「ハロアルキル」、「ハロアルケニル」又は「ハロアルキニル」は、好ましくは1~9個の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有する、ハロゲンで置換されているアルキル、アルケニル又はアルキニルを表し、例えば、以下のものを表す：モノハロアルキル、例えば、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 CHClCH_3 、 CHFCH_3 、 CH_2Cl 、 CH_2F ；ペルハロアルキル、例えば、 CCl_3 又は CF_3 又は CF_2CF_3 ；ポリハロアルキル、例えば、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CHFCl 、 CHCl_2 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 CH_2CF_3 。同様のことは、ハロアルケニル及びハロゲンで置換されているラジカルにも当てはまる。ハロアルコキシは、例えば、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 及び $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ である。

10

【0056】

ハロアルキルのさらなる例は、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル及びペンタフルオロ-tert-ブチルである。好ましいのは、1~4個の炭素原子とフッ素、塩素及び臭素から選択される1~9個（好ましくは、1~5個）の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキルである。特に好ましいのは、1個又は2個の炭素原子とフッ素及び塩素から選択される1~5個の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキル、例えば、とりわけ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又は2, 2-ジフルオロエチルなどである。

20

【0057】

本発明によれば、「ヒドロキシアルキル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコール、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、s-ブタノール及びtert-ブタノールなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル基。本発明によるヒドロキシアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0058】

本発明によれば、「アルコキシ」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のO-アルキル、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ及びtert-ブトキシなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するアルコキシ基。本発明によるアルコキシ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

【0059】

本発明によれば、「ハロアルコキシ」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、ハロゲンで置換されている直鎖又は分枝鎖のO-アルキル、例えば、とりわけ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するハロアルコキシ基。本発明によるハロアルコキシ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0060】

本発明によれば、「アルキルスルファニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有す

50

る、直鎖又は分枝鎖のS-アルキル、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ及びt-ブチルチオなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するアルキルスルファニル基。本発明によるアルキルスルファニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0061】

ハロアルキルスルファニル（即ち、ハロゲンで置換されているアルキルスルファニル基）の例としては、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ又は2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオなどを挙げるができる。

10

【0062】

本発明によれば、「アルキルスルフィニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルスルフィニル、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル及びt-ブチルスルフィニルなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル基。本発明によるアルキルスルフィニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0063】

ハロアルキルスルフィニル基（即ち、ハロゲンで置換されているアルキルスルフィニル基）の例としては、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニルなどを挙げるができる。

【0064】

本発明によれば、「アルキルスルホニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルスルホニル、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル及びt-ブチルスルホニルなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するアルキルスルホニル基。本発明によるアルキルスルホニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0065】

ハロアルキルスルホニル基（即ち、ハロゲンで置換されているアルキルスルホニル基）の例としては、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、1-フルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルホニルなどを挙げるができる。

40

【0066】

本発明によれば、「アルキルカルボニル」は、好ましくは2~7個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキル-C(=O)、例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル及びt-ブチルカルボニルなどを表す。同様に好ましくは、1~4個の炭素原子を有するアルキルカルボニル。本発明によるアルキルカルボニルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0067】

本発明によれば、「シクロアルキルカルボニル」は、好ましくはシクロアルキル部分に3~10個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のシクロアルキルカルボニル、例えば、

50

シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル、ビスクロ[2. 2. 1]ヘプチル、ビスクロ[2. 2. 2]オクチルカルボニル及びアダマンチルカルボニルなどを表す。同様に好ましくは、シクロアルキル部分に3個、5個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキルカルボニル。本発明によるシクロアルキルカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0068】

本発明によれば、「アルコキシカルボニル」は、単独で、又は、化学基の一部として、好ましくはアルコキシ部分に1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコキシカルボニル、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル及び*t*-ブトキシカルボニルなどを表す。本発明によるアルコキシカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0069】

本発明によれば、「アルキルアミノカルボニル」は、好ましくはアルキル部分に1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルアミノカルボニル、例えば、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、*n*-プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、*s*-ブチルアミノカルボニル及び*t*-ブチルアミノカルボニルなどを表す。本発明によるアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0070】

本発明によれば、「N, N-ジアルキルアミノカルボニル」は、好ましくはアルキル部分に1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のN, N-ジアルキルアミノカルボニル、例えば、N, N-ジメチルアミノカルボニル、N, N-ジエチルアミノカルボニル、N, N-ジ(*n*-プロピルアミノ)カルボニル、N, N-ジ(イソプロピルアミノ)カルボニル及びN, N-ジ(*s*-ブチルアミノ)カルボニルなどを表す。本発明によるN, N-ジアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0071】

本発明によれば、「アリール」は、好ましくは6～14個（特に、6～10個）の環炭素原子を有する、単環式、二環式又は多環式の芳香族系、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルなどを表し、好ましくは、フェニルを表す。さらに、アリールは、テトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、フルオレニル、ビフェニルなどの多環式系も表す（ここで、結合部位は、芳香族系上に存在する）。同様に、1つの環がアリールであり及び第2の環はアリールではない二環式炭素環（環原子としては炭素のみ）、例えば、テトラリニル(C₁₀H₁₁)なども包含される（ここで、結合部位は、芳香族環上に存在し得るか又は非芳香族環上に存在し得る）。本発明によるアリール基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0072】

置換されているアリールの例は、アリールアルキルであり、これは、同様に、1以上の同一であるか又は異なっているラジカル並びにアルキル及び／又はアリール部分で置換され得る。そのようなアリールアルキルの例としては、ベンジル及び1-フェニルエチルなどを挙げることができる。

40

【0073】

本発明によれば、「ヘテロ環」、「ヘテロ環式環」又は「ヘテロ環式環系」（ヘテロシクリル）は、少なくとも1個の炭素原子がヘテロ原子（好ましくは、N、O、S、P、B、Si、Seの群から選択されるヘテロ原子）で置き換えられている少なくとも1の環（ここで、該環は、飽和又は部分的な飽和であり、そして、同時に、置換されていなくてもよい）を有する炭素環式環系を表し、ここで、結合部位は環原子上に存在している。別途定義されていない限り、該ヘテロ環式環は、

50

そのヘテロ環式環内に、好ましくは3～9個の環原子（特に、3～6個の環原子）及び1個以上（好ましくは、1～4個、特に、1個、2個又は3個）のヘテロ原子（好ましくは、N、O及びSの群から選択されるヘテロ原子）を含んでいるが、2個の酸素原子は直接隣接することはできない。該ヘテロ環式環は、通常、4個以下の窒素原子及び／又は2個以下の酸素原子及び／又は2個以下の硫黄原子を含んでいる。該ヘテロシクリルラジカル又は該ヘテロ環式環が置換されていてもよい場合、それは、別の炭素環式環又はヘテロ環式環に縮合していてもよい。置換されていてもよいヘテロシクリルの場合、本発明は、さらに、置換されていてもよい多環式ヘテロ環、好ましくは、二環式ヘテロ環、例えば、以下のものも包含する：8-アザビシクロ[3.2.1]オクタニル又は1-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、ベンゾチオフェニル、例えば、ベンゾチオフェン-2-イル、ベンゾフラニル、例えば、ベンゾフラン-2-イル、[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジニル、例えば、[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル、1,3-ベンゾジオキサニル、例えば、1,3-ベンゾジオキサニル-5-イル。置換されていてもよいヘテロシクリルの場合、本発明は、さらに、スピロ環式系（例えば、1-オキサ-5-アザスピロ[2.3]ヘキシル）も包含する。

【0074】

本発明によるヘテロシクリル基は、例えば、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ジオキサラニル、ジオキサニル、ピラゾリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、オキシラニル、アゼチジニル、アジリジニル、オキサゼチジニル、オキサジリジニル、オキサゼパニル、オキサジナニル、アゼパニル、オキソピロリジニル、ジオキソピロリジニル、オキソモルホリニル、オキソペペラジニル及びオキセパニルなどである。

【0075】

特に重要なのは、ヘテロアリール、即ち、ヘテロ芳香族系である。本発明によれば、表現「ヘテロアリール」は、ヘテロ芳香族化合物、即ち、ヘテロ環の上記定義に包含される完全に不飽和の芳香族ヘテロ環式化合物を表す。好ましくは、上記群から選択される1～3個（好ましくは、1個又は2個）の同一であるか又は異なっているヘテロ原子を有する5～7員の環。本発明によるヘテロアリールは、例えば、フラニル、チオフェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、アゼピニル、ピロリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-オキサジニル、1,3,2-オキサジニル、1,3,6-オキサジニル、1,2,6-オキサジニル、オキセピニル、チエピニル、1,2,4-トリアゾロニル及び1,2,4-ジアゼピニルなどである。本発明によるヘテロアリール基も、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0076】

置換されている基、例えば、置換されているアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル、ヘテロシクリル及びヘテロアリールラジカルは、例えば、置換されていない基礎構造から誘導される置換されているラジカルを意味し、ここで、該置換基は、例えば、以下のものからなる群から選択される1以上（好ましくは、1、2又は3）のラジカルである：ハロゲン、オキソ（O=）、アルコキシ、アルキルスルファニル、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、カルボキシル又はカルボキシル基と同等な基、シアノ、イソシアノ、アジド、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、ホルミル、カルバモイル、モノアルキルアミノカルボニル、N、N-ジアルキルアミノカルボニル、置換されているアミノ、例えば、アシルアミノ、モノアルキルアミノ、N、N-ジアルキルアミノ、トリアルキルシリル、及び、置換されていてもよいシクロアルキル

、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロシクリル（ここで、最後の方の環状基は、いずれも、ヘテロ原子で結合していてもよい）、及び、アルキルスルフィニル（これは、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを包含する）、アルキルスルホニル、アルキルホスフィニル、アルキルホスホニル、並びに、環状ラジカル（＝「環状基礎構造」）の場合、さらに、アルキル、ハロアルキル、アルキルスルファニルアルキル、アルコキシアルキル、置換されていてもよいモノアルキルアミノアルキル、N，N－ジアルキルアミノアルキル及びヒドロキシアルキル。

【0077】

置換されているアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールなどのような用語「置換されている基」は、置換基として、上記炭化水素ラジカルに加えて、対応する不飽和の脂肪族及び芳香族ラジカル、例えば、いずれの場合にも置換されていてもよいアルケニル、アルキニル、オキシ（O＝）、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリールオキシ（例えば、フェニルオキシ（フェニル－O－）、ベンジルオキシ（C₆H₅－CH₂－O－）、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、アリールチオ（例えば、フェニルチオ（フェニル－S－））、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、アルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、モノアルケニルアミノカルボニル、N，N－ジアルケニルアミノカルボニル、モノアルキニルアミノカルボニル、ジアルキニルアミノカルボニル、モノアルケニルアミノ、N，N－ジアルケニルアミノ、モノアルキニルアミノ、N，N－ジアルキニルアミノ、トリアルケニルシリル、トリアルキニルシリル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、ヘテロアリール、アリール、例えば、フェニル、フェノキシなども包含する。環内に脂肪族成分を有している置換されている環状ラジカルの場合は、さらに、以下のものも包含される：単結合によって又は環上の二重結合（例えば、アルキリデン基（例えば、メチリデン又はエチリデン）、又は、オキシ基、イミノ基若しくは置換されているイミノ基）によって当該環に結合している上記置換基を有している環式系、又は、第2の環が当該環状ラジカルと異なる2個の原子に異なる2個の原子によって結合している上記置換基を有している環式系、例えば、ナフチル又はテトラヒドロナフタレニル（例えば、1，2，3，4－テトラヒドロナフタレン－1－イル）。

【0078】

2以上のラジカルが1以上の環を形成する場合、該環は、炭素環式、ヘテロ環式、飽和、部分的飽和、不飽和、例えば、さらに、芳香族であることができ、及び、さらに置換されていてもよい。

【0079】

例として上記で挙げられている置換基（「第1の置換基レベル」）は、それらが炭化水素部分を含んでいる場合、その炭化水素部分において、例えば、第1の置換基レベルに関して定義されている置換基のうちの1つによって、さらに置換されていてもよい（「第2の置換基レベル」）。対応するさらなる置換基レベルも可能である。用語「置換されているラジカル」は、好ましくは、1又は2の置換基レベルのみを含んでいる。

【0080】

上記置換基レベルに関する好ましい置換基は、例えば、以下のものである：アミノ、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、イソシアノ、メルカプト、イソチオシアト、カルボキシ、カルボンアミド、SF₅、アミノスルホニル、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、アルキニル、N－モノ－アルキルアミノ、N，N－ジアルキルアミノ、N－アルカノイルアミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルコキシ、シクロアルケニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アルカノイル、アルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、アリールカルボニル、アルキルスルファニル、シクロアルキルスルファニル、アルケニルチオ、シクロアルケニルチオ、アルキニルチオ、アルキルスルフェニル、及び、アルキルスルフィニル（これは、

、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを包含する)、アルキルスルホニル、N-モノアルキルアミノスルホニル、N, N-ジアルキルアミノスルホニル、アルキルホスフィニル、アルキルホスホニル(これらは、アルキルホスフィニル及びアルキルホスホニルの両方のエナンチオマーを包含する)、N-アルキルアミノカルボニル、N, N-ジアルキルアミノカルボニル、N-アルカノイルアミノカルボニル、N-アルカノイル-N-アルキルアミノカルボニル、アリール、アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、アリールチオ、アリールアミノ、ベンジルアミノ、ヘテロシクリル、及び、トリアルキルシリル。

【0081】

2以上の置換基レベルで構成される置換基は、好ましくは、アルコキシアルキル、アルキルスルファニルアルキル、アルキルスルファニルアルコキシ、アルコキシアルコキシ、フェネチル、ベンジルオキシ、ハロアルキル、ハロシクロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルスルファニル、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、ハロアルカノイル、ハロアルキルカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、ハロアルコキシアルコキシ、ハロアルコキシアルキルスルファニル、ハロアルコキシアルカノイル、ハロアルコキシアルキルである。

【0082】

炭素原子を有しているラジカルの場合、好ましいのは、1~6個の炭素原子(好ましくは、1~4個の炭素原子、特に、1個又は2個の炭素原子)を有するラジカルである。概して、以下のものからなる群から選択される置換基が好ましい: ハロゲン、例えば、フッ素及び塩素、(C₁-C₄)アルキル、好ましくは、メチル又はエチル、(C₁-C₄)ハロアルキル、好ましくは、トリフルオロメチル、(C₁-C₄)アルコキシ、好ましくは、メトキシ又はエトキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、ニトロ、及び、シアノ。特に好ましいのは、置換基メチル、メトキシ、フッ素及び塩素である。

【0083】

置換されているアミノ(例えば、1置換アミノ又は2置換アミノ)は、例えば、アルキル、ヒドロキシル、アミノ、アルコキシ、アシル及びアリールからなる群から選択される1又は2の同一であるか又は異なっているラジカルでN-置換されている置換アミノラジカルの群から選択されるラジカルであり; 好ましくは、N-モノアルキルアミノ及びN, N-ジアルキルアミノ(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、N, N-ジー-n-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノ又はN, N-ジブチルアミノ)、N-モノアルコキシアルキルアミノ及びN, N-ジアルコキシアルキルアミノ基(例えば、N-メトキシメチルアミノ、N-メトキシエチルアミノ、N, N-ジ(メトキシメチル)アミノ又はN, N-ジ(メトキシエチル)アミノ)、N-モノアリールアミノ及びN, N-ジアリールアミノ、例えば、置換されていてもよいアニリン、アシルアミノ、N, N-ジアシルアミノ、N-アルキル-N-アリールアミノ、N-アルキル-N-アシルアミノ、及び、飽和N-ヘテロ環である; 好ましくは、アルキルラジカルは、1~4個の炭素原子を有する; アリールは、好ましくは、フェニル又は置換されているフェニルである; アシルは、以下でさらに定義されているとおりであり、好ましくは、(C₁-C₄)アルカノイルである。同様のことは、置換されているヒドロキシルアミノ又はヒドラジノにも当てはまる。

【0084】

本発明によれば、用語「環状アミノ基」は、1個以上の窒素原子を有しているヘテロ芳香族環系又は脂肪族環系を包含する。該ヘテロ環は、飽和又は不飽和で、1以上の縮合していてもよい環系からなり、そして、さらなるヘテロ原子(例えば、1個又は2個の窒素原子、酸素原子及び/又は硫黄原子)を含んでいてもよい。さらに、該用語は、スピロ環系又は架橋環系を有している基も包含する。該環状アミノ基を形成する原子の数は無制限であり、そして、該基は、1環系の場合は、例えば、3~8個の環原子で構成されることができ、2環系の場合は、例えば、7~11個の環原子で構成されることができる。

【0085】

ヘテロ原子として1個の窒素原子を有している飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、1-アゼチジニル、ピロリジノ、2-ピロリン-1-イル、1-ピロリル、ピペリジノ、1, 4-ジヒドロピラジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピラジン-1-イル、1, 4-ジヒドロピリジン-1-イル、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル、ホモピペリジニルなどを挙げることができる；ヘテロ原子として2個以上の窒素原子を有している飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、1-イミダゾリジニル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-トリアゾリル、1-テトラゾリル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル、1, 2-ジヒドロピリダジン-1-イル、1, 2-ジヒドロピリミジン-1-イル、ペルヒドロピリミジン-1-イル、1, 4-ジアザシクロヘプタン-1-イルなどを挙げることができる；ヘテロ原子として1個又は2個の酸素原子と1～3個の窒素原子を有している飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例は、例えば、オキサゾリジン-3-イル、2, 3-ジヒドロイソオキサゾール-2-イル、イソオキサゾール-2-イル、1, 2, 3-オキサジアジン-2-イル、モルホリノである；ヘテロ原子として1～3個の窒素原子と1～2個の硫黄原子とを有している飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、チアゾリジン-3-イル、イソチアゾリン-2-イル、チオモルホリノ又はジオキソチオモルホリノなどを挙げることができる；飽和及び不飽和の縮合環基を有する環状アミノ基の例としては、インドール-1-イル、1, 2-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル、ペルヒドロピロロ[1, 2-a]ピラジン-2-イルなどを挙げることができる；スピロ環式基を有する環状アミノ基の例は、2-アザスピロ[4. 5]デカン-2-イルである；架橋ヘテロ環式基を有する環状アミノ基の例としては、2-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-7-イルなどを挙げることができる。

10

20

【0086】

置換されているアミノには、窒素原子上に4つの有機置換基を有している第4級アンモニウム化合物（塩）も包含される。

【0087】

置換されていてもよいフェニルは、好ましくは、置換されていないフェニルであるか、又は、ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルスルファニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルファニル、シアノ、イソシアノ及びニトロからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているフェニル、例えば、o-トリル、m-トリル、p-トリル、ジメチルフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、o-メトキシフェニル、m-メトキシフェニル及びp-メトキシフェニルなどである。

30

【0088】

置換されていてもよいシクロアルキルは、好ましくは、置換されていないシクロアルキルであるか、又は、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル及び(C₁-C₄)ハロアルコキシからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているシクロアルキル、特に、1若しくは2の(C₁-C₄)アルキルラジカルで置換されているシクロアルキルである。

40

【0089】

置換されていてもよいヘテロシクリルは、好ましくは、置換されていないヘテロシクリルであるか、又は、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコ

50

キシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、ニトロ及びオキソからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているヘテロシクリル、特に、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキル及びオキソからなる群から選択されるラジカルで1置換若しくは多置換されているヘテロシクリル、極めて特に、1若しくは2の(C₁ - C₄) アルキルラジカルで置換されているヘテロシクリルである。

【0090】

アルキルで置換されているヘテロアリールの例は、フラニルメチル、チオフェニルメチル、ピラゾリルメチル、イミダゾリルメチル、1, 2, 3-トリアゾリルメチル、1, 2, 4-トリアゾリルメチル、イソオキサゾリルメチル、チアゾリルメチル、イソチアゾリルメチル、1, 2, 3-オキサジアゾリルメチル、1, 3, 4-オキサジアゾリルメチル、1, 2, 4-オキサジアゾリルメチル、1, 2, 5-オキサジアゾリルメチル、アゼピニルメチル、ピロリルメチル、ピリジニルメチル、ピリダジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピラジニルメチル、1, 3, 5-トリアジニルメチル、1, 2, 4-トリアジニルメチル、1, 2, 3-トリアジニルメチル、1, 2, 4-オキサジニルメチル、1, 3, 2-オキサジニルメチル、1, 3, 6-オキサジニルメチル、1, 2, 6-オキサジニルメチル、オキセピニルメチル、チエピニルメチル及び1, 2, 4-ジアゼピニルメチルである。

【0091】

本発明に従って適切な本発明化合物の塩、例えば、塩基との塩又は酸付加塩は、慣習的な全ての無毒性塩、好ましくは、農業上及び／又は生理学的に許容される塩である。例えば、塩基との塩又は酸付加塩。好ましいのは、無機塩基との塩、例えば、アルカリ金属塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩又はセシウム塩）、アルカリ土類金属塩（例えば、カルシウム塩又はマグネシウム塩）、アンモニウム塩、又は、有機塩基との塩、特に、有機アミンとの塩、例えば、トリエチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩、N, N'-ジベンジルエチレンジアンモニウム塩、ピリジニウム塩、ピコリニウム塩若しくはエタノールアンモニウム塩、無機酸との塩（例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、ジヒドロ硫酸塩、トリヒドロ硫酸塩又はリン酸塩）、有機カルボン酸若しくは有機スルホン酸との塩（例えば、ギ酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩又は4-トルエンスルホン酸塩）である。よく知られているように、*tert*-アミン類（例えば、本発明化合物の一部）は、N-オキシドを形成することができ、このN-オキシドも同様に本発明による塩である。

【0092】

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

【0093】

本発明の化合物は、場合により、種々の多形形態で存在し得るか、又は、種々の多形形態の混合物として存在し得る。純粋な多形と多形混合物の両方が、本発明によって提供され、そして、本発明に従って使用され得る。

【0094】

1つの態様1は、一般式(I)

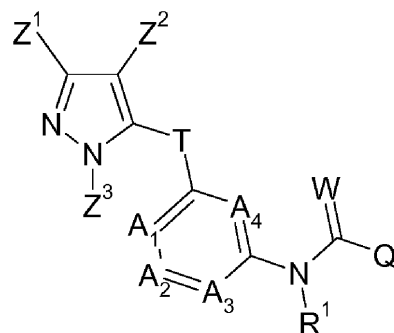
10

20

30

40

【化 15】



(I)

10

【0095】

〔式中、

R^1 は、水素、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、アリール- ($C_1 - C_3$) -アルキル、ヘテロアリール- ($C_1 - C_3$) -アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

20

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよい $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $N - C_1 - C_6$ -アルコキシイミノ- $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $N - C_1 - C_6$ -アルキルアミノ又はN、 $N - ジ - C_1 - C_6$ -アルキルアミノであり；

30

A_2 部分と A_3 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^3 と R^4 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；又は、

A_1 部分と A_2 部分のいずれも窒素ではない場合、 R^2 と R^3 はそれらが結合している炭素原子と一緒に5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる）を形成することができ；

Wは、酸素又は硫黄であり；

40

Qは、水素、アミノであるか、又は、置換されていてもよい下記部分のうちの1つであり：アルキル、アルキルオキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシカルボニル、又は、 N -アルキルアミノ、 N -アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N -ジアルキルアミノ、アルキルスルホニルアミノ部分；又は、

Qは、Vで1～5置換されていてもよいアリール又はVで1～5置換されていてもよいヘテロアリールであり；ここで、

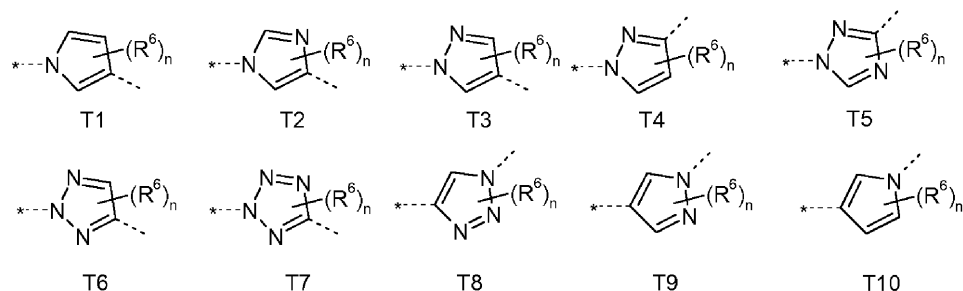
Vは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシ、 N -アルコキシイミノアルキル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、 N 、 N -ジアルキルアミノであり

50

;

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化16】



10

【0096】

ここで、

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

n は、0-2の値を有し；

Z^1 は、置換されていてもよいアルキル又はシクロアルキルであり；及び、

20

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、又は、置換されていてもよいアルキル、アルキルカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルであり；及び、

Z^3 は、水素、又は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール又はヘタリールである]

で表される化合物に関する。

【0097】

1つの態様2は、態様1による化合物に関し、ここで、

R^1 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコシカルボニルで1-7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

30

下記化学的部分は、以下の通りであり：

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

40

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコシカルボニル1-7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ若しくはN、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、アミノであるか、又は、独立してヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン

50

、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルバモイル、シクロアルキルカルバモイル、フェニルで1～7置換されている以下の部分のうちの1つであり： 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_2-C_5 -ヘテロシクリル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ；又は、

10

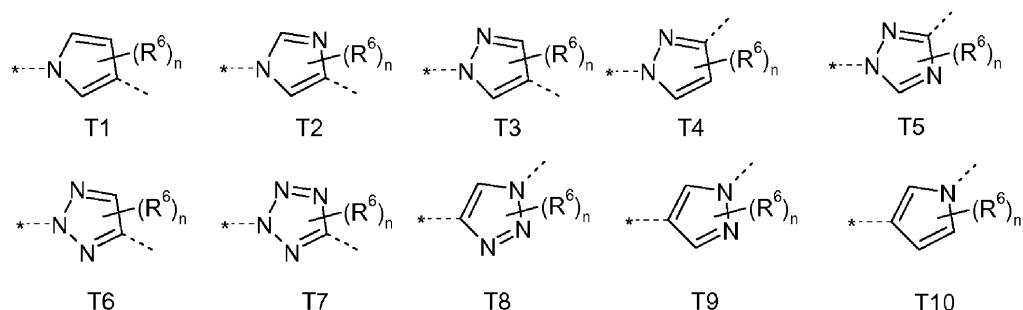
Q は、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 N 、 N -ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

20

【化17】



30

【0098】

ここで、

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

n は、0-1の値を有し；

Z^1 は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニル1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルであり；及び、

40

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されている C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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であり；及び、

Z^3 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -アルキニルであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～5置換されていてもよいアリール又はヘタリールである。

【0099】

50

1つの態様3は、態様1又は態様2による化合物に関し、ここで、

R¹は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロパー2-エニル、2-メチルプロパー2-エニル、プロパー2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロボキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロボキシカルボニル、イソプロボキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー2-イルメチル、ピリダー3-イルメチル、ピリダー4-イルメチル、4-クロロピリダー3-イルメチルであり、最も好ましくは、水素であり；

10

下記化学的部分は、以下の通りであり；

A₁は、CR²又は窒素であり；

A₂は、CR³又は窒素であり；

A₃は、CR⁴又は窒素であり；及び、

A₄は、CR⁵又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分A₁～A₄のうちの3つ以下であり；

R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル及びメトキシであり；及び、

R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロボキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであり；

20

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、n-ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N-メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N-シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー2-エニル、2-メチルプロパー2-エニル、プロパー2-イニル、1, 1-ジメチルブター2-イニル、3-クロロプロパー2-エニル、3, 3-ジクロロプロパー2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロパー2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェ

30

40

50

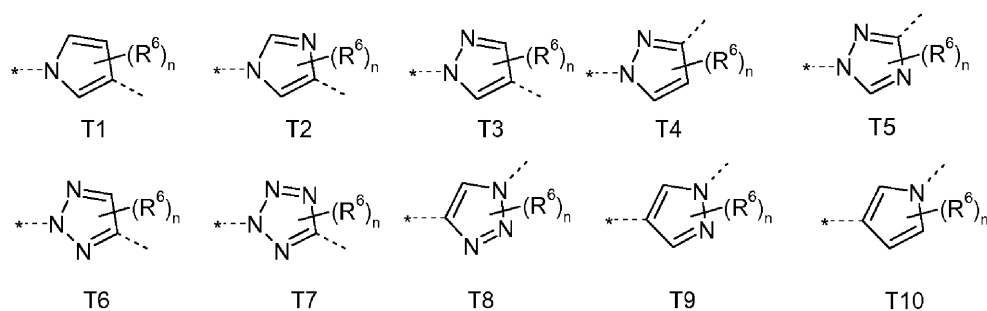
ニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、N-エチルアミノ、N-アリルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり；又は、

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T10のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化18】



【0100】

ここで、

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、1-メチルエチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニルであり；及び、

nは、0-1の値を有し；

Z^1 は、メチル、エチル、1, 1-ジメチルエチル、ジフルオロメチル、クロロジフル

オロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブロモジクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-*t*-ブチル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-*n*-ブチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-ブロモシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、シクロブチル及び2, 2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピルであり；及び、

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、1, 1-ジメチルエチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブロモジクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-*t*-ブチル、ヘプタフルオロ-*n*-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-*n*-ブチル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルチオ、エチルスルフィニル、エチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルファニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ジクロロフルオロメチルスルファニル、ジクロロフルオロメチルスルフィニル、ジクロロフルオロメチルスルホニルであり；及び、

Z^3 は、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-プロピニル、1-ブチニル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3-4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2-6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルである。

【0101】

1つの態様4は、態様1～態様3のいずれかによる化合物に関し、ここで、

Z^1 は、トリフルオロメチル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル又はペンタフルオロエチルであり；

Z^2 は、トリフルオロメチル、ニトロ、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、フッ素、塩素、臭素、シアノ又はヨウ素であり；

Z^3 は、メチル、エチル、*n*-プロピル又は水素であり；

R^1 は、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロボキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、*n*-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、*s*-ブチルカルボニル、*t*-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロボキシカルボニル、イソプロボキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー-2-イルメチル、ピリダー-3-イルメチル、ピリダー-4-イルメチル、4-クロロピリダー-3-イルメチルであり、最も好ましくは、水素であり；

A_1 及び A_2 は、それぞれ、CHであり；

A₃ は、CR⁴ であり；及び、

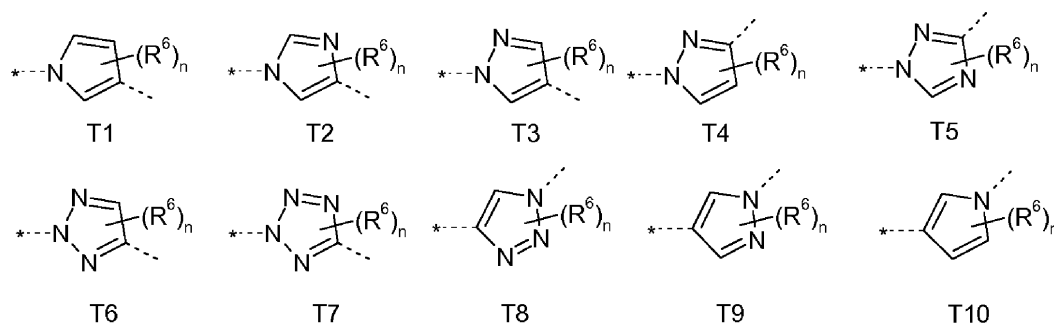
A₄ は、CR⁵ であり；

R⁴ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はシアノであり；

R⁵ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はメトキシであり；

T は、以下に示されている 5 員ヘテロ芳香族系 T1-T10 のうちの 1 つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化 19】



10

【0102】

ここで、

R⁶ は、水素、メチル、エチル、2-メチルエチル、2, 2-ジメチルエチル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノであり；

20

W は、酸素であり；

Q は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、n-ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N-メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N-シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、1, 1-ジメチルブター-2-イニル、3-クロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロパー-2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、NH₂、N-エチルアミノ、N-アリルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり；又は、

30

40

50

Qは、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：
フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである。

10

20

【0103】

1つの態様5は、態様1～態様4のいずれかによる化合物に関し、ここで、

Z¹は、トリフルオロメチル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル又はペンタフルオロエチルであり；

Z²は、トリフルオロメチル、ニトロ、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、フッ素、塩素、臭素、シアノ又はヨウ素であり；

Z³は、メチル、エチル、n-プロピル又は水素であり；

R¹は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロパー2-エニル、2-メチルプロパー2-エニル、プロパー2-イニル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリダー2-イルメチル、ピリダー3-イルメチル、ピリダー4-イルメチル、4-クロロピリダー3-イルメチルであり、最も好ましくは、水素であり；

30

A₁は、CHであり；

A₂は、窒素であり；

A₃は、CR⁴であり；及び、

A₄は、CR⁵であり；

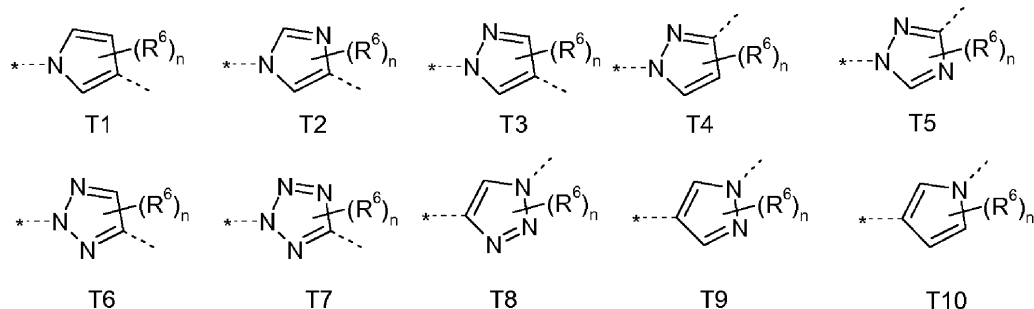
40

R⁴は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はシアノであり；

R⁵は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はメトキシであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T₁～T₁₀のうちの1つであり（ここで、ピラゾリル先端基への結合は星印で示されている）

【化 20】



10

【0104】

ここで、

R^6 は、水素、メチル、エチル、2-メチルエチル、2, 2-ジメチルエチル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノであり；

W は、酸素であり；

Q は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1, 1-ジメチルエチル、1-メチルプロピル、n-ブチル、2-メチルプロピル、2-メチルブチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2-シアノエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-トリフルオロメチルエチル、2, 2-ジフルオロプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2-ジメチル-3-フルオロプロピル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシカルボニルシクロプロピル、1-(N-メチルカルバモイル)シクロプロピル、1-(N-シクロプロピルカルバモイル)シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2-ジメチルシクロプロピルメチル、2-フェニルシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、トランス-2-クロロシクロプロピル、シス-2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、トランス-2-フルオロシクロプロピル、シス-2-フルオロシクロプロピル、トランス-4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロパー-2-エニル、2-メチルプロパー-2-エニル、プロパー-2-イニル、1, 1-ジメチルブター-2-イニル、3-クロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロプロパー-2-エニル、3, 3-ジクロロ-1, 1-ジメチルプロパー-2-エニル、オキセタン-3-イル、チエタン-3-イル、1-オキシドチエタン-3-イル、1, 1-ジオキシドチエタン-3-イル、イソオキサゾール-3-イルメチル、3-メチルオキセタン-3-イルメチル、ベンジル、2, 6-ジフルオロフェニルメチル、3-フルオロフェニルメチル、2-フルオロフェニルメチル、2, 5-ジフルオロフェニルメチル、1-フェニルエチル、4-クロロフェニルエチル、2-トリフルオロメチルフェニルエチル、ピリジン-2-イルエチル、ピリジン-2-イルメチル、5-フルオロピリジン-2-イルメチル、(6-クロロピリジン-3-イル)メチル、ピリミジン-2-イルメチル、メトキシ、2-エトキシエチル、2-(メチルスルファニル)エチル、1-メチル-2-(エチルスルファニル)エチル、2-メチル-1-(メチルスルファニル)プロパン-2-イル、メトキシカルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、N-エチルアミノ、N-アリルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、メチルスルホニルアミノであり；又は、

20

30

40

Q は、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されている以下の基のうちの1つであり：フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル；ここで、

V は、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジ

50

フルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニル、N, N-ジメチルアミノである。

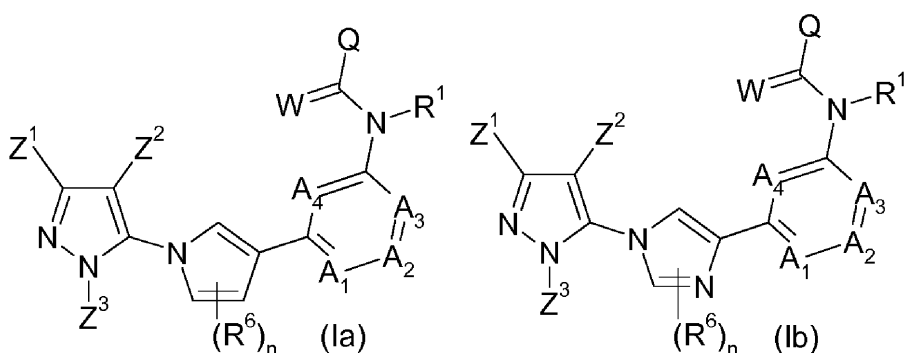
10

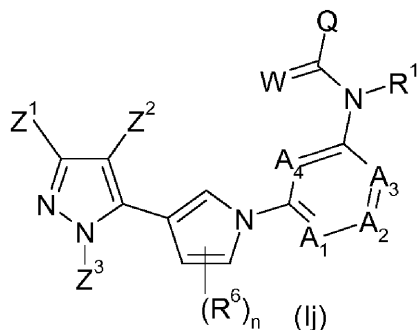
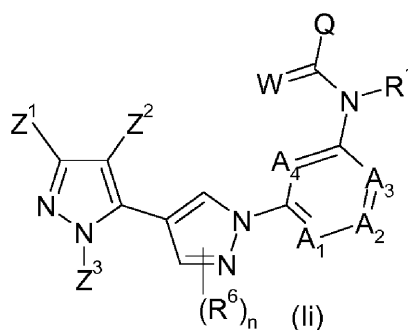
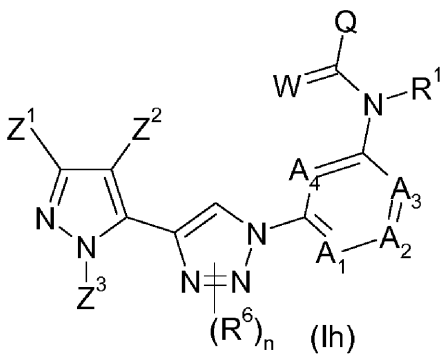
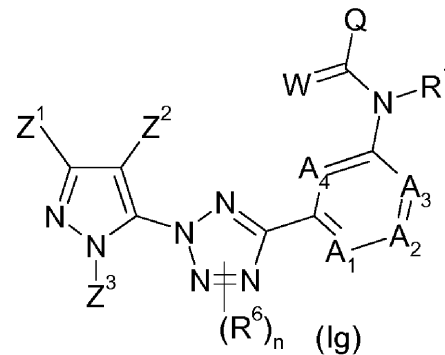
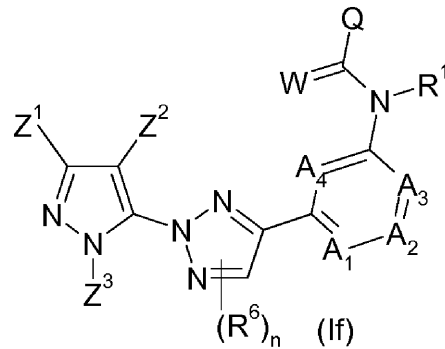
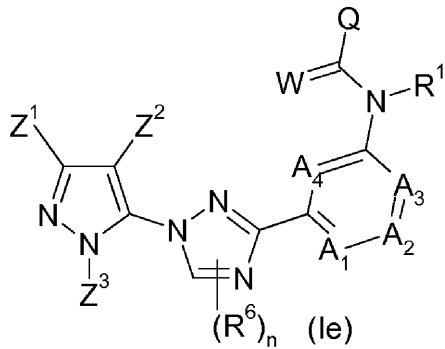
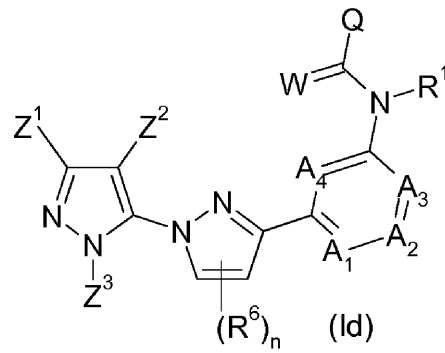
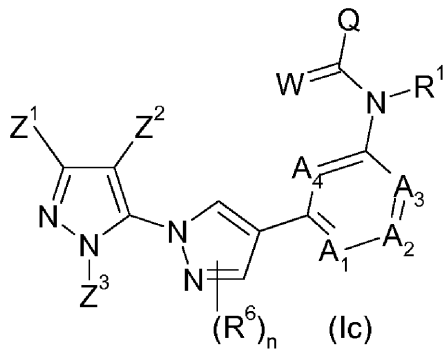
【0105】

1つの態様6は、態様1～態様5のいずれかによる化合物に関し、ここで、一般式(I)で表される化合物は、式(Ia)、式(Ib)、式(Ic)、式(Id)、式(Ie)、式(I f)、式(I g)、式(I h)、式(I i)及び式(I j)

【化21】

20





【0106】

〔式中、 $A_1 - A_4$ 、 n 、 W 、 Q 、 R^1 及び $Z^1 - Z^3$ ラジカルは、それぞれ、態様1～態様6のいずれかで定義されているとおりである〕
 のうちの1つで表される化合物である。

【0107】

1つの態様7は、態様1～態様7のいずれかによる化合物に関し、ここで、式(I)で表される化合物は、一般式(Ic)

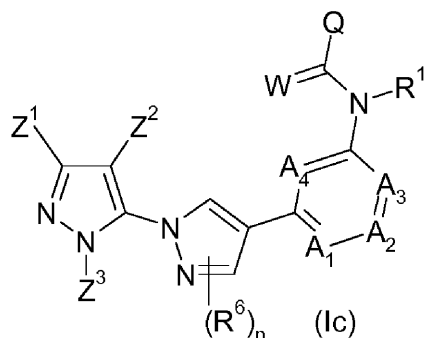
10

20

30

40

【化 2 2】



10

【0108】

〔式中、

Z¹ は、CF₂CF₃ であり；Z² は、CF₃ であり；Z³ は、CH₃ であり；R¹、R⁶ ラジカルは、それぞれ、水素（n = 0）であり；A₁、A₂ は、C-H であり；A₃ は、C-H、C-Cl、C-F であり；A₄ は、C-H、C-F、C-OMe であり；

W は、酸素であり；及び、

20

Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである〕

で表される化合物である。

【0109】

1つの態様8は、態様7による化合物に関し、ここで、

Z¹ は、CF₂CF₃ であり；Z² は、CF₃ であり；Z³ は、CH₃ であり；R¹、R⁶ ラジカルは、それぞれ、水素（n = 0）であり；A₁ は、C-H であり；A₂ は、N であり；A₃ は、C-H、C-Cl、C-F、C-CH₃ であり；A₄ は、C-H、C-F、C-OMe であり；

W は、酸素であり；及び、

30

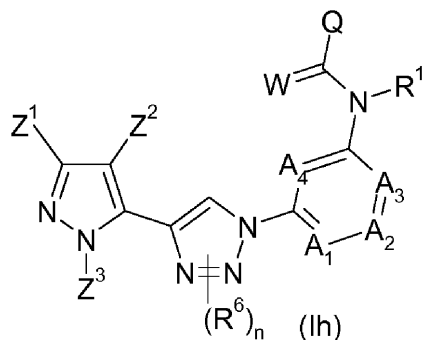
Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである。

40

【0110】

1つの態様9は、一般式（Ih）

【化 2 3】



10

【0111】

〔式中、

Z¹ は、CF₂CF₃ であり；Z² は、CF₃ であり；Z³ は、CH₃ であり；R¹、R⁶ ラジカルは、それぞれ、水素（n = 0）であり；A₁、A₂ は、C-H であり；A₃ は、C-H、C-Cl、C-F であり；A₄ は、C-H、C-F、C-OMe であり；

W は、酸素であり；及び、

20

Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである〕

で表される化合物に関する。

【0112】

1つの態様10は、態様9による化合物に関し、ここで、

30

Z¹ は、CF₂CF₃ であり；Z² は、CF₃ であり；Z³ は、CH₃ であり；R¹、R⁶ ラジカルは、それぞれ、水素（n = 0）であり；A₁ は、C-H であり；A₂ は、N であり；A₃ は、C-H、C-Cl、C-F、C-CH₃ であり；A₄ は、C-H、C-F、C-OMe であり；

W は、酸素であり；及び、

Q は、メチル、エチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、フェニル、4-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-チオフェニル、3-チオフェニル、3-クロロ-3-チオフェニル、1-メチル-4-ピラゾリル、4-ピリジニル、3-クロロ-2-ピリジニル、2-クロロ-4-ピリジニル、3-フルオロ-4-ピリジニル、2, 6-ジクロロ-4-ピリジニルである。

40

【0113】

態様11は、昆虫類、クモ形類動物及び線虫類を防除するための、態様1～態様10のいずれかによる一般式（I）、一般式（Ia）、一般式（Ib）、一般式（Ic）、一般式（Id）、一般式（Ie）、一般式（If）、一般式（Ig）、一般式（Ih）、一般

50

式 (I i) 及び一般式 (I j) で表される化合物の使用に関する。

【0114】

態様12は、態様1～態様10のいずれかによる少なくとも1種類の化合物を含んでいる医薬組成物に関する。

【0115】

態様13は、薬物としての、態様1～態様10のいずれかによる化合物に関する。

【0116】

態様14は、動物における寄生生物を防除するための医薬組成物を製造するための、態様1～態様10のいずれかによる化合物の使用に関する。

【0117】

態様15は、態様1～態様10のいずれかによる化合物並びに慣習的な増量剤及び／又は界面活性剤を含んでいる、作物保護組成物を製造する方法に関する。

【0118】

態様16は、有害生物を防除する方法に関し、ここで、該方法は、態様1～態様10のいずれかによる化合物を有害生物及び／又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする。

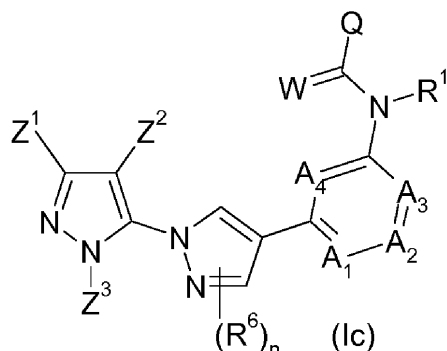
【0119】

態様17は、植物の繁殖器官を保護するための、態様1～態様10のいずれかによる化合物の使用に関する。

【0120】

本発明の特に好ましい実施形態は、態様18において、式 (I c)

【化24】



【0121】

〔式中、

R^1 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_3-C_7 -シクロアルキル- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり、最も好ましくは、水素であり；

下記化学的部分は、以下の通りであり：

A_1 は、 CR^2 又は窒素であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 又は窒素であり；及び、

A_4 は、 CR^5 又は窒素であり；

しかしながら、同時に窒素であることができるのは化学的部分 $A_1 \sim A_4$ のうちの3つ以下であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C

C_6 －アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ －アルコキシイミノ－ C_1-C_3 －アルキル、 C_1-C_6 －アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ －アルキルアミノ若しくは N 、 N －ジ－ C_1-C_6 －アルキルアミノであり；

Wは、酸素又は硫黄であり；

Qは、水素、アミノであるか、又は、独立してヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルバモイル、シクロアルキルカルバモイル、フェニルで1～7置換されている以下の部分のうちの1つであり： 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_2-C_5 －ヘテロシクリル、 C_1-C_4 －アルコキシ、 C_1-C_6 －アルキル－ C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_3-C_6 －シクロアルキル－ C_1-C_6 －アルキル、 C_1-C_6 －ヒドロキシアルキル、アリール（ C_1-C_3 ）－アルキル、ヘテロアリール（ C_1-C_3 ）－アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル、 $N-C_1-C_4$ －アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ －アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N －ジ－ C_1-C_4 －アルキルアミノ、 C_1-C_4 －アルキルスルホニルアミノ；又は、

Qは、水素、アミノであるか、又は、 C_1-C_6 －アルキル、 C_1-C_6 －アルキルオキシ、 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、5員若しくは6員のヘテロシクリル、 C_1-C_6 －アルキル－ C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_3-C_6 －シクロアルキル－ C_1-C_6 －アルキル、 C_6-C_{10} －アリール（ C_1-C_3 ）－アルキル、5員若しくは6員のヘテロアリール（ C_1-C_3 ）－アルキル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル〔ここで、これらは、それぞれ、独立して、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、オキソ、ベンジルオキシ、 C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_1-C_6 －アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、 C_1-C_4 －アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 －アルキルカルバモイル、 C_3-C_6 －シクロアルキルカルバモイル、 N 、 N －ジ－ C_1-C_4 －アルキルアミノ、フェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、 C_1-C_6 －アルコキシ、 C_1-C_6 －ハロアルコキシ及び C_1-C_6 －アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されている）もよい〕、フェニルチオ（ここで、該フェニルチオは、ハロゲン、 C_1-C_6 －アルコキシ、 C_1-C_6 －ハロアルコキシ及び C_1-C_6 －アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されている）もよい〕、5員若しくは6員のヘテロアリール（例えば、ピラゾリル）（ここで、該ヘテロアリールは、ハロゲン、 C_1-C_6 －アルコキシ、 C_1-C_6 －ハロアルコキシ及び C_1-C_6 －アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されている）もよい〕からなる群から選択される1、2、3、4、5、6又は7の置換基で置換されている）もよい〕から選択される部分のうちの1つであり、又は、 $N-C_1-C_4$ －アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ －アルキルカルボニルアミノ、 N 、 N －ジ－ C_1-C_4 －アルキルアミノ、 C_1-C_4 －アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式ヘテロ環又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式炭素環であり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで1～7置換されているもよい C_1-C_6 －アルキル、 C_1-C_6 －ハロアルキル、 C_2-C_4 －アルケニル、 C_2-C_4 －アルキニル、 C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_1-C_6 －アルコキシ、 C_1-C_6 －ハロアルコキシ、 $N-C_1-C_6$ －アルコキシイミノ－ C_1-C_3 －アルキル、 C_1-C_6 －アルキルスルファニル、 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、 N 、 N －ジ－（ C_1-C_6 －アルキル）アミノであり；

10

20

30

40

50

R^6 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、ハロゲンで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルであり；及び、

n は、0 - 1 の値を有し；

Z^1 は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルであり；及び、

Z^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ若しくはアルコキシカルボニルで 1 ～ 7 置換されている $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルファニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルであり；及び、

Z^3 は、水素であるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで 1 ～ 7 置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_4$ - アルケニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニルであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで 1 ～ 5 置換されていてもよいアリール若しくはヘタリールである]

で表される化合物を対象とする。

【0122】

好ましいさらなる実施形態は、態様 19 において、態様 18 による式 (Ic) で表される化合物を対象とし、ここで、 R^6 は、水素又は $C_1 - C_6$ - アルキルであり、及び、 n は、0 又は 1 であり；さらに好ましくは、 R^6 は、水素である。

【0123】

好ましいさらなる実施形態は、態様 20 において、態様 18 又は態様 19 による式 (Ic) で表される化合物を対象とし、ここで、下記化学的部分は、以下の通りである：

A_1 は、 CR^2 であり；

A_2 は、 CR^3 又は窒素であり；

A_3 は、 CR^4 であり；及び、

A_4 は、 CR^5 であり；ここで、

R^2 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ - アルキル（例えば、メチル）及び $C_1 - C_4$ - アルコキシ（例えば、メトキシ）であり、並びに、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルキル（例えば、メチル）、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルであり；さらに好ましくは、 R^2 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素、フッ素、メチル及びメトキシであり、並びに、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、フッ素、塩素、メチルである。

【0124】

好ましいさらなる実施形態は、態様 21 において、態様 18 ～ 態様 21 のいずれかによる式 (Ic) で表される化合物を対象とし、ここで、下記化学的部分は、以下の通りである：

A_1 は、 CR^2 であり；

A_2 は、 CR^3 であり；

A_3 は、 CR^4 であり；及び、

A_4 は、 CR^5 であり；ここで、

R^2 は、水素であり、 R^3 は、水素であり、 R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はエチルであり、及び、 R^5 は、水素、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり；さらに好ましくは、 R^2 は、水素であり、 R^3 は、水素であり、 R^4 は、水素、フッ素、塩素又はメチルであり、及び、 R^5 は、水素又はフッ素である。

【0125】

好ましいさらなる実施形態は、態様 22 において、態様 18 ～ 態様 21 のいずれかによる式 (Ic) で表される化合物を対象とし、ここで、下記化学的部分は、以下の通りであ

る：

A_1 は、 CR^2 であり；

A_2 は、窒素であり；

A_3 は、 CR^4 であり；及び、

A_4 は、 CR^5 であり；ここで、

R^2 は、水素であり、 R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル又はエチルであり、及び、 R^5 は、水素、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり；好ましくは、 R^2 は、水素であり、 R^4 は、水素、フッ素、塩素又はメチル（好ましくは、フッ素、塩素又はメチル）であり、及び、 R^5 は、水素又はフッ素（好ましくは、水素）である。

【0126】

10

好ましいさらなる実施形態は、態様23において、態様18～態様22のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Wは、酸素である。

【0127】

好ましいさらなる実施形態は、態様24において、態様18～態様23のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、

Z^1 は、いずれの場合にも独立してハロゲン若しくはシアノで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル又は C_3-C_6 -シクロアルキルであり；

Z^2 は、いずれの場合にも独立してハロゲン若しくはシアノで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル又は C_3-C_6 -シクロアルキルであり；

Z^3 は、水素又は C_1-C_6 -アルキルであり；

20

さらに好ましくは、ここで、

Z^1 は、いずれの場合にも独立してハロゲン1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルであり；

Z^2 は、いずれの場合にも独立してハロゲン1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルであり；

Z^3 は、 C_1-C_6 -アルキルであり；

一層さらに好ましくは、ここで、

Z^1 は、ペルフルオロ C_1-C_3 -アルキル（例えば、 C_2F_5 ）であり；

Z^2 は、ペルフルオロ C_1-C_3 -アルキル（例えば、 CF_3 ）であり；

Z^3 は、 C_1-C_4 -アルキル（例えば、メチル）である。

30

【0128】

極めて特に好ましい実施形態は、態様25において、態様18～態様24のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、 Z^1 は C_2F_5 であり、 Z^2 は CF_3 であり、及び、 Z^3 はメチルである。

【0129】

好ましいさらなる実施形態は、態様26において、態様18～態様25のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、水素、アミノであるか、又は、独立してヒドロキシル、ニトロ、アミノ、ハロゲン、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルカルバモイル、シクロアルキルカルバモイル、フェニルで1～7置換されていてもよい部分 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_2-C_5 -ヘテロシクリル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、アリール(C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール(C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノのうちの1つであるか、又は、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり、ここで、Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカ

40

50

ルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、N、N-ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノである。

【0130】

さらに好ましいさらなる実施形態は、態様27において、態様18～態様25のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、

Qは、水素、アミノであるか、又は、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルオキシ、 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、5員若しくは6員のヘテロシクリル、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_6-C_{10} -アリール- (C_1-C_3)-アルキル、5員若しくは6員のヘテロアリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル [ここで、これらは、それぞれ、独立して、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、オキソ、ベンジルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3-C_6 -シクロアルキルカルバモイル、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、フェニル (ここで、該フェニルは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、フェニルチオ (ここで、該フェニルチオは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、フェニルオキシ (ここで、該フェニルオキシは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、5員若しくは6員のヘテロアリール (例えば、ピラゾリル又はチオフェニル) (ここで、該ヘテロアリールは、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ及び C_1-C_6 -アルキルからなる置換基の群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい) からなる群から選択される1、2、3、4、5、6又は7の置換基で置換されていてもよい] から選択される部分のうちの1つであり、又は、N- C_1-C_4 -アルキルアミノ、N- C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルアミノ部分であり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されているアリール又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている5員若しくは6員のヘテロアリールであり；又は、

Qは、0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式ヘテロ環又は0、1、2、3若しくは4のV置換基で置換されている二環式炭素環であり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、独立してハロゲン、シアノ、アルコキシ及びアルコキシカルボニルで1～7置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、N- C_1-C_6 -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、N、N-ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノである。

【0131】

好ましいさらなる実施形態は、態様28において、態様18～態様25又は態様27のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

- ・ 水素；
- ・ C_1-C_6 -アルキル [ここで、該アルキルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シ

10

20

30

40

50

アノ、オキソ、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、ベンジルオキシ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フェニルチオ（ここで、該フェニルチオは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、フェニルオキシ（ここで、該フェニルオキシは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、フェニル（ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、ピラゾリル（ここで、該ピラゾリルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、チオフェニル（ここで、該チオフェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]；

・ C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、 C_1-C_4 -アルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、フェニル（ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]；又は、

・ フェニル、ナフチル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ピリジニル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル [ここで、これらは、それぞれ、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されており、その際、Vは、独立して、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである]である。

【0132】

好ましいさらなる実施形態は、態様29において、態様18～態様25又は態様27～態様28のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

・ C_1-C_6 -アルキル [ここで、該アルキルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、オキソ、 C_1-C_4 -アルコキシ、ベンジルオキシ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フェニルチオ、フェニルオキシ、フェニル（ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）、ピラゾリル及びチオフェニル（ここで、該ピラゾリル及びチオフェニルは、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]；

・ C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、 C_1-C_4 -アルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、フェニル（ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素及び C_1-C_4 -アルキルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい]；又は、

・ フェニル、ピリミジニル、ピリジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、フラニル、チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル [ここで、これらは、それぞれ、0、1、2、3又は4のV置換基で置換されており、その際、Vは、独立して、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである]

【0133】

好ましいさらなる実施形態は、態様30において、態様18～態様25又は態様27～態様29のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

・ C_1-C_4 -アルキル [ここで、該アルキルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、オキソ、 C_1-C_4 -アルコキシ、ベンジルオキシ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フェニルチオ、フェニルオキシ、フェニル (ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、ピラゾリル及びチオフェニル (ここで、該ピラゾリル及びチオフェニルは、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい] ;

・ C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、 C_1-C_4 -アルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、フェニル (ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素及び C_1-C_4 -アルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい] ; 又は、

・ フェニル、ピリミジニル、ピリジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、フラニル、チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 3] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル [ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3のV置換基で置換されており、その際、Vは、独立して、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、N、N-ジ- C_1-C_2 -アルキルアミノである]

【0134】

好ましいさらなる実施形態は、態様31において、態様18～態様25又は態様27～態様30のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

・ C_1-C_4 -アルキル [ここで、該アルキルは、フッ素、オキソ、 C_1-C_4 -アルコキシ、ベンジルオキシ、N、N-ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フェニルチオ、フェニルオキシ、フェニル (ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、ピラゾリル及びチオフェニル (ここで、該ピラゾリル及びチオフェニルは、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい] ;

・ C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、 C_1-C_4 -アルコキシ、塩素、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、フェニル (ここで、該フェニルは、塩素及び C_1-C_4 -アルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい] ; 又は、

10

20

30

40

50

・ フェニル、ピリミジニル、ピリジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、フラニル、チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 3] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル [ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3のV置換基で置換されており、その際、Vは、独立して、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、N、N-ジ- C_1-C_2 -アルキルアミノである]

である。

【0135】

好ましいさらなる実施形態は、態様32において、態様18～態様25又は態様27～態様31のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

・ C_1-C_6 -アルキル [ここで、該アルキルは、フッ素、オキソ、メトキシ、エトキシ、ベンジルオキシ、N、N-ジメチルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、フェニルチオ、フェニルオキシ、フェニル (ここで、該フェニルは、フッ素、塩素、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよい)、ピラゾリル及びチオフェニル (ここで、該ピラゾリル及びチオフェニルは、 C_1-C_4 -アルキル及び C_1-C_4 -ハロアルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよい] ;

・ C_3-C_6 -シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、 C_1-C_4 -アルコキシ、塩素、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、フェニル (ここで、該フェニルは、塩素及び C_1-C_2 -アルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい) からなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよい] ; 又は、

・ フェニル、ピリミジニル、ピリジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、フラニル、チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾフラニル、[1, 2, 3] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジニル、1, 3-ベンゾジオキソリル又はテトラリニル [ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3のV置換基で置換されており、その際、Vは、独立して、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロアルコキシ、N、N-ジ- C_1-C_2 -アルキルアミノである]

【0136】

好ましいさらなる実施形態は、態様33において、態様18～態様25又は態様27～態様32のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

・ 独立してフッ素、メチル、シアノ、塩素で1置換又は2置換されていてもよいピリジニル (例えば、4-ピリジニル、3-F-4-ピリジニル、3-Cl-2-ピリジニル、2-Cl-4-ピリジニル、2, 6-Cl₂-4-ピリジニル、2-Cl-3-ピリジニル、2-Cl-6-Me-4-ピリジニル、3-ピリジニル、3-F-5-ピリジニル、2-Me-4-ピリジニル、2-F-4-ピリジニル、2-CN-5-ピリジニル、2-Cl-5-ピリジニル、2-Cl-5-ピリジニル、2-F-5-ピリジニル、2-CN-5-ピリジニル) ;

・ Cl、メトキシ、メチル又はCNで1置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル (例えば、シクロプロピル、1-CN-シクロプロピル、1-Cl-シクロプロピル、4-メトキシシクロヘキサ-1-イル、1-メチルシクロヘキシル、1-メチルシクロプロピル、シクロペンチル) ;

・ 独立してフッ素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ジメチルアミノ、メチル、エチル、プロピルで1置換又は2置換又は3置換されていてもよいフェニル (例えば、フェニル、2-F-フェニル、3-F-フェニル、

10

20

30

40

50

3, 5-F₂-フェニル、2, 6-F₂-フェニル、4-F-フェニル、3-メトキシフェニル、3-CF₃-4-F-フェニル、2, 6-ビスメトキシフェニル、4-(ジメチルアミノ)フェニル、2, 4, 6-トリスイソプロピルフェニル、3-CF₃-フェニル、4-Me-フェニル、2, 3-F₂-フェニル、2-エトキシフェニル、2-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シアノフェニル、2, 3-ジメチルフェニル、4-CN-フェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3-Me, 4-F-フェニル、3-F, 4-Me-フェニル、3-MeO, 4-F-フェニル、3-F, 4-MeO-フェニル、4-Cl, 3-F-フェニル、3-メトキシ-4-Me-フェニル、3-EtO-4-F-フェニル) ;

- ・メトキシ又はエトキシで1置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキル(例えば、CHF₂CF₂-, CF₃CH₂-, メチル、エチル、プロピル、1, 1, 2, 2-テトラメチルエチル、(1, 1-ジメチル)-2-F-エチル、メトキシメチル、1-メチルプロピル、2-メトキシエチル、(R)-1-F-エチル、2-Me-プロパー1-イル、ブチル、2, 2-ジメチルプロパー1-イル、1, 1-ジメチル-2-エトキシエチル) ;

- ・独立してメチル、エチル、プロピル、ブチル、ニトロで1置換又は2置換又は3置換されていてもよいピラゾリル(例えば、1-メチル-4-ピラゾリル、1-メチル-3-tBu-4-NO₂-ピラゾリル) ;

- ・チアゾリル(例えば、1-チアゾリル) ;

- ・塩素で1置換されていてもよいチオフェニル(例えば、3-チオフェニル、2-チオフェニル、3-Cl-2-チオフェニル) ;

- ・ピリミジニル(例えば、ピリミジン-3-イル、ピリミジン-2-イル) ;

- ・独立してハロメチル、メチルで1置換又は2置換されていてもよい[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-イル(例えば、7-(ジフルオロメチル)-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-イル) ;

- ・独立して塩素、メチルで1置換又は2置換されていてもよいベンゾチオフェン(例えば、3-Cl-ベンゾチオフェン-2-イル、3-Cl-6-Me-ベンゾチオフェン-2-イル) ;

- ・独立してメチル、トリフルオロメチルで1置換又は2置換されていてもよいフラニル(例えば、3-Me-2-ベンゾフラニル、2-CF₃-4-Me-フラン-2-イル、2-Me-3-フラニル) ;

- ・メチル、トリフルオロメチルで1置換又は2置換されていてもよいチオフェニル(例えば、5-Me-チオフェン-2-イル) ;

- ・メチルで1置換されていてもよいイソオキサゾリル(例えば、5-メチルイソオキサゾール-4-イル) ;

- ・フッ素で1置換又は2置換されていてもよい1, 3-ベンゾジオキサソリル(例えば、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-イル又は1, 3-ベンゾジオキサソール-5-イル)

である。

【0137】

さらなる実施形態は、態様34において、態様18～態様25又は態様27～態様32のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、フェニルチオメチル、1-フェニルエチル、フェニルシクロペンチルメチル、ベンジルオキシメチル、フェノキシエチル、1-Me, 1-(3-Cl-Ph)-エチル、1-(4-Cl-Ph)-2-Me-プロパー1-イル、3-F-ベンジル、3-CF₃-ベンジル、3-CF₃-4-Me-ピラゾール-1-イルメチル、rac-1-フェノキシエチル、1-フェニルプロパー1-イル、2-フェニルエチル、2-Cl-4-F-ベンジル又はテトラリニル、

1-(4-Me-Ph)-シクロヘキサ-1-イル、1-Ph-シクロプロパー1-イル、1-(4-Cl-Ph)-シクロブタ-1-イル、1-(4-Cl-Ph)-シクロペ

10

20

30

40

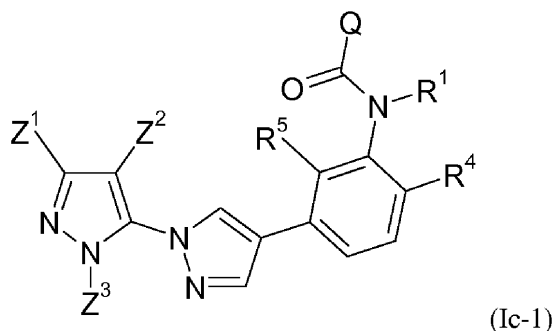
50

ンター１－イル、２－チオフェニルメチル、 $(Me)_2NC(O)C(O)-$ である。

【０１３８】

好ましいさらなる実施形態は、態様３５において、態様１８～態様３４のいずれかによる式（Ｉｃ）で表される化合物を対象とし、ここで、該化合物は、式（Ｉｃ－１）

【化２５】



10

【０１３９】

で表される化合物である。

【０１４０】

式（Ｉｃ－１）で表される本発明化合物は、一般式（Ｉｃ）〔式中、 $W=O$ 、 $A_1=A_2=CH$ 、 $A_3=CR^4$ 、 $A_4=CR^5$ 、及び、 $R^6=H$ （即ち、 $n=0$ ）〕で表される化合物である。

20

【０１４１】

好ましいさらなる実施形態は、態様３６において、態様３５による式（Ｉｃ－１）で表される化合物を対象とし、ここで、 Q は、

- ・ 独立してフッ素、メチル、シアノ、塩素で１置換又は２置換されていてもよいピリジニル（例えば、４－ピリジニル、３－ F －４－ピリジニル、３－ Cl －２－ピリジニル、２－ Cl －４－ピリジニル、２，６－ Cl_2 －４－ピリジニル、２－ Cl －３－ピリジニル、２－ Cl －６－ Me －４－ピリジニル、３－ピリジニル、３－ F －５－ピリジニル、２－ Me －４－ピリジニル、２－ F －４－ピリジニル、２－ CN －５－ピリジニル、２－ Cl －５－ピリジニル、２－ F －５－ピリジニル、２－ CN －５－ピリジニル）；

30

- ・ C_1 、メトキシ、メチル又は CN で１置換されていてもよい C_3-C_6 －シクロアルキル（例えば、シクロプロピル、１－ CN －シクロプロピル、１－ Cl －シクロプロピル、４－メトキシシクロヘキサ－１－イル、１－メチルシクロヘキシル、１－メチルシクロプロピル、シクロペンチル）；

- ・ 独立してフッ素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ジメチルアミノ、メチル、エチル、プロピルで１置換又は２置換又は３置換されていてもよいフェニル（例えば、フェニル、２－ F －フェニル、３－ F －フェニル、３，５－ F_2 －フェニル、２，６－ F_2 －フェニル、４－ F －フェニル、３－メトキシフェニル、３－ CF_3 －４－ F －フェニル、２，６－ビスメトキシフェニル、４－（ジメチルアミノ）フェニル、２，４，６－トリスイソプロピルフェニル、３－ CF_3 －フェニル、４－ Me －フェニル、２，３－ F_2 －フェニル、２－エトキシフェニル、２－（トリフルオロメトキシ）フェニル、３－シアノフェニル、２，３－ジメチルフェニル、４－ CN －フェニル、３，４－ジメチルフェニル、３－ Me ，４－ F －フェニル、３－ F ，４－ Me －フェニル、３－ MeO ，４－ F －フェニル、３－ F ，４－ MeO －フェニル、４－ Cl ，３－ F －フェニル、３－メトキシ－４－ Me －フェニル、３－ EtO －４－ F －フェニル）；

40

- ・ メトキシ又はエトキシで１置換されていてもよい C_1-C_6 －アルキル又は C_1-C_6 －ハロアルキル（例えば、 CHF_2CF_2- 、 CF_3CH_2- 、メチル、エチル、プロピル、１，１，２，２－テトラメチルエチル、（１，１－ジメチル）－２－ F －エチル

50

、メトキシメチル、1-メチルプロピル、2-メトキシエチル、(R)-1-F-エチル、2-Me-プロパー1-イル、ブチル、2, 2-ジメチルプロパー1-イル、1, 1-ジメチル-2-エトキシエチル)；

・ 独立してメチル、エチル、プロピル、ブチル、ニトロで1置換又は2置換又は3置換されていてもよいピラゾリル(例えば、1-メチル-4-ピラゾリル、1-メチル-3-t Bu-4-NO₂-ピラゾリル)；

・ チアゾリル(例えば、1-チアゾリル)；

・ 塩素で1置換されていてもよいチオフェニル(例えば、3-チオフェニル、2-チオフェニル、3-Cl-2-チオフェニル)；

・ ピリミジニル(例えば、ピリミジン-3-イル、ピリミジン-2-イル)；

・ 独立してハロメチル、メチルで1置換又は2置換されていてもよい[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-イル(例えば、7-(ジフルオロメチル)-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-2-イル)；

・ 独立して塩素、メチルで1置換又は2置換されていてもよいベンゾチオフェニル(例えば、3-Cl-ベンゾチオフェン-2-イル、3-Cl-6-Me-ベンゾチオフェン-2-イル)；

・ 独立してメチル、トリフルオロメチルで1置換又は2置換されていてもよいフラニル(例えば、3-Me-2-ベンゾフラニル、2-CF₃-4-Me-フラン-2-イル、2-Me-3-フラニル)；

・ メチル、トリフルオロメチルで1置換又は2置換されていてもよいチオフェニル(例えば、5-Me-チオフェン-2-イル)；

・ メチルで1置換されていてもよいイソオキサゾリル(例えば、5-メチルイソオキサゾール-4-イル)；

・ フッ素で1置換又は2置換されていてもよい1, 3-ベンゾジオキサソリル(例えば、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-イル又は1, 3-ベンゾジオキサソール-5-イル)

である。

【0142】

好ましいさらなる実施形態は、態様37において、態様35による式(Ic-1)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、

フェニルチオメチル、1-フェニルエチル、フェニルシクロペンチルメチル、ベンジルオキシメチル、フェノキシエチル、1-Me, 1-(3-Cl-Ph)-エチル、1-(4-Cl-Ph)-2-Me-プロパー1-イル、3-F-ベンジル、3-CF₃-ベンジル、3-CF₃-4-Me-ピラゾール-1-イルメチル、rac-1-フェノキシエチル、1-フェニルプロパー1-イル、2-フェニルエチル、2-Cl-4-F-ベンジル又はテトラリニル、

1-(4-Me-Ph)-シクロヘキサ-1-イル、1-Ph-シクロプロパー1-イル、1-(4-Cl-Ph)-シクロブタ-1-イル、1-(4-Cl-Ph)-シクロペンタ-1-イル、2-チオフェニルメチル、(Me)₂NC(O)C(O)-

である。

【0143】

好ましいさらなる実施形態は、態様38において、態様35による式(Ic-1)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、態様36及び態様37において特定されているラジカルである。

【0144】

好ましいさらなる実施形態は、態様39において、態様35による式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、4-F-フェニル、3-MeO-4-F-フェニル、3-Cl-2-ピリジニル、2-CN-5-ピリジニル、4-ピリジニルである。

【0145】

好ましいさらなる実施形態は、態様40において、態様35による式(Ic-1)で表

10

20

30

40

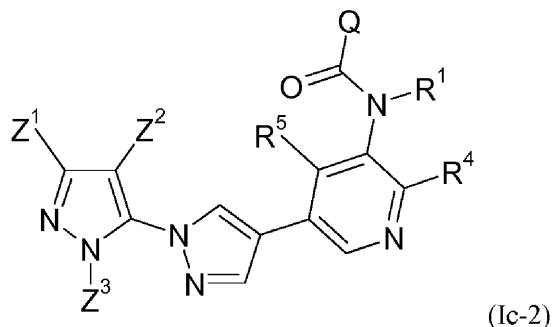
50

される化合物を対象とし、ここで、Qは、態様36、態様37及び態様38において特定されているラジカルである。

【0146】

好ましいさらなる実施形態は、態様41において、態様18～態様34のいずれかによる式(Ic)で表される化合物を対象とし、ここで、該化合物は、式(Ic-2)

【化26】



10

【0147】

で表される化合物である。

【0148】

式(Ic-2)で表される本発明化合物は、一般式(Ic)〔式中、W=O、A₁=CH、A₂=N、A₃=CR⁴、A₄=CR⁵、及び、R⁶=H(即ち、n=0)〕で表される化合物である。

20

【0149】

好ましいさらなる実施形態は、態様41による式(Ic-2)で表される化合物を対象とし、ここで、Qは、4-F-フェニル、3-MeO、4-F-フェニル、3-Cl-2-ピリジニル、2-CN-5-ピリジニル、4-ピリジニルである。

【0150】

使用：

本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、一般式(I)で表される本発明化合物を害虫及び／又はそれらの生息環境に作用させる。一般式(I)で表される本発明化合物は、例えば、有害な吸血性昆虫、刺咬性昆虫及び別の害虫(これは、植物寄生虫、貯穀害虫、工業材料を破壊する害虫及び動物衛生の分野における寄生虫を包含する衛生害虫である)を包含する、多くの種類の異なった害虫を防除するために使用される。

30

【0151】

作物保護

式(I)で表される本発明化合物は、植物との良好な適合性を示し、及び、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水耕法において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、作物保護組成物として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げることができる：

40

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクトプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranys)

50

chus viennensis)、アルガス属種 (*Argas spp.*)、ボオフィルス属種 (*Boophilus spp.*)、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus spp.*)、ブリオビア・グラミナム (*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオサ (*Bryobia praetiosa*)、セントロロイデス属種 (*Centruroides spp.*)、コリオプテス属種 (*Chorioptes spp.*)、デルマニسس・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、デルマトファゴイデス・ファリナエ (*Dermatophagoides farinae*)、デルマセントロ属種 (*Dermacentor spp.*)、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus spp.*)、エピトリメルス・ピリ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種 (*Eutetranychus spp.*)、エリオフィエス属種 (*Eriophyes spp.*)、グリシファグス・ドメスチクス (*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタロソネムス属種 (*Hemitarsonemus spp.*)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma spp.*)、イキソデス属種 (*Ixodes spp.*)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus spp.*)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles spp.*)、メタテトラニクス属種 (*Metatetranychus spp.*)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa spp.*)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus spp.*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros spp.*)、オルニトニسس属種 (*Ornithonyssus spp.*)、パノニクス属種 (*Panonychus spp.*)、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes spp.*)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus spp.*)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus spp.*)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes spp.*)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus spp.*)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus spp.*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus spp.*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis spp.*)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

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

トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*) ;

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

昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属種 (*Panchlora spp.*)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta spp.*)、スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acal*

ymma vittatum)、アカントセリデス・オブテクトゥス (Acanthoscelides obtectus)、アドレッツス属種 (Adoretus spp.)、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni)、アグリオテス属種 (Agriotes spp.)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (Alphitobius diaperinus)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (Amphimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、アノプロホラ属種 (Anoplophora spp.)、アントノムス属種 (Anthonomus spp.)、アントレヌス属種 (Anthrenus spp.)、アピオン属種 (Apion spp.)、アポゴニア属種 (Apogonia spp.)、アトマリア属種 (Atomaria spp.)、アタゲヌス属種 (Attagenus spp.)、バリス・カエルレセンス (Baris caerulescens)、ブルキジウス・オブテクトゥス (Bruchidius obtectus)、ブルクス属種 (Bruchus spp.)、カッシダ属種 (Cassida spp.)、セロトマ・トリフルカタ (Cerotoma trifurcata)、セウトリンクス属種 (Ceutorrhynchus spp.)、カエトクネマ属種 (Chaetocnema spp.)、クレオヌス・メンジクス (Cleonus mendicus)、コノデルス属種 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属種 (Cosmopolites spp.)、コステリトラ・ゼアランジカ (Costelytra zealandica)、クテニセラ属種 (Ctenicera spp.)、クルクリオ属種 (Curculio spp.)、クリプトレストス・フェルギネウス (Cryptolestes ferrugineus)、クリプトリンクス・ラパチ (Cryptorhynchus lapathi)、シリンドロコプツルス属種 (Cylindrocopturus spp.)、デルメステス属種 (Dermestes spp.)、ジアブロチカ属種 (Diabrotica spp.)、ジコクロシス属種 (Dichocrocis spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (Dycladispa armigera)、ジロボデルス属種 (Diloboderus spp.)、エピラクナ属種 (Epilachna spp.)、エピトリキス属種 (Epitrix spp.)、ファウスチヌス属種 (Faustinus spp.)、ギビウム・プシロイデス (Gibbium psylloides)、グナトセルス・コルヌツス (Gnathocerus cornutus)、ヘルラ・ウンダリス (Hellula undalis)、ヘテロニクス・アラトル (Heteronychus arator)、ヘテロニクス属種 (Heteronyx spp.)、ヒラモルファ・エレガンズ (Hylamorpha elegans)、ヒロトルペス・バジュルス (Hylotrupes bajulus)、ヒペラ・ポスチカ (Hypera postica)、ヒポメセス・スクアモス (Hypomeces squamosus)、ヒポテネムス属種 (Hypotenemus spp.)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (Lachnosterna consanguinea)、ラシドデルマ・セリコルネ (Lasioderma serricorne)、ラテチクス・オリザエ (Latheticus oryzae)、ラトリジウス属種 (Lathridius spp.)、レマ属種 (Lema spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (Leptinotarsa decemlineata)、レウコプテラ属種 (Leucoptera spp.)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (Lissorhopterus oryzophilus)、リキス属種 (Lixus spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (Luperomorpha xanthodera)、ルペロデス属種 (Luperodes spp.)、リクツス属種 (Lyctus spp.)、メガセリス属種 (Megascelis spp.)、メラノツス属種 (Melanotus spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、メロロンタ属種 (Melolontha spp.)、ミグドルス属種 (Migdolus spp.)、モノカムス属種 (Monochamus spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス (Naupactus xanthographus)、ネクロビア属種 (Necrobia spp.)、ニ

10

20

30

40

50

プツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorrhynchus* spp.)、オキシセトニア・ジュンクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta* spp.)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes* spp.)、プチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes* spp.)、タニメクス属種 (*Tanymecus* spp.)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebriooides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium* spp.)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、チキウス属種 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、アグロミザ属種 (*Agromyza* spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、アスホンジア属種 (*Asphondylia* spp.)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera* spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus* spp.)、クリソミイア属種 (*Chrysomyia* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、コクリオミイア属種 (*Cochliomyia* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、デリア属種 (*Delia* spp.)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、ハEMATOPOTA属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia gri*

seola)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒッポドスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミイア属種 (*Pegomyia* spp.)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilal casei*)、プロジプロシス属種 (*Prodiptosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、；

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp.)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオペルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリス属種 (*Leptocoris* spp.)、レプトコリス・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、；

ヨコバイ亜目 (*Homoptera*) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシ

ルトシボン属種 (*Acyrthosipon* spp.)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes prolella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Onidiella* spp.)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Cocomytillus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムボアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striate*

illus)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macrosteles fascifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanidis*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネホテツチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、ネッチゴニクラ・スペクトラ (*Nettigoniclla spectra*)、ニラバルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミヌム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspis articulatus*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetragonosephala* spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomaspis* spp.)、トキシプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Trialearodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Triozas* spp.)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ;

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、アクロミルメキス属種 (Acromyrmex spp.)、アタリア属種 (Athalia spp.)、アッタ属種 (Atta spp.)、ジプリオン属種 (Diprion spp.)、ホプロカムパ属種 (Hopllocampa spp.)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、シレキス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta)、タピノマ属種 (Tapinoma spp.)、ウロセルス属種 (Urocerus spp.)、ベスパ属種 (Vespa spp.)、キシリス属種 (Xeris spp.) ;

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

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、コプトテルメス属種 (Coptotermes spp.)、コルニテルメス・クムランス (Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属種 (Cryptotermes spp.)、インシテルメス属種 (Incisitermes spp.)、マイクロテルメス・オベシ (Microtermes obesi)、オドントテルメス属種 (Odontotermes spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.) ;

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロイア・グリセラ (Achroia grisella)、アクロニクタ・マジョル (Acronicta major)、アドキソフィエス属種 (Adoxophyes spp.)、アエジア・レウコメラス (Aedia leucomelas)、アグロチス属種 (Agrotis spp.)、アラバマ属種 (Alabama spp.)、アミエロイス・トランシテラ (Amyelois transitella)、アナルシア属種 (Anarsia spp.)、アンチカルシア属種 (Anticarsia spp.)、アルギロプロセ属種 (Argyroprose spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassicae)、ボルボ・シンナラ (Borbo cinnara)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、ブッセオラ属種 (Busseola spp.)、カコエシア属種 (Cacoecia spp.)、カロプチリア・テイボラ (Caloptilia theivora)、カプア・レチクラナ (Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ (Carpocapsa pomonella)、カルポシナ・ニポネンシス (Carposina niponensis)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatomia brumata)、キロ属種 (Chilo spp.)、コリストネウラ属種 (Choristoneura spp.)、クリシア・アムビグエラ (Clysia ambiguella)、クナファロセルス属種 (Cnaphalocerus spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (Cnaphalocrocis medinalis)、クネファシア属種 (Cnephasia spp.)、コノボモルファ属種 (Conopomorpha spp.)、コノトラケルス属種 (Conotrachelus spp.)、コピタルシア属種 (Copitarsia spp.)、シジア属種 (Cydia spp.)、ダラカ・ノクツイデス (Dalaca noctuides)、ジアファニア属種 (Diaphania spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (Diatraea saccharalis)、エアリアス属種 (Earias spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (Ecdytolopha aurantium)、エラスモバルプス・リグノセルス (Elasmopalpus lignosellus)、エルダナ・サッカリナ (Eldana saccharina)、エフェスチア属種 (Ephesia spp.)、エピノチア属種 (Epinotia spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (Epiphas postvittana)、エチエラ属種 (Etiella spp.)、エウリア属種 (Eulia spp.)、エウボエシリア・アムビグエラ (Eupoec

10

20

30

40

50

illia ambiguelia)、エウプロクチス属種 (Euproctis spp.
 .)、エウキソア属種 (Euxoa spp.)、フェルチア属種 (Feltia sp.
 p.)、ガレリア・メロネラ (Galleria mellonella)、グラシラリ
 ア属種 (Gracillaria spp.)、グラホリタ属種 (Grapholitha
 spp.)、ヘジレプタ属種 (Hedylepta spp.)、ヘリコベルパ属種
 (Helicoverpa spp.)、ヘリオチス属種 (Heliothis spp.
 .)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (Hofmannophila pseu
 dospretella)、ホモエオソマ属種 (Homoeosoma spp.)、ホ
 モナ属種 (Homona spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (Hyponomeuta
 padella)、カキボリア・フラボファシアタ (Kakivoria flavo
 fasciata)、ラフィグマ属種 (Laphygma spp.)、ラスペイレシア
 ・モレスタ (Laspeyresia molesta)、レウシノデス・オルボナリス
 (Leucinodes orbonalis)、レウコプテラ属種 (Leucopte
 ra spp.)、リトコレチス属種 (Lithocolletis spp.)、リト
 ファネ・アンテナタ (Lithophane antennata)、ロベシア属種 (Lobesia
 spp.)、ロキサグロチス・アルビコスタ (Loxagrotis
 albicosta)、リマントリア属種 (Lymantria spp.)、リオネチ
 ア属種 (Lyonetia spp.)、マラコソマ・ネウストリア (Malacosoma
 neustria)、マルカ・テスツラリス (Maruca testulalis)、
 マムストラ・ブラシカエ (Mamstra brassicae)、メラニチス・
 レダ (Melanitis leda)、モシス属種 (Mocis spp.)、モノピ
 ス・オブビエラ (Monopis obviella)、ミチムナ・セパラタ (Myth
 imna separata)、ネマポゴン・クロアセルス (Nemapogon clo
 acellus)、ニムフラ属種 (Nymphula spp.)、オイケチクス属種
 (Oiketis spp.)、オリア属種 (Oria spp.)、オルタガ属種
 (Orthaga spp.)、オストリニア属種 (Ostrinia spp.)、オ
 ウレマ・オリザエ (Oulema oryzae)、パノリス・フランメア (Panoli
 s flammea)、パルナラ属種 (Parnara spp.)、ペクチノホラ属
 種 (Pectinophora spp.)、ペリレウコプテラ属種 (Perileuc
 optera spp.)、フトリマエア属種 (Phthorimaea spp.)、
 フィロクニスチス・シトレラ (Phyllocnistis citrella)、フィ
 ロノリクテル属種 (Phyllonorycter spp.)、ピエリス属種 (Pie
 ris spp.)、ブラチノタ・スツルタナ (Platynota stultana)
)、プロジア・インテルプンクテラ (Plodia interpunctella)、
 プルシア属種 (Plusia spp.)、プルテラ・キシロステラ (Plutella
 xylostella)、プライス属種 (Prays spp.)、プロデニア属種 (Prodenia
 spp.)、プロトパルセ属種 (Protoparce spp.)、
 プセウダレチア属種 (Pseudaletia spp.)、プセウダレチア・ウニ
 プンクタ (Pseudaletia unipuncta)、プセウドプルシア・インクル
 デンス (Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ヌビラリス (Pyrausta
 nubilalis)、ラキプルシア・ヌ (Rachiplusia
 nu)、スコエノビウス属種 (Schoenobius spp.)、シルポファガ属
 種 (Scirpophaga spp.)、シルポファガ・インノタタ (Scirpop
 haga innotata)、スコチア・セゲツム (Scotia segetum)
 、セサミア属種 (Sesamia spp.)、セサミア・インフェレンス (Sesam
 ia inferens)、スパルガノチス属種 (Sparganothis spp.
 .)、スポドプテラ属種 (Spodoptera spp.)、スポドプテラ・ブラエフィ
 カ (Spodoptera praefica)、スタトモボダ属種 (Stathmop
 oda spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (Stomopteryx su
 bsecivella)、シナンテドン属種 (Synanthedon spp.)、テ

シア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzellae*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp.)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinea* spp.)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp.)、フィロエラ・バスタトリキス (*Phylloera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phtirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.) ;

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

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオプシス (*Xenopsylla cheopsis*) ;

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニオトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.) ;

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

コムカデ綱 (*Symphyla*) の、例えば、スクチゲレラ属種 (*Scutigerebella* spp.) ;

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

マキガイ綱 (*Gastropoda*) の、例えば、アリオン属種 (*Arion* spp.)、ビオムファラリア属種 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属種 (

10

20

30

40

50

Bulinus spp.)、デロセラス属種 (Deroceras spp.)、ガルバ属種 (Galba spp.)、リムナエ属種 (Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種 (Oncomelania spp.)、ポマセア属種 (Pomacea spp.)、スクシネア属種 (Succinea spp.)。

【0152】

製剤

本発明は、さらに、本発明の活性成分のうちの少なくとも1種類を含んでいる、作物保護組成物及び／又は殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる作物保護組成物、及び／又は、殺有害生物剤、及び／又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油（例えば、ナタネ油、ヒマワリ油）、鉱油（例えば、パラフィン油）、植物性脂肪酸のアルキルエステル（例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル）、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び／又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び／又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩（例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム）、及び／又は、保持促進剤 (retention promoter)（例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアールポリマー）、及び／又は、湿潤剤（例えば、グリセロール）、及び／又は、肥料（例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料）を含有する。

【0153】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、カプセル製剤 (capsule concentrates) (CS)； これらの製剤型及び別の製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173 (作製元：FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、適切な場合には、本発明による1種類以上の活性成分に加えて、さらなる農薬活性成分を含有する。

【0154】

好ましいのは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤 (spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (frost protection agent)、殺生物剤、増粘剤及び／又は他の補助剤（例えば、アジュバント）など〕を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的活性を向上させる成分であって、その成分自体は生物学的活性を有さない。アジュバントの例は、葉の表面への拡張特性 (spreading characteristics)、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

【0155】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、当該活性成分を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び／若しくは固体担体、並びに／又は、さらなる補助剤、例えば、界面活性剤）と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0156】

使用する補助剤は、当該活性成分の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態（例えば、即時使用可能な (ready-to-use) 作物保護組成物、例えば、散布液又は種子粉衣製品）に、特定の特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び／又は生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

【0157】

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

10

【0158】

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

20

【0159】

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

【0160】

原則として、適切な任意の担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、天然岩粉、例えば、カオリン、アルミナ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、合成岩粉、例えば、微粉化シリカ、酸化アルミニウム、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び／又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

30

40

【0161】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適しているのは、標準温度及び標準圧力下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアロゾル噴射剤、例えば、ハロ炭化水素類、又は、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0162】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと

50

置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。該活性成分のうちの１種類及び／又は該不活性担体のうちの１種類が水不溶性であり且つそれらが水に含まれて施用される場合は、界面活性物質を存在させることが有利である。

10

【0163】

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

【0164】

さらに、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤も存在させることができる。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

20

【0165】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末タイプ又は粒子タイプ又はラテックスタイプの天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニル、及び、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【0166】

適切な場合には、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤は、例えば、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤などである。一般的に、該活性成分は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

30

【0167】

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

【0168】

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

40

50

とができる。

【0169】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%～98重量%の活性成分、又は、さらに好ましくは、0.01重量%～95重量%の活性成分を含んでおり、さらに好ましくは、0.5重量%～90重量%の活性成分を含んでいる。

【0170】

該製剤から調製された使用形態（作物保護組成物）の活性成分含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態に関する活性成分の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、典型的には、0.00000001重量%～95重量%の活性成分、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の活性成分であり得る。施用は、その使用形態に適した方法で行う。

10

【0171】

混合物

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

20

【0172】

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

30

【0173】

本発明の特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、製剤の形態又はそのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物（好ましくは、以下に記載されている化合物）と混合された状態で存在している。

【0174】

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

40

【0175】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤との混合物

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

【0176】

50

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、

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

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

(2) GABA制御塩化物チャネル拮抗薬、例えば、

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

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

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、dーシースートランスアレスリン、dートランスアレスリン、ビフェントリン、ビオアレスリン、ビオアレスリン sーシクロペンテニル異性体、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファーシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シフェノトリン[(1R)ートランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン[(EZ)ー(1R)異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロバトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウーフルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン[(1R)ートランス異性体]、プラレトリン、ピレトリン類(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン[(1R)異性体]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

DDT；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)作動薬、例えば、

ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、

スルホキサフロル、又は、フルピラジフロル；

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)のアロステリック活性化薬、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

(6) 塩化物チャネル活性化薬、例えば、

10

20

30

40

50

アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレレン、キノプレレン、及び、メトプレレン；又は、

フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

(8) 作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフルル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、

ピメトロジン；又は、フロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、エトキサゾール；

(11) 昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、BT植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34／35Ab1；

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、

ジアフェンチウロン；又は、

有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、

プロパルギット；又は、テトラジホン；

(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化デカップラー、例えば、

クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルラミド；

(14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、

ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップーナトリウム；

(15) キチン生合成阻害薬（タイプ0）、例えば、

ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；

(16) キチン生合成阻害薬（タイプ1）、例えば、

ブプロフェジン；

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

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、

クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、

アミトラズ；

(20) 複合体III電子伝達阻害薬、例えば、

ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

(21) 複合体I電子伝達阻害薬、例えば、

MET I 殺ダニ剤の群の、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、
ロテノン (Derri s) ；

(22) 電位制御ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、
インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

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

(24) 複合体I V電子伝達阻害薬、例えば、
ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、
リン化亜鉛；又は、
シアン化物；

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

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

作用機序が知られていないか又は不明瞭であるさらなる活性成分、例えば、アフィドピロベン、アフォキシレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石 (cryolite)、
シクラニリプロール、シクロキサプリド (cycloxadri d)、シアロジアミド (cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、
ジコホル、ジフロピダジン、フロメトキン、フルエンシルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン (fluhexafon)、
フルオピラム、フルララネル、フフェノジド (fufenozide)、グアジピル (guadipy r)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イブロジオン、メペルフルトリン、パイコングディング (paichongding)、ピフルブミド、ピリダリル、
ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール (tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフェン、トリフルメゾピリム、及び
、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づく調製物 (I-1582, BioNeem, Votivo)、及び、
以下の活性化化合物： 1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-1, 2, 4-
-トリアゾール-5-アミン (WO2006/043635から既知)、{1'- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル] -5-フルオロスピロ
[インドール-3, 4'-ピペリジン] -1 (2H) -イル} (2-クロロピリジン-4-
-イル) メタノン (WO2003/106457から既知)、2-クロロ-N- [2- {
1- [(2E)-3- (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル] ピペリジン-4-
-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO2006/003494から既知)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-
-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-2-オン (WO2009/049851から既知)、3- (2, 5-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-2-オ
キソ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカ-3-エン-4-イルエチルカルボネート (WO2009/049851から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) -6-
- (3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル) -5-フルオロピリミジン (WO2004/099160から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3-クロ
ロフェニル) ピリミジン (WO2003/076415から既知)、PF1364 (CA S Reg. No. 1204776-60-2)、2- [2- ({ [3-プロモ-1- (3-
クロロピリジン-2-イル) -1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミノ)

-5-クロロ-3-メチルベンゾイル]-2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル(WO 2005/085216から既知)、2-[2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル(WO 2005/085216から既知)、2-[2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル(WO 2005/085216から既知)、2-[3, 5-ジブromo-2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル(WO 2005/085216から既知)、N-[2-(5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(CN102057925から既知)、8-クロロ-N-[(2-クロロ-5-メトキシフェニル)スルホニル]-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-2-カルボキサミド(WO2010/129500から既知)、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキシドチエタン-3-イル)ベンズアミド(WO2009/080250から既知)、N-[(2E)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]ピリジン-2(1H)-イリデン]-2, 2, 2-トリフルオロアセトアミド(WO2012/029672から既知)、1-[(2-クロロ-1, 3-チアゾール-5-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド[1, 2-a]ピリミジン-1-イウム-2-オレート(WO2009/099929から既知)、1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド[1, 2-a]ピリミジン-1-イウム-2-オレート(WO2009/099929から既知)、4-(3-{2, 6-ジクロロ-4-[(3, 3-ジクロロプロパ-2-エン-1-イル)オキシ]フェノキシ}プロポキシ)-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン(CN101337940から既知)、N-[2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2008/134969から既知)、3-[ベンゾイル(メチル)アミノ]-N-[2-ブromo-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-フルオロベンズアミド(WO2010018714から既知)、[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-3-オキソ-4-オキサスピロ[4.5]デカ-1-エン-1-イル]炭酸ブチル(CN102060818から既知)、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-N-[(Z)-メトキシイミノメチル]-2-メチルベンズアミド(WO2007/026965から既知)、(3E)-3-[1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-2-ピリジニリデン]-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オン(WO2013/144213から既知)、N-(メチルスルホニル)-6-[2-(ピリジン-3-イル)-1, 3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド(WO2012/000896から既知)、N-[3-(ベンジルカルバモイル)-4-クロロフェニル]-1-メチル-3-(ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2010/051926から既知)。

10

20

30

40

【0177】

殺菌剤との混合物

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

50

【0178】

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

【0179】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.01)アルジモルフ、(1.02)アザコナゾール、(1.03)ビテルタノール、(1.04)ブロムコナゾール、(1.05)シプロコナゾール、(1.06)ジクロブトラゾール、(1.07)ジフェノコナゾール、(1.08)ジニコナゾール、(1.09)ジニコナゾール-M、(1.10)ドデモルフ、(1.11)酢酸ドデモルフ、(1.12)エポキシコナゾール、(1.13)エタコナゾール、(1.14)フェナリモール、(1.15)フェンブコナゾール、(1.16)フェンヘキサミド、(1.17)フェンプロピジン、(1.18)フェンプロピモルフ、(1.19)フルキンコナゾール、(1.20)フルルプリミドール、(1.21)フルシラゾール、(1.22)フルトリアホル、(1.23)フルコナゾール、(1.24)フルコナゾール-シス、(1.25)ヘキサコナゾール、(1.26)イマザリル、(1.27)硫酸イマザリル、(1.28)イミベンコナゾール、(1.29)イブコナゾール、(1.30)メトコナゾール、(1.31)ミクロブタニル、(1.32)ナフチフィン、(1.33)ヌアリモール、(1.34)オキシポコナゾール、(1.35)パクロブトラゾール、(1.36)ペフラゾエート、(1.37)ペンコナゾール、(1.38)ピペラリン、(1.39)プロクロラズ、(1.40)プロピコナゾール、(1.41)プロチオコナゾール、(1.42)ピリブチカルブ、(1.43)ピリフェノックス、(1.44)キンコナゾール、(1.45)シメコナゾール、(1.46)スピロキサミン、(1.47)テブコナゾール、(1.48)テルビナフィン、(1.49)テトラコナゾール、(1.50)トリアジメホン、(1.51)トリアジメノール、(1.52)トリデモルフ、(1.53)トリフルミゾール、(1.54)トリホリン、(1.55)トリチコナゾール、(1.56)ウニコナゾール、(1.57)ウニコナゾール-p、(1.58)ビニコナゾール、(1.59)ポリコナゾール、(1.60)1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、(1.61)1-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、(1.62)N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.63)N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミド、(1.64)O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イル]-1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1.65)ピリソキサゾール、(1.66)2-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.67)1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1.68)5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.69)2-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6,6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.70)2-{[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.71)2-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4

10

20

30

40

50

ートリアゾール-3-チオン、(1. 72) 1- { [rel (2R, 3S) - 3- (2-クロロフェニル) - 2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル } - 1H-1, 2, 4-ートリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 73) 1- { [rel (2R, 3R) - 3- (2-クロロフェニル) - 2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル } - 1H-1, 2, 4-ートリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 74) 5- (アリルスルファニル) - 1- { [rel (2R, 3S) - 3- (2-クロロフェニル) - 2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル } - 1H-1, 2, 4-ートリアゾール、(1. 75) 5- (アリルスルファニル) - 1- { [rel (2R, 3R) - 3- (2-クロロフェニル) - 2- (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル } - 1H-1, 2, 4-ートリアゾール、(1. 76) 2- [(2S, 4S, 5S) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 77) 2- [(2R, 4S, 5S) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 78) 2- [(2R, 4R, 5R) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 79) 2- [(2S, 4R, 5R) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 80) 2- [(2S, 4S, 5R) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 81) 2- [(2R, 4S, 5R) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 82) 2- [(2R, 4R, 5S) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 83) 2- [(2S, 4R, 5S) - 1- (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-ートリアゾール-3-チオン、(1. 84) 2- [4- (4-クロロフェノキシ) - 2- (トリフルオロメチル) フェニル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) プロパン-2-オール、(1. 85) 2- [4- (4-クロロフェノキシ) - 2- (トリフルオロメチル) フェニル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 86) 2- [4- (4-クロロフェノキシ) - 2- (トリフルオロメチル) フェニル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ペンタン-2-オール、(1. 87) 2- [2-クロロ-4- (4-クロロフェノキシ) フェニル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 88) 2- [2-クロロ-4- (2, 4-ジクロロフェノキシ) フェニル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) プロパン-2-オール、(1. 89) (2R) - 2- (1-クロロシクロプロピル) - 4- [(1R) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 90) (2R) - 2- (1-クロロシクロプロピル) - 4- [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 91) (2S) - 2- (1-クロロシクロプロピル) - 4- [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 92) (2S) - 2- (1-クロロシクロプロピル) - 4- [(1R) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 93) (1S, 2R, 5R) - 5- (4-クロロベンジル) - 2- (クロロメチル) - 2- メチル-1- (1H-1, 2, 4-ートリアゾール-1-イルメチル) シクロペンタノール、(1. 94)

10

20

30

40

50

(1 R, 2 S, 5 S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1. 95) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール。

【0180】

(2) 複合体 I 又は I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2. 01) ビキサフェン、(2. 02) ポスカリド、(2. 03) カルボキシシン、(2. 04) ジフルメトリム、(2. 05) フェンフラム、(2. 06) フルオピラム、(2. 07) フルトラニル、(2. 08) フルキサピロキサド、(2. 09) フラメトピル、(2. 10) フルメシクロックス、(2. 11) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 (1 R S, 4 S R, 9 R S) とアンチ-エピマー性ラセミ化合物 (1 R S, 4 S R, 9 S R) の混合物)、(2. 12) イソピラザム (アンチ-エピマー性ラセミ化合物 1 R S, 4 S R, 9 S R)、(2. 13) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1 R, 4 S, 9 S)、(2. 14) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1 S, 4 R, 9 R)、(2. 15) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 1 R S, 4 S R, 9 R S)、(2. 16) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1 R, 4 S, 9 R)、(2. 17) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1 S, 4 R, 9 S)、(2. 18) メプロニル、(2. 19) オキシカルボキシシン、(2. 20) ペンフルフェン、(2. 21) ペンチオピラド、(2. 22) セダキサン、(2. 23) チフルザミド、(2. 24) 1 - メチル - N - [2 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 25) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 26) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1, 1, 2, 3, 3 - ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 27) N - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 28) 5, 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ} フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(2. 29) ベンゾビンジフルピル、(2. 30) N - [(1 S, 4 R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 31) N - [(1 R, 4 S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 32) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 33) 1, 3, 5 - トリメチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 34) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 35) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 36) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 37) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 38) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2. 39) 1, 3, 5 - トリメチル - N - [(3 R

10

20

30

40

50

) - 1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] - 1H-
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 40) 1, 3, 5-トリメチル-N-[(3S)
) - 1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] - 1H-
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 41) ベノダニル、(2. 42) 2-クロロ-
 N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) ピリジ
 ン-3-カルボキサミド、(2. 43) イソフェタミド、(2. 44) 1-メチル-3-
 (トリフルオロメチル)-N-[2'- (トリフルオロメチル) ビフェニル-2-イル]
 - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 45) N-(4'-クロロビフェニル
 -2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボ
 キキサミド、(2. 46) N-(2', 4'-ジクロロビフェニル-2-イル)-3-(ジ
 フルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 47)
 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'- (トリフルオロメチル) ビフェニ
 ル-2-イル] - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 48) N-(2', 5'
 -ジフルオロビフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1
 H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 49) 3-(ジフルオロメチル)-1-メ
 チル-N-[4'- (プロパ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 1H-ピ
 ラゾール-4-カルボキサミド、(2. 50) 5-フルオロ-1, 3-ジメチル-N-
 [4'- (プロパ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 1H-ピラゾール-4
 -カルボキサミド、(2. 51) 2-クロロ-N-[4'- (プロパ-1-イン-1-イ
 ル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(2. 52) 3-(ジフルオロメチル)-
 N-[4'- (3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] -
 1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 53) N-[4'- (3,
 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 5-フルオロ-1,
 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 54) 3-(ジフルオロ
 メチル)-N-(4'-エチニルビフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-ピラゾ
 ル-4-カルボキサミド、(2. 55) N-(4'-エチニルビフェニル-2-イル)-
 5-フルオロ-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 56)
) 2-クロロ-N-(4'-エチニルビフェニル-2-イル) ニコチンアミド、(2. 5
 7) 2-クロロ-N-[4'- (3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニ
 ル-2-イル] ニコチンアミド、(2. 58) 4-(ジフルオロメチル)-2-メチル-
 N-[4'- (トリフルオロメチル) ビフェニル-2-イル] - 1, 3-チアゾール-5
 -カルボキサミド、(2. 59) 5-フルオロ-N-[4'- (3-ヒドロキシ-3-メ
 チルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 1, 3-ジメチル-1H-ピ
 ラゾール-4-カルボキサミド、(2. 60) 2-クロロ-N-[4'- (3-ヒドロキ
 シ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(
 2. 61) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4'- (3-メトキシ-3-メチルブタ
 -1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 1-メチル-1H-ピラゾール-4-カ
 ルボキサミド、(2. 62) 5-フルオロ-N-[4'- (3-メトキシ-3-メチルブ
 タ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] - 1, 3-ジメチル-1H-ピラゾ
 ル-4-カルボキサミド、(2. 63) 2-クロロ-N-[4'- (3-メトキシ-3-
 メチルブタ-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(2. 64)
) 1, 3-ジメチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデ
 ン-4-イル) - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 65) 1, 3-ジメチ
 ル-N-[(3R) - 1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-
 イル] - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 66) 1, 3-ジメチル-N
 -[(3S) - 1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]
] - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 67) 3-(ジフルオロメチル)-
 N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) プロパン-
 2-イル] - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 68) 3-(ジフルオロメ
 チル)-N-(7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-イン

10

20

30

40

50

デン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.69) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.70) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド。

(3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.01) アメトクトラジン、(3.02) アミスルブロム、(3.03) アゾキシストロビン、(3.04) シアゾファミド、(3.05) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.06) クモキシストロビン、(3.07) ジモキシストロビン、(3.08) エノキサストロビン、(3.09) ファモキサドン、(3.10) フェンアミドン、(3.11) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3.12) フルオキサストロビン、(3.13) クレソキシム-メチル、(3.14) メトミノストロビン、(3.15) オリサストロビン、(3.16) ピコキシストロビン、(3.17) ピラクロストロビン、(3.18) ピラメトストロビン、(3.19) ピラオキシストロビン、(3.20) ピリベンカルブ、(3.21) トリクロピリカルブ、(3.22) トリフロキシストロビン、(3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.24) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)アセトアミド、(3.25) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル}フェニル}アセトアミド、(3.26) (2E)-2-{2-[({ [(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル]オキシ}フェニル)エチルデン]アミノ}オキシ)メチル}フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.27) フェナミノストロビン (fenaminostrobilin)、(3.28) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.29) (2E)-2-{2-[({ シクロプロピル [(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル}フェニル}-3-メトキシアクリル酸メチル、(3.30) N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.31) 2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル}フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.32) 2-{2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル}フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.33) (2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド。

【0181】

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

【0182】

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.01) ボルドー液、(5.02)

カプタホール、(5.03) キャプタン、(5.04) クロロタロニル、(5.05) 水酸化銅、(5.06) ナフテン酸銅、(5.07) 酸化銅、(5.08) 塩基性塩化銅、(5.09) 硫酸銅(2+)、(5.10) ジクロフルアニド、(5.11) ジチアノン、(5.12) ドジン、(5.13) ドジン遊離塩基、(5.14) ファーバム、(5.15) フルオロホルベット、(5.16) ホルベット、(5.17) グアザチン、(5.18) 酢酸グアザチン、(5.19) イミノクタジン、(5.20) イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21) イミノクタジン三酢酸塩、(5.22) マンカップパー、(5.23) マンゼブ、(5.24) マンネブ、(5.25) メチラム、(5.26) メチラム亜鉛(metiram zinc)、(5.27) オキシシン銅、(5.28) プロパミジン(propamidine)、(5.29) プロピネブ、(5.30) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.31) チウラム、(5.32) トリルフルアニド、(5.33) ジネブ、(5.34) ジラム、(5.35) アニラジン。

【0183】

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

【0184】

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

【0185】

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

【0186】

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

【0187】

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

【0188】

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

10

20

30

40

50

【0189】

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.01) ベナラキシール、(12.02) ベナラキシール-M (キララキシール (kiralaxy1))、(12.03) ブピリメート、(12.04) クロジラコン、(12.05) ジメチリモール、(12.06) エチリモール、(12.07) フララキシール、(12.08) ヒメキサゾール、(12.09) メタラキシール、(12.10) メタラキシール-M (メフェノキサム)、(12.11) オフラセ、(12.12) オキサジキシール、(12.13) オキシリン酸、(12.14) オクチリノン。

【0190】

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

【0191】

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

【0192】

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

10

20

30

40

50

1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15.054) オキサチアピプロリン、(15.055) 1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イル 1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15.056) 2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.057) 2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ[2, 3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15.058) 2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4]ジチイノ[2, 3-c:5, 6-c']ジピロール-1, 3, 5, 7(2H, 6H)-テترون、(15.059) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5R)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.060) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5S)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15.061) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-{4-[4-(5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル)-1, 3-チアゾール-2-イル] ピペリジン-1-イル} エタノン、(15.062) 2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15.063) 2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル]ピリジン、(15.064) 2-フェニルフェノール及び塩、(15.065) 3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.066) 3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボニトリル、(15.067) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(15.068) 4-(4-クロロフェニル)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3, 6-ジメチルピリダジン、(15.069) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15.070) 5-クロロ-N'-フェニル-N-(プロパー-2-イン-1-イル)チオフエン-2-スルホノヒドラジド、(15.071) 5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.072) 5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.073) 5-メチル-6-オクチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-7-アミン、(15.074) (2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル、(15.075) N'-(4-{[3-(4-クロロベンジル)-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル]オキシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.076) N-(4-クロロベンジル)-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]プロパンアミド、(15.077) N-[(4-クロロフェニル)(シアノ)メチル]-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]プロパンアミド、(15.078) N-[(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15.079) N-[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15.080) N-[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、(15.081) N-{(E)-[(シクロプロピルメトキシ)イミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル]メチル}-2-フェニルアセトアミド、(15.082) N-{(Z)-[(シクロプロピルメトキシ)イミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル]メチル}-2-フェニルアセトアミド、(15.083) N'-{4-[(3-tert-ブチル-4-シアノ-1, 2-チアゾール-5-イル)オキシ]-2-クロロ-5-メチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.084) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチ

ル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル) - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15.085) N-メチル-2- (1- { [5-メチル-3- (トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N- [(1R) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル] - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15.086) N-メチル-2- (1- { [5-メチル-3- (トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N- [(1S) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル] - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15.087) {6- [({ [(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カルバミン酸ペンチル、(15.088) フェナジン-1-カルボン酸、(15.089) キノリン-8-オール、(15.090) キノリン-8-オールスルフェート (2:1)、(15.091) {6- [({ [(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カルバミン酸 tert-ブチル、(15.092) (5-ブロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル) (2, 3, 4-トリメトキシ-6-メチルフェニル) メタノン、(15.093) N- [2- (4- { [3- (4-クロロフェニル) プロパー-2-イン-1-イル] オキシ} - 3-メトキシフェニル) エチル] - N2- (メチルスルホニル) バリンアミド、(15.094) 4-オキソ-4- [(2-フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(15.095) ブター-3-イン-1-イル {6- [({ [(Z) - (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カルバメート、(15.096) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール (互変異性体形態: 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2 (1H) -オン)、(15.097) 3, 4, 5-トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15.098) [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5- (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15.099) (S) - [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5- (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15.100) (R) - [3- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) - 5- (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15.101) 2-フルオロ-6- (トリフルオロメチル) - N- (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) ベンズアミド、(15.102) 2- (6-ベンジルピリジン-2-イル) キナゾリン、(15.103) 2- [6- (3-フルオロ-4-メトキシフェニル) - 5-メチルピリジン-2-イル] キナゾリン、(15.104) 3- (4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、(15.105) アブシジン酸、(15.106) N' - [5-ブロモ-6- (2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ) - 2-メチルピリジン-3-イル] - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.107) N' - {5-ブロモ-6- [1- (3, 5-ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.108) N' - {5-ブロモ-6- [(1R) - 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.109) N' - {5-ブロモ-6- [(1S) - 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.110) N' - {5-ブロモ-6- [(シス-4-イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.111) N' - {5-ブロモ-6- [(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2-メチルピリジン-3-イル} - N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.112) N-シクロプロピル-3- (ジフ

10

20

30

40

50

ルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H
 - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 113) N - シクロプロピル - N - (2 -
 シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1
 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 114) N - (2 - tert - ブチルベ
 ンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル
 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 115) N - (5 - クロロ - 2 - エ
 チルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 -
 メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 116) N - (5 - クロロ -
 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フ
 ルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 117) N - シ
 クロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル)
 - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 118
) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ
 - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (15. 119) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジ
 ル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 -
 カルボキサミド、(15. 120) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル)
 - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H -
 ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 121) N - シクロプロピル - 3 - (ジフル
 オロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 -
 メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 122) N - シクロプロピル
 - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ
 - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 123) N - シクロプ
 ロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチ
 ルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 124)
 N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフル
 オロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(1
 5. 125) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピ
 ル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カ
 ルボキサミド、(15. 126) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジ
 ル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1
 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 127) N - シクロプロピル - 3 - (ジ
 フルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロ
 メチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 128) N - [
 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフ
 ルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (15. 129) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジ
 ル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1
 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 130) N - シクロプロピル - 3 - (ジ
 フルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4, 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1
 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15. 131) N - シクロプロピ
 ル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1
 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、(15. 132) N' - (2, 5
 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、
 (15. 133) N' - {4 - [(4, 5 - ジクロロ - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル)
 オキシ] - 2, 5 - ジメチルフェニル} - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、
 (15. 134) N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ
 - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(15
 . 135) 9 - フルオロ - 2, 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2, 3 - ジ
 ヒドロ - 1, 4 - ベンゾオキサアゼピン、(15. 136) 2 - {2 - フルオロ - 6 - [

10

20

30

40

50

(8-フルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]フェニル}プロパン-2-オール、(15.137)2-{2-[(7, 8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]-6-フルオロフェニル}プロパン-2-オール、(15.138)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.139)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.140)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.141)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.142)N-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.143)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.144)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.145)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.146)N-(2-ブロモフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.147)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.148)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.149)4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.150)N'- (4-{3-[(ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.151)N'- (2, 5-ジメチル-4-{3-[(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.152)N'- (2, 5-ジメチル-4-{3-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.153)N'- (2, 5-ジメチル-4-{3-[(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.154)N'- (2, 5-ジメチル-4-{3-[(ペンタフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.155)N'- (4-{ [3-(ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.156)N'- (2, 5-ジメチル-4-{ [3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.157)N'- (2, 5-ジメチル-4-{ [3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.158)N'- (2, 5-ジメチル-4-{ [3-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.159)N'- (2, 5-ジメチル-4-{ [3-(ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.160)2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.161)2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキ

10

20

30

40

50

シ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 162) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 163) 2-{3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 164) 2-{3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15. 165) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 166) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 167) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5S)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 168) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5R)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 169) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5S)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 170) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] - 1-[4-(4-{(5R)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル} - 1, 3-チアゾール-2-イル) ピペリジン-1-イル] エタノン、(15. 171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} フェニルメタンスルホネート、(15. 173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15. 174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニルメタンスルホネート。

【0193】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

式（I）で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【0194】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物（例えば、タンパク質又は二次代謝産物）などがある。

【0195】

生物学的殺有害生物剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0196】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

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

【0197】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructic*

10

20

30

40

50

ola)、特に、株NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在:イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株IFPC 200613又は株Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株251 (AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株V117b、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*T. harzianum rifai*) T39 (受託番号 CNCM I-952)。

【0198】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

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

【0199】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定に特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に含まれる。例としては、以下のものを挙げることができる：

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

【0200】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する) の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (azadirachtin)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (C

henopodium anthelminticum)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (Dryopteris filix-mas)、スギナ (Equisetum arvense)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (Chenopodium quinoa) サポニン抽出物)、除虫菊 (Pyrethrum/Pyrethrins)、スリナムニガキ (Quassia amara)、コナラ属 (Quercus)、キラヤ属 (Quillaja)、Regalia、(「RequiemTM Insecticide」)、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ (Symphytum officinale)、ヨモギギク (Tanacetum vulgare)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (Tropaeolum majus)、セイヨウイラクサ (Urtica dioica)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (Viscum album)、アブラナ科 (Brassicaceae) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

10

【0201】

混合成分としての薬害軽減剤

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

20

【0202】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物 (天然に発生している作物植物を包含する) のような全ての植物及び植物個体群を意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種及び保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、塊茎、根及び根茎などである。収穫物、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

30

40

【0203】

該活性成分を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、噴霧、煙霧 (fogging)、ばらまき、拡散 (spreading-on)、注入などによって、直接的に行うか、又は、該活性成分を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

【0204】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはブ

50

ロトプラス融合のような慣習的な生物学的育種により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物）及びそれらの部分を処理する。用語「部分（parts）」又は「植物の部分（parts of plants）」又は「植物の部分（plant parts）」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な品種又は使用されている慣習的な品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

10

【0205】

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

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件（土壌、気候、生育期、養分（diet））に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果（「相乗効果」）も生じ得る。例えば、実際に予期される効果を超える下記効果が可能である：本発明に従って使用し得る化合物及び組成物の施用量の低減及び／又は活性スペクトルの拡大及び／又は活性の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、渇水又は水中若しくは土壌中の塩分のレベルに対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、促進された成熟、収穫量の増加、収穫された生産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、

20

【0206】

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理されるのが好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渇水又は水中若しくは土壌中の塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び／又は改善された加工性である。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物に対する植物の向上した防

御、例えば、昆虫類、ダニ類、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した防御、並びに、さらに、特定の除草活性成分に対する植物の向上した耐性である。トランスジェニック植物の例としては、以下のものを挙げることができる：重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、トマト、エンドウ及び他のタイプの野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（以下の果実を有するもの：リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びグレープ）などであり、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な形質は、植物体内で形成された毒素による、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した防御であり、特に、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する遺伝物質〔

例えば、遺伝子CryIA（a）、CryIA（b）、CryIA（c）、CryIIA、CryIII A、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにそれらの組合せ〕によって植物体内で形成された毒素による、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した防御である（以下、「Bt植物」と称する）。同様に特に重要な形質は、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子及びそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、菌類、細菌類及びウイルスに対する植物の向上した防御である。特に重要であるさらに別の形質は、特定の除草活性成分、例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシンなどに対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該形質を付

30

40

50

与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。「Bt植物」の例としては、YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）及びNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）の商品名で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種及びジャガイモ品種などを挙げることができる。除草剤耐性植物の例としては、Roundup Ready（登録商標）（グリホセートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノン系に対する耐性）及びSTS（登録商標）（スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ）の商品名で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種などを挙げることができる。さらに、除草剤抵抗性植物（除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物）としては、Clearfield（登録商標）（例えば、トウモロコシ）の商品名で販売されている品種などがある。もちろん、ここで述べたことは、これらの遺伝形質又は今後開発される遺伝形質を有し、将来において開発及び／又は販売されるであろう植物品種にも適用される。

【0207】

上記で挙げた植物は、一般式（I）で表される化合物及び／又は本発明の活性成分混合物を用いて、本発明に従って特に有利に処理することができる。該活性成分又は混合物について上記で述べた好ましい範囲は、これらの植物の処理にも同様に適用される。特に重要なのは、本明細書内で具体的に言及されている化合物又は混合物による上記植物の処理である。

【0208】

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

特に有利で有益な形質を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾によって受け取った全ての植物は、本発明に従って処理されるのが好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渇水又は水中若しくは土壤中の塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び／又は改善された加工性である。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する遺伝物質〔例えば、遺伝子CryIA（a）、CryIA（b）、CryIA（c）、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにそれらの組合せ〕によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性化合物（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該形質を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオ

ムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの)などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な形質は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0209】

作物保護—処理の種類

式(I)で表される本発明化合物を用いた植物及び植物の部分の処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散(s p r e a d i n g - o n)、注入、灌水(灌注(d r e n c h i n g))、点滴灌漑などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官(p r o p a g a t i o n m a t e r i a l)の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、湿式種子処理、スラリー処理、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても行う。さらに、該活性成分を微量散布法(u l t r a - l o w v o l u m e m e t h o d)によって使用することも可能であり、又は、該活性成分調製物若しくは該活性成分自体を土壤中に注入することも可能である。

10

【0210】

植物の好ましい直接的な一処理は、茎葉施用である。即ち、式(I)で表される本発明化合物を茎葉部に施用する。そして、処理頻度及び施用量は、特定の病原体、有害生物又は雑草の発生圧に対して調節し得る。

20

【0211】

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

30

【0212】

種子の処理

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

40

【0213】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式(I)で表される本発明化合物で処理することによる。種子及び発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、該

50

種子を、式（I）で表される活性成分と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法を包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）で表される活性成分と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

【0214】

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

【0215】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、式（I）で表される本発明化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される活性成分と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される活性成分と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（I）で表される活性成分と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、本発明組成物の中の個々の活性成分は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）で表される活性成分と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（I）で表される活性成分と混合成分が被膜の一部分として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

【0216】

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

【0217】

本発明の有利な点の1つは、本発明の組成物が有している際立った浸透移行特性によって、その組成物で種子を処理することによって、害虫から、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理することを省くことができる。

【0218】

さらなる有利な点は、式（I）で表される本発明化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということである。

【0219】

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

【0220】

さらにまた、式（I）で表される本発明化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、例えば、共生生物（例えば、根粒菌、菌根菌及び／又は内部寄生性の細菌若しくは真菌）によるコロニー形成が改善されるということ、及び／又は、窒素固定が最適化されるということについても、言及すべきである。

【0221】

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

【0222】

既に上記で記載したように、式（I）で表される本発明化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド（特に、殺虫特性及び／又は殺線虫特性を有するポリペプチド）の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は

、バシルス (*Bacillus*) 属、リゾビウム (*Rhizobium*) 属、プセウドモナス (*Pseudomonas*) 属、セラチア (*Serratia*) 属、トリコデルマ (*Trichoderma*) 属、クラビバクテル (*Clavibacter*) 属、グロムス (*Glomus*) 属又はグリオクラジウム (*Gliocladium*) 属などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種 (*Bacillus* sp.) に由来する少なくとも 1 種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する。

【0223】

本発明に関連して、式 (I) で表される本発明化合物は、種子に対して、単独で、又は、適切な製剤に含ませて、施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子 (例えば、プライミング) を使用することもできる。

【0224】

一般に、種子の処理においては、種子に施用する本発明組成物の量及び／又はさらなる添加剤の量を、種子の発芽が悪影響を受けないように、及び、種子から生じた植物が損傷を受けないように、確実に選択しなければならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性成分の場合に、確実に実施しなければならない。

【0225】

本発明の組成物は、直接的に施用することが、即ち、別の成分を含ませることなく、また、希釈することなく、施用することが可能である。一般に、該組成物は、適切な製剤の形態で種子に施用するのが好ましい。種子を処理するための適切な製剤及び方法は、当業者には知られており、そして、例えば、以下の文献に記載されている：US 4, 272, 417 A、US 4, 245, 432 A、US 4, 808, 430 A、US 5, 876, 739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

【0226】

本発明に従って使用するための式 (I) で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0227】

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

【0228】

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

【0229】

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

10

20

30

40

50

フタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【0230】

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

10

【0231】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0232】

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

【0233】

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

20

【0234】

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

【0235】

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

30

【0236】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤（concentrate）又は水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はそれらの希釈された調製物は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。この場合、発現により形成された物質と相互作用して、付加的な相乗効果も生じ得る。

40

50

【0237】

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

【0238】

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

【0239】

動物衛生

動物衛生の分野において、即ち、獣医学の分野において、本発明による活性成分は、動物寄生虫に対して、特に、外部寄生虫に対して、又は、さらなる実施形態においては、内部寄生虫に対して、有効である。用語「内部寄生虫」には、特に、蠕虫類（例えば、条虫類、線虫類又は吸虫類）及び原生動物（例えば、球虫類）が包含される。外部寄生虫は、典型的には、及び、好ましくは、以下のものである：節足動物、特に、昆虫類、例えば、ハエ類（刺咬性（biting）及び舐性（licking））、寄生性のハエ幼虫、シラミ類、ケジラミ類（hair lice）、ハジラミ類及びノミ類など；又は、ダニ類、例えば、マダニ類（ticks）、例えば、マダニ類（hard ticks）若しくはヒメダニ類（soft ticks）、又は、ダニ類（mites）、例えば、ヒゼンダニ類（scab mites）、ツツガムシ類（harvest mites）及びバードマイト（bird mites）など、及び、さらに、水性外部寄生虫、例えば、カイアシ類。

【0240】

獣医学の分野において、恒温動物に対する毒性が好ましい程度である式（I）で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。

【0241】

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

【0242】

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

【0243】

好ましい実施形態では、式（I）で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0244】

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

【0245】

動物寄生生物を防除するために式（I）で表される化合物を使用することは、上記動物

10

20

30

40

50

の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済で且つより容易な動物飼育が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0246】

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

10

【0247】

上記寄生虫としては、以下のものを挙げるができる：

アノプブリダ目（Anoplurida）の、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、プチルス属種（Phthirus spp.）、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；特定の例は以下のとおりである：リノグナツス・セトス（Linognathus setosus）、リノグナツス・ビツリ（Linognathus vituli）、リノグナツス・オビルス（Linognathus ovis）、リノグナツス・オビホルミス（Linognathus oviiformis）、リノグナツス・ペダリス（Linognathus pedalis）、リノグナツス・ステノプシス（Linognathus stenopsis）、ハエマトピヌス・アシニ・マクロセファルス（Haematopinus asini macrocephalus）、ハエマトピヌス・エウリステルヌス（Haematopinus euryesternus）、ハエマトピヌス・スイス（Haematopinus suis）、ペジクルス・フマヌス・カピチス（Pediculus humanus capitis）、ペジクルス・フマヌス・コルポリス（Pediculus humanus corporis）、フィロエラ・バスタトリクス（Phylloera vastatrix）、フチルス・プビス（Phthirus pubis）、ソレノポテス・カピラツス（Solenopotes capillatus）；

20

30

マロファギダ目（Mallophagida）並びにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）及びイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）の、例えば、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）；特定の例は以下のとおりである：ボビコラ・ボビス（Bovicola bovis）、ボビコラ・オビス（Bovicola ovis）、ボビコラ・リムバタ（Bovicola limbata）、ダマリナ・ボビス（Damalina bovis）、トリコデクテス・カニス（Trichodectes canis）、フェリコラ・スブストラツス（Felicola subrostratus）、ボビコラ・カプラエ（Bovicola caprae）、レピケントロン・オビス（Lepikentron ovis）、ウェルネキエラ・エクイ（Werneckiella equi）；

40

双翅目（Diptera）並びにネマトセリナ亜目（Nematocerina）及びブラキセリナ亜目（Brachycerina）の、例えば、アエデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、クレキス属種（Culex spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、エウシムリウ

50

ム属種 (*Eusimulium* spp.)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、オダグミア属種 (*Odagmia* spp.)、ウィルヘルミア属種 (*Wilhelmia* spp.)、ヒボミトラ属種 (*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種 (*Atylotus* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、フィリポミイア属種 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属種 (*Braula* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア属種 (*Haematobia* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、グロシナ属種 (*Glossina* spp.)、カリホラ属種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、クリソミイア属種 (*Chrysomyia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)；特定の例は以下のとおりである：アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・マクリペンニス (*Anopheles maculipennis*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クレキス・ピピエンス (*Clex pipiens*)、クレキス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ファンニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、ストモキス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルシリア・セリカタ (*Lucilia sericata*)、シムリウム・レプタンス (*Simulium reptans*)、フレボトムス・パパタシ (*Phlebotomus papatasi*)、フレボトムス・ロンギバルピス (*Phlebotomus longipalpis*)、オダグミア・オルナタ (*Odagmia ornata*)、ウィルヘルミア・エクイナ (*Wilhelmia equina*)、ボオフトラ・エリトロセファラ (*Boophthora erythrocephala*)、タバヌス・ブロミウス (*Tabanus bromius*)、タバヌス・スポドプテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラツス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・スデチクス (*Tabanus sudeticus*)、ヒボミトラ・シウレア (*Hybomitra ciurea*)、クリソプス・カエクチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクツス (*Chrysops relictus*)、ハエマトポタ・プルビアリス (*Haematopota pluvialis*)、ハエマトポタ・イタリカ (*Haematopota italica*)、ムスカ・アウツムナリス (*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ハエマトビア・イリタンス・イリタンス (*Haematobia irritans irritans*)、ハエマトビア・イリタンス・エキシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ハエマトビア・スチムランス (*Haematobia stim*

ulans)、ヒドロタエア・イリタンス(*Hydrotaea irritans*)、ヒドロタエア・アルビプンクタ(*Hydrotaea albipuncta*)、クリソミイア・クロロピガ(*Chrysomya chloropyga*)、クリソミイア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、ヒポデルマ・ボビス(*Hypoderma bovis*)、ヒポデルマ・リネアツム(*Hypoderma lineatum*)、プルゼバルスキアナ・シレヌス(*Przhevalskiana silenusa*)、デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、メロファグス・オビヌス(*Melophagus ovinus*)、リポプテナ・カプレオリ(*Lipoptena capreoli*)、リポプテナ・セルビ(*Lipoptena cervi*)、ヒポボスカ・バリエガタ(*Hippobosca variegata*)、ヒポボスカ・エクイナ(*Hippobosca equina*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、ガステロフィルス・ハエモロイダリス(*Gasterophilus haemorrhoidalis*)、ガステロフィルス・イネルミス(*Gasterophilus inermis*)、ガステロフィルス・ナサリス(*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィルス・ニグリコルニス(*Gasterophilus nigricornis*)、ガステロフィルス・ペコルム(*Gasterophilus pecorum*)、ブラウラ・コエカ(*Braula coeca*) ;

ノミ目(*Siphonapterida*)の、例えば、プレキス属種(*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属種(*Ctenocephalides* spp.)、ツンガ属種(*Tunga* spp.)、キセノプシラ属種(*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属種(*Ceratophyllus* spp.) ; 特定の例は以下のとおりである : クテノセファリデス・カニス(*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス(*Ctenocephalides felis*)、プレキス・イリタンス(*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス(*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス(*Xenopsylla cheopis*) ;

ヘテロプテリダ目(*Heteroptera*)の、例えば、シメキス属種(*Cimex* spp.)、トリアトマ属種(*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種(*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス属種(*Panstrongylus* spp.) ;

ゴキブリ目(*Blattaria*)の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス(*Blattella orientalis*)、ペリプラネタ・アメリカナ(*Periplaneta americana*)、ブラッテラ・ゲルマニカ(*Blattella germanica*)、及び、スベラ属種(*Supella* spp.) (例えば、スベラ・ロンギパルパ(*Supella longipalpa*)) ;

ダニ亜綱(*Acarina*)並びにメタスティグマ目(*Metastigmata*)及びメソスティグマ目(*Mesostigmata*)の、例えば、アルガス属種(*Argas* spp.)、オルニトドルス属種(*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種(*Otobius* spp.)、イクソデス属種(*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種(*Amblyomma* spp.)、リピセファルス(ボオフィルス)属種(*Rhipicephalus (Boophilus)* spp.)、デルマセントル属種(*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種(*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種(*Hyalomma* spp.)、デルマニス属種(*Dermanyssus* spp.)、リピセファルス属種(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属)、オルニトニス属種(*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニス属種(*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種(*Raillietia* spp.)、プネウモニス属種(*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属種(*Stern*

ostoma spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)、アカラピス属種 (Acarapis spp.) ; 特定の例は以下のとおりである : アルガス・ペルシクス (Argas persicus)、アルガス・レフレキス (Argas reflexus)、オルニトドルス・モウバタ (Ornithodoros moubata)、オトビウス・メグニニ (Otobius megnini)、リピセファルス (ボオフィルス)・ミクロプルス (Rhipicephalus (Boophilus) microplus)、リピセファルス (ボオフィルス)・デコラツス (Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus)、リピセファルス (ボオフィルス)・アンヌラツス (Rhipicephalus (Boophilus) annulatus)、リピセファルス (ボオフィルス)・カルセラツス (Rhipicephalus (Boophilus) calceratus)、ヒアロンマ・アナトリクム (Hyalomma anatolicum)、ヒアロンマ・アエギプチクム (Hyalomma aegypticum)、ヒアロンマ・マルギナツム (Hyalomma marginatum)、ヒアロンマ・トランシエンス (Hyalomma transiens)、リピセファルス・エベルトシ (Rhipicephalus evertsi)、イキシデス・リシヌス (Ixodes ricinus)、イキシデス・ヘクサゴヌス (Ixodes hexagonus)、イキシデス・カニスガ (Ixodes canisuga)、イキシデス・ピロス (Ixodes pilosus)、イキシデス・ルビクンズ (Ixodes rubicundus)、イキシデス・スカブラリス (Ixodes scapularis)、イキシデス・ホロシクルス (Ixodes holoecyclus)、ハエマフィサリス・コンシンナ (Haemaphysalis concinna)、ハエマフィサリス・プンクタタ (Haemaphysalis punctata)、ハエマフィサリス・シンナバリナ (Haemaphysalis cin nabarina)、ハエマフィサリス・オトフィラ (Haemaphysalis otophila)、ハエマフィサリス・レアキ (Haemaphysalis leachi)、ハエマフィサリス・ロンギコルニ (Haemaphysalis longicorni)、デルマセントル・マルギナツス (Dermacentor marginatus)、デルマセントル・レチクラツス (Dermacentor reticulatus)、デルマセントル・ピクツス (Dermacentor pictus)、デルマセントル・アルビピクツス (Dermacentor albipictus)、デルマセントル・アンデロソニ (Dermacentor andersoni)、デルマセントル・ビリアビリス (Dermacentor variabilis)、ヒアロンマ・マウリタニクム (Hyalomma mauritanicum)、リピセファルス・サングイネウス (Rhipicephalus sanguineus)、リピセファルス・ブルサ (Rhipicephalus bursa)、リピセファルス・アッペンジクラツス (Rhipicephalus appendiculatus)、リピセファルス・カペンシス (Rhipicephalus capensis)、リピセファルス・ツラニクス (Rhipicephalus turanicus)、リピセファルス・ザムベジエンシス (Rhipicephalus zambeziensis)、アンブリオンマ・アメリカヌム (Amblyomma americanum)、アンブリオンマ・バリエガツム (Amblyomma variegatum)、アンブリオンマ・マクラツム (Amblyomma maculatum)、アンブリオンマ・ヘブラエウム (Amblyomma hebraeum)、アンブリオンマ・カジェネンセ (Amblyomma cajennense)、デルマニスス・ガリナエ (Dermanyssus gallinae)、オルニトニスス・ブルサ (Ornithonyssus bursa)、オルニトニスス・シルビアルム (Ornithonyssus sylviarum)、バロア・ジャコブソニ (Varroa jacobsoni) ;

アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) 及びアカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、

オルニトケイレチア属種 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属種 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psorergates* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.)、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cytodites* spp.)、及び、ラミノシオプテス属種 (*Laminosioptes* spp.)；特定の例は以下のとおりである：ケイレチエラ・ヤスグリ (*Cheyletiella yasguri*)、ケイレチエラ・ブラケイ (*Cheyletiella blakei*)、デモデキス・カニス (*Demodex canis*)、デモデキス・ボビス (*Demodex bovis*)、デモデキス・オビス (*Demodex ovis*)、デモデキス・カブラエ (*Demodex caprae*)、デモデキス・エクイ (*Demodex equi*)、デモデキス・カバリ (*Demodex caballi*)、デモデキス・スイス (*Demodex suis*)、ネオトロムビクラ・アウツムナリス (*Neotrombicula autumnalis*)、ネオトロムビクラ・デサレリ (*Neotrombicula desaleli*)、ネオスコンガスチア・キシロテルモビア (*Neoschonegastia xerothermobia*)、トロムビクラ・アカムシ (*Trombicula akamushi*)、オトデクテス・シノチス (*Otodectes cynotis*)、ノトエドレス・カチ (*Notoedres cati*)、サルコプテス・カニス (*Sarcoptes canis*)、サルコプテス・ボビス (*Sarcoptes bovis*)、サルコプテス・オビス (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカブラエ (*Sarcoptes rupicaprae*) (=サルコプテス・カブラエ (*S. caprae*))、サルコプテス・エクイ (*Sarcoptes equi*)、サルコプテス・スイス (*Sarcoptes suis*)、プソロプテス・オビス (*Psoroptes ovis*)、プソロプテス・クニクリ (*Psoroptes cuniculi*)、プソロプテス・エクイ (*Psoroptes equi*)、コリオプテス・ボビス (*Chorioptes bovis*)、プソエルガテス・オビス (*Psoergates ovis*)、プネウモニソイジク・マンゲ (*Pneumonyssoides mange*)、プネウモニソイデス・カニヌム (*Pneumonyssoides caninum*)、アカラピス・ウォオジ (*Acarapis woodi*)。

【0248】

カイアシ類の亜綱の、特に、ウオジラミ目 (*Siphonostomatoidea*) のレペオフテイルス属 (*Lepeophtheirus*) 及びカリグス属 (*Caligus*)；例として、及び、特に好ましくは、レペオフテイルス・サルモニス種 (*Lepeophtheirus salmonis*)、カリグス・エロンガツス種 (*Caligus elongatus*) 及びカリグス・クレメンシ種 (*Caligus clemensi*) を挙げることができる。

【0249】

一般に、本発明の活性成分は、動物を処置するために使用される場合、直接的に使用することができる。それらは、好ましくは、当技術分野において既知の製薬上許容される賦形剤及び／又は助剤を含んでいてもよい医薬組成物の形態で使用（投与）される。

【0250】

動物衛生の分野において、また、畜産業において、本発明の活性成分は、既知方法で、例えば、錠剤、カプセル剤、頓服水剤、水薬 (*drench*)、顆粒剤、ペースト剤、大

10

20

30

40

50

型丸薬、フィードスルー法及び坐剤などの形態で経腸投与することにより、並びに、例えば、注射（とりわけ、筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射）及びインプラントなどによって非経口投与することにより、並びに、鼻内投与することにより、並びに、例えば、浸漬（*dipping*）又は薬浴（*bathing*）、スプレー、ポアオン及びスポットオン、洗浄及び散粉の形態で経皮投与することにより、並びに、さらに、首輪、耳標、尾標、肢バンド（*limb bands*）、端綱、マーキング装置などの活性成分含有成形品を用いて、使用（＝投与）する。該活性成分は、シャンプーとして製剤することができるか、又は、エロゾル若しくは非加圧スプレー（例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー）の中で使用し得る適切な製剤として製剤することができる。

【0251】

家畜、家禽及びペットなどに使用する場合、本発明の活性成分は、1重量％～80重量％の量の該活性成分を含有する製剤（例えば、粉末剤、水和剤〔「WP」〕、エマルジョン剤、乳剤〔「EC」〕、易流動性組成物、均質な溶液剤及び懸濁製剤〔「SC」〕など）として、直接的に使用することができるか、又は、希釈（例えば、100倍～10000倍に希釈）した後で使用することができるか、又は、それらは、薬浴として使用することができる。

【0252】

動物衛生の分野において使用する場合、本発明の活性成分は、活性スペクトルを拡大するために、適切な協力剤、忌避剤又は別の活性成分（例えば、殺ダニ剤、殺虫剤、駆虫薬、抗原生動物薬）と組み合わせて使用することができる。式（I）で表される本発明化合物に関して可能性のある混合成分は、動物衛生において使用される場合、群（INS-1）～群（INS-25）から選択される1種類以上の化合物であり得る。

【0253】

（INS-1） アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XM C、及び、キシリルカルブ； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、ベンジオカルブ、カルバリル、メソミル、プロマシル（*promacyl*）及びプロボクスルである；又は、

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス（－メチル、－エチル）、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス（－メチル）、クマホス、シアノホス、ジメトン－S－メチル、ダイアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソフェンホス、O－（メトキシアミノチオホスホリル）サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン－メチル、パラチオン、パラチオン－メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス（－メチル）、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、アザメチホス、クロルフェンビンホス、クロルピリホス、クマホス、シチオアート（*cythioate*）、ダイアジノン（*dimpylate*）、ジクロロボス（DDVP）、ジクロトホス、ジメトエート、エチオン（*diethion*）、ファミフル（*famophos*）、フェニトロチオン、フェンチオン（MPP）、ヘプテノホス、マラチオン、ナレド、ホスメット（PMP、

10

20

30

40

50

phtalofos)、ホキシム、プロペタムホス、テメホス、テトラクロルビンホス(CVMP)及びトリクロルホン／メトリホナートである。

【0254】

(INS-2) GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

有機塩素系、例えば、プロモシクレン、クロルダン、及び、エンドスルファン(アルファ)、ヘプタクロル、リンデン、及び、トキサフェン；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、エンドスルファン(アルファ)及びリンデンである；又は、

フィプロール系(フェニルピラゾール系)、例えば、アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール、リザゾール(rizazole)；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、フィプロニル及びピリプロールである；又は、

アリールイソオキサゾリン系、アリールピロリン系、アリールピロリジン系、例えば、フルラネル(WO 2009/2024541から既知、ex. 11-1；さらには、以下のものから知られている化合物：WO 2012007426、WO 2012042006、WO 2012042007、WO 2012107533、WO 2012120135、WO 2012165186、WO 2012155676、WO 2012017359、WO 2012127347、WO 2012038851、WO 2012120399、WO 2012156400、WO 2012163959、WO 2011161130、WO 2011073444、WO 2011092287、WO 2011075591、WO 2011157748、WO 2007/075459、WO 2007/125984、WO 2005/085216、WO 2009/002809)、アフォキシレイナー(例えば、以下のものに記載されている：WO 2011149749)及び構造的に関連しているアリールピロリン系(例えば、以下のものから既知：WO 2009/072621、WO 2010020522、WO 2009112275、WO 2009097992、WO 2009072621、JP 2008133273、JP 2007091708)又はアリールピロリジン系(例えば、以下のものに記載されている：WO 2012004326、WO 2012035011、WO 2012045700、WO 2010090344、WO 2010043315、WO 2008128711、JP 2008110971)、及び、いわゆるメタジアミド系の群の化合物(例えば、以下のものから既知：WO 2012020483、WO 2012020484、WO 2012077221、WO 2012069366、WO 2012175474、WO 2011095462、WO 2011113756、WO 2011093415、WO 2005073165)；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、アフォキシレイナー及びフルラネルである。

【0255】

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

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン(d-シーストランス、d-トランス)、ピフェントリン、バイオアレスリン、バイオアレスリン S-シクロペンテニル、バイオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン(ベーター)、シハロトリン(ガンマー、ラムダー)、シベルメトリン(アルファ、ベーター、シーター、ゼーター)、シフェノトリン[(1R)-トランス異性体]、デルタメトリン、ジメフルトリン、エムペントリン[(E)-Z)-(1R)異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンブロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート(タウ)、ハルフェンブロックス、イミプロトリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン[(1R)-トランス異性体]、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン類(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン、RU 15525、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン[(1R)異性体]、トラロメトリン、ト

ランスフルトリン、及び、Z X I 8901；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、I型ピレスロイドのアレスリン、ピオアレスリン、ペルメトリン、フェノトリン、レスメトリン、テトラメトリン、及び、II型ピレスロイド（アルファシアノピレスロイド系）のアルファシペルメトリン、シフルトリン（ベーター）、シハロトリン（ラムダー）、シペルメトリン（アルファ、ゼーター）、デルタメトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート（タウ）、及び、エステルフリーピレスロイドのエトフェンプロックス及びシラフルオフエンである；又は、有機塩素系化合物、例えば、DDT、又は、メトキシクロル。このクラスの活性成分は、長期間持続する接触－忌避作用を有し、従って、活性スペクトルがこの成分を含むように拡大されるので、混合成分として極めて特に適している。

10

【0256】

（INS-4）ニコチン作動性アセチルコリン受容体作動薬、例えば、

ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、イミダクロチン（imidaclothrin）、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサム；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム及びチアクロプリドである；又は、

ニコチン。

【0257】

（INS-5）アロステリックアセチルコリン受容体モジュレーター（作動薬）、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、スピノサド及びスピネトラムである。

20

【0258】

（INS-6）塩化物チャンネル活性化薬、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩、エプリノメクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、レピメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミルベメクチン、モキシデクチン、及び、セラメクチン；インドールテルペノイド系、例えば、ノズリスボル酸（nodulisporic acid）誘導体、特に、ノズリスボル酸A；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、ドラメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシンオキシム、モキシデクチン、セラメクチン及びノズリスボル酸Aである。

30

【0259】

（INS-7）幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン（S-）、キノブレン、メトブレン（S-）；又は、フェノキシカルブ；ピリプロキシフェン；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、メトブレン（S-）及びピリプロキシフェンである。

【0260】

（INS-8）ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ジフロビダジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、エトキサゾールである。

40

【0261】

（INS-9）S10-1及びラトロフィリン受容体作動薬、例えば、環状デプシペプチド系、例えば、エモデプシド及びその前駆物質PF1022A（EP 382173から知られている、化合物I）；ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、エモデプシドである。

【0262】

（INS-10）酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン。

【0263】

（INS-12）ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、ペンスルタ

50

ップ、カルタップ（塩酸塩）、チオシクラム、及び、チオスルタップ（ナトリウム）。

【0264】

（INS-13） キチン生合成阻害薬（タイプ0）、例えば、ベンゾイル尿素系、例えば、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、ジフルベンズロン、フルアズロン、ルフェヌロン及びトリフルムロンである。

【0265】

（INS-14） キチン生合成阻害薬（タイプ1）、例えば、ブプロフェジン。

10

【0266】

（INS-15） 脱皮阻害薬、例えば、シロマジン、及び、ジシクラニル； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、シロマジン及びジシクラニルである。

【0267】

（INS-16） エクジソン作動薬／ディスラプター、例えば、ジアシルヒドラジン系、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド。

【0268】

（INS-17） オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ、シミアゾール、クロルジメホルム、及び、デミジトラズ； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、アミトラズ、シミアゾール及びデミジトラズである。

20

【0269】

（INS-18） 複合体 I I I 電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；アセキノシル；フルアクリピリム。

【0270】

（INS-19） 複合体 I 電子伝達阻害薬、例えば、MET I 殺ダニ剤の群の、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、フェンピロキシメート、ピリミジフェン及びトルフェンピラドである。

30

【0271】

（INS-20） 電位制御ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ、及び、メタフルミゾン； ここで、外部寄生虫に対する使用に関して、特に好ましいのは、インドキサカルブ及びメタフルミゾンである。

【0272】

（INS-21） アセチル-CoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロノ酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、及び、スピロメシフェン；又は、テトラミン酸誘導体、例えば、スピロテトラマト。

【0273】

（INS-22） 複合体 I I 電子伝達阻害薬、例えば、シエノピラフェン。

40

【0274】

（INS-23） リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド系、例えば、フルベンジアミド、クロラントラニリプロール（Rynaxypr）、シアントラニルプロール（Cyzypypr）、及び、さらに、3-ブromo-N-〔2-ブromo-4-クロロ-6-〔（1-シクロプロピルエチル）カルバモイル〕フェニル〕-1-（3-クロロピリジン-2-イル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド（WO 2005/077934から既知）又は2-〔3, 5-ジブromo-2-（〔3-ブromo-1-（3-クロロピリジン-2-イル）-1H-ピラゾール-5-イル〕カルボニル〕アミノ）ベンゾイル〕-1, 2-ジメチルヒドラジンカルボン酸メチル（WO 2007/043677から既知）、及び、さらに、1-（3-クロロピリジン-2-イル）-N-〔4-シアノ

50

－2－メチル－6－（メチルカルバモイル）フェニル］－3－〔〔5－（トリフルオロメチル）－2H－テトラゾール－2－イル］メチル］－1H－ピラゾール－5－カルボキサミド（CAS No. 1229654-66-3：混合物は、以下のものも含んでいる可能性がある：1－（3－クロロ－2－ピリジニル）－N－〔4－シアノ－2－メチル－6－〔（メチルアミノ）カルボニル］フェニル］－3－〔〔5－（トリフルオロメチル）－1H－テトラゾール－1－イル］メチル］－1H－ピラゾール－5－カルボキサミド、CAS No. 1229656-17-0）。

【0275】

（INS-24）作用機序が知られていないさらなる活性成分、例えば、アザジラクチン、アミドフルメット、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、キノメチオナート、氷晶石（cryolite）、シフルメトフェン、ジコホル、フルエンシルホン（5－クロロ－2－〔（3，4，4－トリフルオロブター3－エン－1－イル）スルホニル］－1，3－チアゾール）、フルフェネリム、ピリダリル、及び、ピリフルキナゾン；及び、さらに、バシルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）に基づく調製物（I-1582，BioNeem，Votivo）、及び、以下の活性化合物：4－{〔（6－プロモピリダー3－イル）メチル〕（2－フルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115644から既知）、4－{〔（6－フルオロピリダー3－イル）メチル〕（2，2－ジフルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115644から既知）、4－{〔（2－クロロ－1，3－チアゾール－5－イル）メチル〕（2－フルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115644から既知）、4－{〔（6－クロロピリダー3－イル）メチル〕（2－フルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115644から既知）、4－{〔（6－クロロピリダー3－イル）メチル〕（2，2－ジフルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115644から既知）、4－{〔（6－クロロピリダー3－イル）メチル〕（メチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115643から既知）、4－{〔（5，6－ジクロロピリダー3－イル）メチル〕（2－フルオロエチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115646から既知）、4－{〔（6－クロロ－5－フルオロピリダー3－イル）メチル〕（シクロプロピル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（WO 2007/115643から既知）、4－{〔（6－クロロピリダー3－イル）メチル〕（シクロプロピル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（EP-A-0539588から既知）、4－{〔（6－クロロピリダー3－イル）メチル〕（メチル）アミノ}フラン－2（5H）－オン（EP-A-0539588から既知）、〔（6－クロロピリジン－3－イル）メチル〕（メチル）オキシド－ λ^4 －スルファニリデンシアナミド（WO 2007/149134から既知）、〔1－（6－クロロピリジン－3－イル）エチル〕（メチル）オキシド－ λ^4 －スルファニリデンシアナミド（WO 2007/149134から既知）、〔（6－トリフルオロメチルピリジン－3－イル）メチル〕（メチル）オキシド－ λ^4 －スルファニリデンシアナミド（WO 2007/095229から既知）、スルホキサフロル（同様に、WO 2007/149134から既知）、11－（4－クロロ－2，6－ジメチルフェニル）－12－ヒドロキシ－1，4－ジオキサ－9－アザジスピロ〔4.2.4〕テトラデカ－11－エン－10－オン（WO 2006/089633から既知）、3－（4’－フルオロ－2，4－ジメチルビフェニル－3－イル）－4－ヒドロキシ－8－オキサ－1－アザスピロ〔4.5〕デカ－3－エン－2－オン（WO 2008/067911から既知）、1－〔2－フルオロ－4－メチル－5－〔（2，2，2－トリフルオロエチル）スルフィニル］フェニル］－3－（トリフルオロメチル）－1H－1，2，4－トリアゾール－5－アミン（WO 2006/043635から既知）、〔（3S，4aR，12R，12aS，12bS）－3－〔（シクロプロピルカルボニル）オキシ〕－6，12－ジヒドロキシ－4，12b－ジメチル－11－オキソ－9－（ピリジン－3－イル）－1，3，4，4a，5，6，6a，12，12a，12b－デカヒドロ－2H，11H－ベンゾ〔f〕ピラノ〔4，3－b〕クロメ

10

20

30

40

50

ン-4-イル]メチルシクロプロパンカルボキシレート(WO 2006/129714から既知)、2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-N-エチル-ベンゼンスルホンアミド(WO 2005/035486から既知)、N-[1-(2,3-ジメチルフェニル)-2-(3,5-ジメチルフェニル)エチル]-4,5-ジヒドロ-2-チアゾールアミン(WO 2008/104503から既知);ペニゲキノロン(penigequinolone)A(EP 2248422から既知、(化合物I))、及び、WO 2009/060015(化合物No. 11)。

【0276】

(INS-25) ここで、殺外部寄生虫薬と一緒に使用される場合の適切な協力剤としては、以下のものを挙げることができる:MGK264(N-オクチルピシクロヘプテンカルボキサミド)、ピペロニルブトキシド(PBO)、及び、ベルブチン;ここで、特に好ましいのは、ピペロニルブトキシド及びMGK264である。

【0277】

これらの群に加えて、混合物又は組合せ施用において、短期間忌避剤(short-term repellents)を使用することも可能である。その例は、以下のものである:DEET(N,N-ジエチル-3-メチルベンズアミド)、イカリジン(1-ピペリジンカルボン酸)、(1S,20S)-2-メチルピペリジニル-3-シクロヘキサ-1-カルボキサミド(SS220)、インダロン(3,4-ジヒドロ-2,2-ジメチル-4-オキソ-2H-ピラン-6-カルボン酸ブチル)、ジヒドロネブタラクトン類、ノートカトン、IR3535(3-[N-ブチル-N-アセチル]-アミノプロピオン酸エチルエステル)、2-エチルヘキサ-1,3-ジオール、(1R,2R,5R)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-5-メチル-シクロヘキサ-1-オール、ベンゼン-1,2-ジカルボン酸ジメチル、ドデカン酸、ウンデカン-2-オン、N,N-ジエチル-2-フェニルアセトアミド、及び、精油、又は、既知忌避作用を有する別の植物成分、例えば、ボルネオール、カリカルペナル、1,8-シネオール(ユーカリプトール)、カルバクロール、 β -シトロネロール、 α -コパエン、クマリン(又は、その合成誘導体、US20120329832から既知)。イカリジン、インダロン及びIR3535(3-[N-ブチル-N-アセチル]-アミノプロピオン酸エチルエステル)は、外部寄生虫に対して使用するのに特に適している。

【0278】

上記で記載した群(INS-1)~群(INS-25)の中で、好ましいのは、混合成分としての以下の群である:(INS-2)、(INS-3)、(INS-4)、(INS-5)、(INS-6)、(INS-17)、(INS-25)。

【0279】

式(I)で表される本発明化合物に対する混合成分としての殺虫活性化合物若しくは殺ダニ活性化合物、協力剤又は忌避剤の特に好ましい例は、アフォキシレイナー、アレスリン、アミトラズ、ピオアレスリン、クロチアニジン、シフルトリン(ベーター)、シハロトリン(ラムダー)、シミアゾール、シベルメトリン(アルファ-、ゼーター)、シフェノトリン、デルタメトリン、デミジトラズ、ジノテフラン、ドラメクチン、エプリノメクチン、エトフェンプロックス、フェンバレレート、フィプロニル、フルアズロン、フルシトリネート、フルメトリン、フルララネル、フルバリネート(タウ-)、イカルジン、イミダクロプリド、イベルメクチン、MGK264、ミルベマイシンオキシム、モキシデクチン、ニテンピラム、ベルメトリン、フェノトリン、ピペロニルブトキシド、ピリプロール、レスメトリン、セラメクチン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、テトラメトリン、チアクロプリドである。

【0280】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物(vector)の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体(例えば、ウイルス類、蠕虫類(worms)、単細胞生物及び細菌類)を病原体保有宿主(植物、動物、ヒトなど)から

10

20

30

40

50

宿主まで運ぶことが可能な節足動物（特に、昆虫又はクモ形類動物）である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る（例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ）、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る（例えば、蚊によるマラリア原虫）。

【0281】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

（１）蚊類

- ・ ハマダラカ（*Anopheles*）： マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ（*Culex*）： 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、蠕虫類の運搬；
- ・ ヤブカ（*Aedes*）： 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患；
- ・ ブユ（*Simuliidae*）： 蠕虫類（特に、回旋糸状虫（*Onchocerca volvulus*））の運搬；

（２）シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

（３）ノミ類： 伝染病、発疹熱；

（４）ハエ類： 睡眠病（トリパノソーマ病）；コレラ、別の細菌性疾患；

（５）ダニ類： ダニ症（*acariosis*）、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎（*TBE*）、クリミア・コンゴ出血熱、流行性発疹チフス、ボレリア症（*borreliosis*）；

（６）マダニ類： ボレリア症（*borellioses*）、例えば、ダットン回帰熱ボレリア（*Borrelia duttoni*）、ダニ媒介脳炎、Ｑ熱（*Coxiella burnetii*）、バベシア症（*Babesia canis canis*）。

【0282】

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

【0283】

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

【0284】

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

【0285】

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

【0286】

工業材料の保護

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

【0287】

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

【0288】

本発明の一実施形態では、本発明の組成物又は製品は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び／又は少なくとも1種類の殺菌剤も含んでいる。

【0289】

さらなる実施形態では、本発明の組成物は、即時使用可能な (ready-to-use) 組成物である。即ち、それは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能である。有用なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、上記で挙げたものを包含する。

10

【0290】

驚くべきことに、本発明の活性成分及び組成物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、本発明の活性成分及び組成物は、単独で、又は、別の活性成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0291】

衛生分野における害虫の防除

式(I)で表される本発明化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内の分野において、衛生の分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間（例えば、住居、工場の通路、オフィス及び車両の客室）において遭遇する昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、本発明の活性成分及び組成物は、単独で使用するか、又は、別の活性成分及び／又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。本発明の活性成分は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

20

【0292】

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

30

40

【0293】

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

【0294】

50

調製方法

本発明の化合物は、当業者には知られている慣習的な方法で調製することができる。

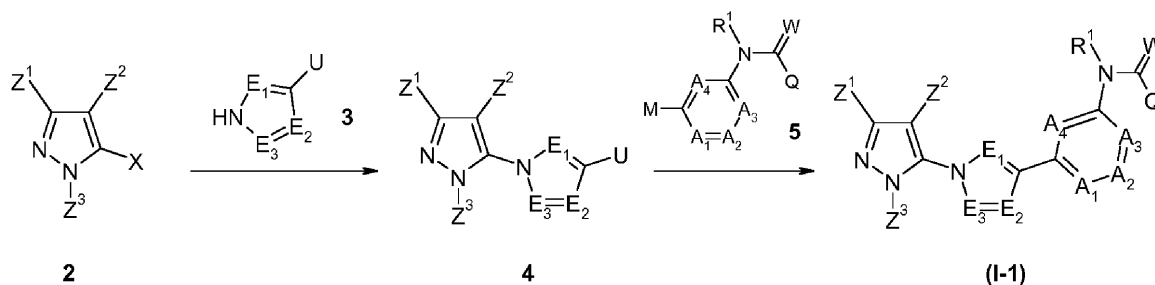
【0295】

反応スキーム1は、本発明の化合物（I-1）に関する一般的な調製方法Aを示している。

【0296】

反応スキーム1

【化27】



10

【0297】

$A_1 - A_4$ 、 Q 、 W 、 R^1 及び $Z^1 - Z^3$ ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。 $E_1 - E_3$ 、炭素及び窒素で構成されている5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環である。 X は、ハロゲンである。 M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである場合、 U は、臭素、ヨウ素又はトリフラートである。 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、 U は、ボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである。

20

【0298】

一般構造（I-1）を有する本発明化合物は、文献から知られている方法で、パラジウムが触媒する反応を用いて、共反応物4及び共反応物5から調製することができる〔例えば、WO 2005/040110； WO 2009/089508〕。一般構造5を有する化合物は、市販されているか、又は、当業者には既知の調製方法で調製することができる。一般構造4を有する化合物は、文献から知られている方法で、芳香族系の求核置換反応（ X = 塩素又はフッ素）〔WO 2007/107470； Tetrahedron Letters 2003, 44, 7629-7632〕によって、又は、遷移金属が触媒する反応（ X = 臭素又はヨウ素）〔WO 2012/003405； WO 2009/158371〕によって、対応する出発物質2及び出発物質3から調製することができる。

30

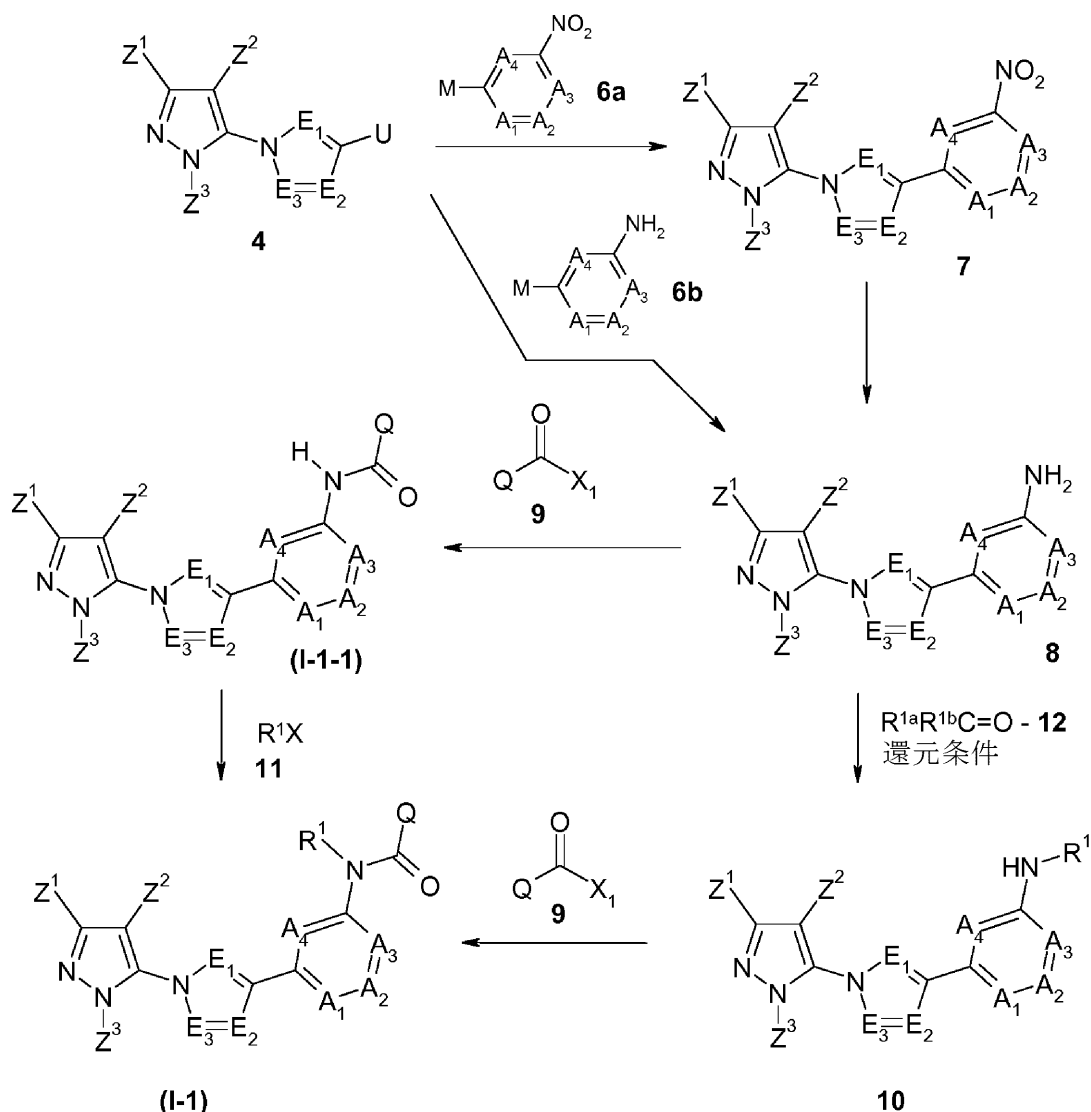
【0299】

あるいは、本発明化合物（I-1）は、一般的な調製方法Bによって調製することができる（反応スキーム2）。

【0300】

反応スキーム2

【化 28】



【0301】

$A_1 - A_4$ 、 Q 、 R^1 及び $Z^1 - Z^3$ ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。 $E_1 - E_3$ 、炭素及び窒素で構成されている5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環を表す。 X は、ハロゲンである； X_1 は、ハロゲン又はOHである。 M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである場合、 U は、臭素、ヨウ素又はトリフラートである。 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、 U は、ボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである。

【0302】

一般構造 (I-1) 及び一般構造 (I-1-1) を有する本発明化合物は、文献から知られているペプチドカップリング法と同様にして、出発物質 8 又は出発物質 10 から、それらを 9 と反応させて調製することができる [例えば、WO 2010/051926、又は、WO 2010/133312]。一般構造 8 を有する化合物は、文献から知られている方法と同様にして、一般構造 7 を有する化合物から、還元によって [WO 2012/080376]、又は、一般構造 4 から、直接的なカップリング経路によって、調製することができる。一般構造 7 を有する化合物は、文献から知られている方法と同様にして、パラジウムが触媒する反応を用いて調製することができる [WO 2005/040110； WO 2009/089508]。一般構造 (I-1) を有する本発明化合物は、構造 (I-1-1) を有するアミドを、好ましくは塩基性反応助剤の存在下で、アルキル化試薬 11 を用いたアルキル化反応（これは、当業者には、充分によく知られている）に付すことによって、製造することができる。あるいは、文献 [WO 2012/08

0376] から知られているペプチドカップリング法と同様にして一般構造 (I-1) を有する本発明化合物を後で得るために、還元的な条件下で、一般構造 8 を有する中間体を適切に置換されている (R^{1a} 、 R^{1b}) ケトン又はアルデヒド 12 と反応させて、一般構造 10 を有する化合物を生成させることできる [WO 2012/080376]。

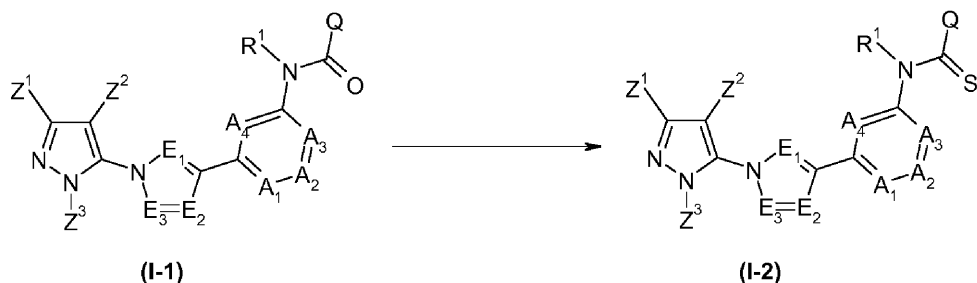
【0303】

一般構造 (I-2) を有する本発明化合物は、反応スキーム 3 に示されている調製方法 C によって、合成することができる。

【0304】

反応スキーム 3

【化 29】



10

【0305】

$A_1 - A_4$ 、 Q 、 R^1 及び $Z^1 - Z^3$ ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。 $E_1 - E_3$ 、炭素及び窒素で構成されている 5 員環は、T のもとで定義されている 5 員ヘテロ環を表す。

20

【0306】

一般構造 (I-2) を有する本発明化合物は、文献から知られている調製方法と同様にして、一般構造 (I-1) を有する化合物から調製することができる [WO 2012/056372; WO 2003/066050]。

【0307】

一般構造 2 を有する化合物は、市販されているか、又は、当業者には知られている調製方法によって、若しくは、これらの調製方法 [WO 2010/051926; WO 2011/131615; WO 2006/018725; WO 2012/065932; WO 2007/077961; US 2012-0115903; WO 2010/017902; WO 2010/127856; Tetrahedron Letters 2011, 44, 8451-8457] と同様にして、調製することができる。

30

【0308】

一般構造 3 を有する化合物は、市販されているか、又は、当業者には知られている調製方法によって、若しくは、これらの調製方法 [WO 2009/155527; WO 2007/138072] と同様にして、調製することができる。

【0309】

一般構造 5 を有する化合物は、市販されているか、又は、当業者には知られている調製方法によって、若しくは、これらの調製方法 [WO 2005/041904] と同様にして、調製することができる。

40

【0310】

一般構造 6 を有する化合物は、市販されているか、又は、当業者には知られている調製方法によって、若しくは、これらの調製方法 [Journal of Organic Chemistry 2013, 78 (5), 1923-1933] と同様にして、調製することができる。

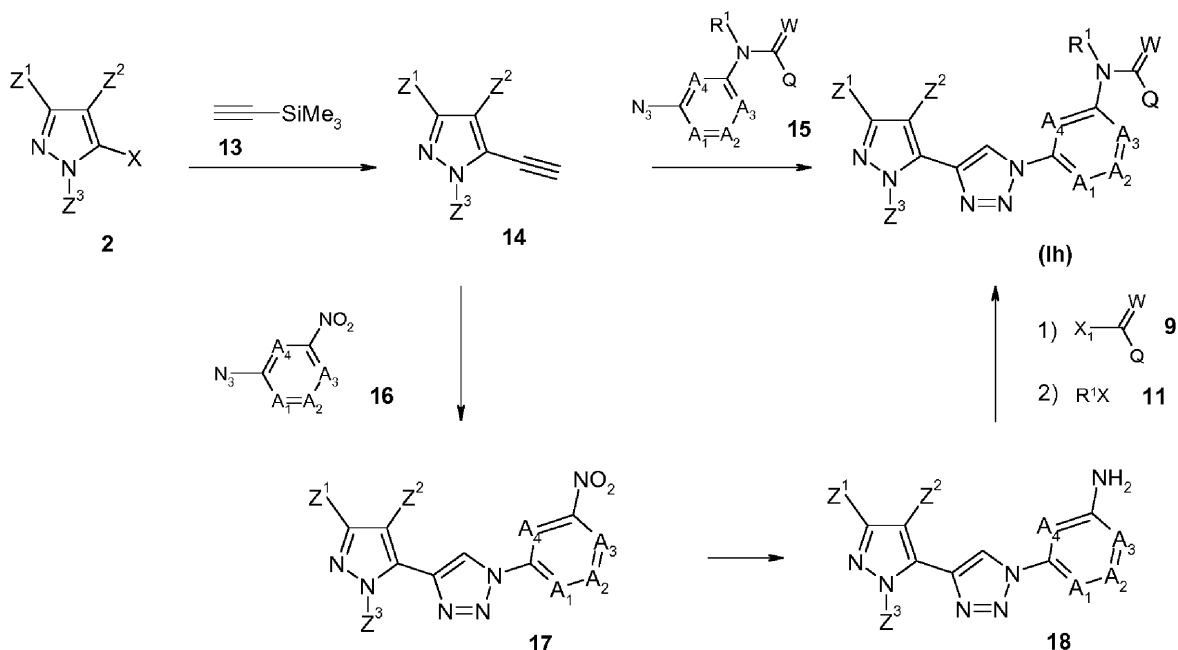
【0311】

反応スキーム 4 は、本発明化合物 (Ih) に関する一般的な調製方法 D を示している。

【0312】

50

反応スキーム 4
【化 30】



【0313】

上記で記載されている式 2、式 14、式 15、式 16、式 17 及び式 18 における Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 ラジカルは、それぞれ、一般式 (Ih) 又は一般式 (I) に関するラジカルの定義によって上記で概括的に定義されているとおりである；

このことは、特に、式 (Ih) のラジカルの好ましい定義又は特に好ましい定義に当てはまる。

【0314】

脱離基 $X =$ ハロゲン又は $X =$ メシラートを有するピラゾール (2) から出発し、場合により遷移金属触媒を用いて、対応するピラゾールアセチレン 14 を調製することができる [US 2011/275628A]。

【0315】

一般構造 17 を有する化合物は、適切な (ヘタ) アリールアジド 16 を用いて、アセチレン 14 を [3+2] 付加環化に付すことによって合成し [「Tetrahedron Letters, 2006, 47, (19) 3209-3212」と同様に実施する]、そして、その後、還元してアミン/アニリン 18 とするか、又は、本発明化合物 (Ih) に変換させる。あるいは、本発明化合物 (Ih) は、[3+2] 付加環化の過程において、適切な (ヘタ) アリールアジド 15 を用いて、アセチレン 14 から直接合成することができる。

【0316】

アルコール基を酸化するための酸化剤は知られている (cf.、例えば、以下のものに記載されている酸化試薬: Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds, Mijs, de Jonge, Plenum Verlag, New York, 1986; Manganese Compounds as Oxidizing Agents in Organic Chemistry, Arndt, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1981; The Oxidation of Organic Compounds by Permanganate Ion and Hexavalent Chromium, Lee, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1980)。酸化は、例えば、過マンガン酸塩 (例えば、過マンガン酸カリウム)、金属酸化物 (例えば、二酸化マンガン、酸化クロム；これらは、例えば、コリンズ試薬と

10

20

30

40

50

して、ジピリジニクロム(VI)オキシドの中で使用される(c f. J. C. Collins et al., Tetrahedron Lett. 30, 3363-3366, 1968))の存在下で、実施することができる。同様に、以下のものの存在下: クロロクロム酸ピリジニウム(例えば、コーリー試薬)(c f. 同様に: R. O. Hutchins et al., Tetrahedron Lett. 48, 4167-4170, 1977; D. Landini et al. Synthesis 134-136, 1979)、又は、四酸化ルテニウム(c f. S.-I. Murahashi, N. Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amides, β -Lactams, Phenols and Hydrocarbons, in: Modern Oxidation Methods, Baeckvall, Jan-Erling (Eds.), Wiley-VCH-Verlag GmbH & Co. KGaA, 2004)。同様に適しているのは、超音波が誘発する酸化反応、及び、過マンガン酸カリウムの使用である(c f. J. Yamawaki et al., Chem. Lett. 3, 379-380, 1983)。

10

20

30

40

50

【0317】

保護基(PG)をデブロッキング/脱離させるために、文献に記載されている方法によって、任意の適切な既知酸性反応助剤又は塩基性反応助剤を使用することができる。アミノ基に対してカルバメートタイプの保護基が使用されている場合、酸性反応助剤を使用するのが好ましい。t-ブチルカルバメート保護基(BOC基)が使用されている場合、例えば、鉱酸(例えば、塩酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸)又は有機酸(例えば、安息香酸、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸塩又はトルエンスルホン酸塩)と適切な希釈剤(例えば、水、及び/又は、有機溶媒、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル、エタノール又はメタノール)の混合物を使用する。塩酸又は酢酸と水及び/又は有機溶媒(例えば、酢酸エチル)の混合物が好ましい。

【0318】

一部の反応及び調製方法が、希釈剤又は溶媒と塩基性又は酸性の反応助剤の存在下で特に効率的に実施可能であるということは知られている。同様に、希釈剤と溶媒の混合物も使用可能である。そのような希釈剤及び溶媒は、有利には、その反応混合物が調製方法全体を通して良好に攪拌可能な状態にある様な量で使用する。

【0319】

本発明による調製方法を実施するのに有用な希釈剤又は溶媒には、原則として、当該特定の反応条件下で不活性である全ての有機溶媒が包含される。その例としては、以下のものを挙げることができる: ハロ炭化水素類(hydrohalocarbons)(例えば、クロロ炭化水素類(hydrochlorocarbons)、例えば、テトラエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン)、アルコール類(例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール)、エーテル類(例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、n-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、並びに、エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドのポリエーテル類)、アミン類(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、及び、テトラメチレンジアミン)、ニトロ炭化水素類(例えば、ニトロメタン、ニトロエタ

ン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、*o*-ニトロトルエン）、ニトリル類（例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、*m*-クロロベンゾニトリル）、テトラヒドロチオフェンジオキシド、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン類（例えば、ジメチルスルホン、ジエチルスルホン、ジプロピルスルホン、ジブチルスルホン、ジフェニルスルホン、ジヘキシルスルホン、メチルエチルスルホン、エチルプロピルスルホン、エチルイソブチルスルホン、及び、ペンタメチレンスルホン）、脂肪族、シクロ脂肪族又は芳香族の炭化水素類（例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナン、及び、工業用炭化水素類）、さらに、沸点が例えば40℃～250℃の範囲内にある成分を含んでいる、いわゆる、「ホワイトスピリット」、シメン、沸騰範囲が70℃～190℃の範囲内にある石油フラクション、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル類（例えば、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル、酢酸イソブチル、炭酸ジメチル、炭酸ジブチル、及び、炭酸エチレン）、アミド類（例えば、ヘキサメチレンホスホルアミド、ホルムアミド、*N*-メチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジプロピルホルムアミド、*N*, *N*-ジブチルホルムアミド、*N*-メチルピロリジン、*N*-メチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2(1*H*)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジンジオン、*N*-ホルミルピペリジン、*N*, *N*'-1, 4-ジホルミルピペラジン）、及び、ケトン類（例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン）。

10

20

【0320】

本発明による調製方法を実施するために使用される塩基性反応助剤は、適切な任意の酸結合剤であり得る。その例としては、以下のものを挙げることができる：アルカリ土類金属化合物又はアルカリ金属化合物（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウム及びバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物及び炭酸塩）、アミジン塩基又はグアニジン塩基（例えば、7-メチル-1, 5, 7-トリアザビシクロ[4. 4. 0]デカ-5-エン(MTBD)；ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン(DBN)、ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン(DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン(DBU)、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン(CyTBG)、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン(CyTMG)、*N*, *N*, *N*, *N*-テトラメチル-1, 8-ナフタレンジアミン、ペンタメチルピペリジン)、並びに、アミン、特に、第3級アミン（例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、*N*, *N*-ジメチルアニリン、*N*, *N*-ジメチルトルイジン、*N*, *N*-ジメチル-*p*-アミノピリジン、*N*-メチルピロリジン、*N*-メチルピペリジン、*N*-メチルイミダゾール、*N*-メチルピラゾール、*N*-メチルモルホリン、*N*-メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、 α -ピコリン、 β -ピコリン、イソキノリン、ピリミジン、アクリジン、*N*, *N*, *N*', *N*'-テトラメチレンジアミン、*N*, *N*, *N*', *N*'-テトラエチレンジアミン、キノキサリン、*N*-プロピルジイソプロピルアミン、*N*-エチルジイソプロピルアミン、*N*, *N*'-ジメチルシクロヘキシルアミン、2, 6-ルチジン、2, 4-ルチジン、又は、トリエチルジアミン）。

30

40

【0321】

本発明による調製方法を実施するために使用される酸性反応助剤には、全ての鉱酸（例えば、ハロゲン化水素酸、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸又はヨウ化水素酸、及び、さらに、硫酸、リン酸、亜リン酸、硝酸）、ルイス酸（例えば、塩化アルミニウム(III)、三フッ化ホウ素又はそのエーテラート、塩化チタン(V)、塩化スズ(V)

50

）、及び、有機酸（例えば、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、マロン酸、乳酸、シュウ酸、フマル酸、アジピン酸、ステアリン酸、酒石酸、オレイン酸、メタンスルホン酸、安息香酸、ベンゼンスルホン酸、又は、パラートルエンスルホン酸）が包含される。

【0322】

当該反応スキームにおいて保護基が意図されている場合、一般的に知られている任意の保護基を使用することができる。特に、「Protective Groups in Organic Synthesis; John Wiley & Sons, Inc. 1999, "Protection for the hydroxyl group including 1, 2- and 1, 3-diols"」においてGreene T. W.、Wuts P. G. Wによって記載されている保護基。

10

【0323】

適しているさらなる保護基は、さらにまた、以下のものである：

置換されているメチルエーテルタイプの保護基（例えば、メトキシメチルエーテル（MOM）、メチルチオメチルエーテル（MTM）、（フェニルジメチルシリル）メトキシメチルエーテル（SNOM-OR）、ベンジルオキシメチルエーテル（BOM-OR）、パラメトキシベンジルオキシメチルエーテル（PMBM-OR）、パラニトロベンジルオキシメチルエーテル、オルトニトロベンジルオキシメチルエーテル（NBOM-OR）、（4-メトキシフェノキシ）メチルエーテル（p-AOM-OR）、グアイアコールメチルエーテル（GUM-OR）、t-ブトキシメチルエーテル、4-ペンチルオキシメチルエーテル（POM-OR）、シリルオキシメチルエーテル、2-メトキシエトキシメチルエーテル（MEM-OR）、2, 2, 2-トリクロロエトキシメチルエーテル、ビス（2-クロロエトキシ）メチルエーテル、2-（トリメチルシリル）エトキシメチルエーテル（SEM-OR）、メトキシメチルエーテル（MM-OR））；

20

置換されているエチルエーテルタイプの保護基（例えば、1-エトキシエチルエーテル（EE-OR）、1-（2-クロロエトキシ）エチルエーテル（CEE-OR）、1-〔2-（トリメチルシリル）エトキシ〕エチルエーテル（SEE-OR）、1-メチル-1-メトキシエチルエーテル（MIP-OR）、1-メチル-1-ベンジルオキシエチルエーテル（MBE-OR）、1-メチル-1-ベンジルオキシ-2-フルオロエチルエーテル（MIP-OR）、1-メチル-1-フェノキシエチルエーテル、2, 2-トリクロロエチルエーテル、1, 1-ジアニル-2, 2, 2-トリクロロエチルエーテル（DATE-OR）、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-フェニルイソプロピルエーテル（HIP-OR）、2-トリメチルシリルエチルエーテル、2-（ベンジルチオ）エチルエーテル、2-（フェニルセレニル）エチルエーテル）、エーテル（例えば、テトラヒドロピラニルエーテル（THP-OR）、3-ブromoテトラヒドロピラニルエーテル（3-BrTHP-OR）、テトラヒドロチオピラニルエーテル、1-メトキシシクロヘキシルエーテル、2-ピコリルエーテル、4-ピコリルエーテル、3-メチル-2-ピコリル-N-オキシドエーテル、2-キノリルメチルエーテル（Qm-OR）、1-ピレニルメチルエーテル、ジフェニルメチルエーテル（DPM-OR）、パラ、パラ'-ジニトロベンズヒドリルエーテル（DNB-OR）、5-ジベンゾスベリルエーテル、トリフェニルメチルエーテル（Tr-OR）、アルファ-ナフチルジフェニルメチルエーテル、パラメトキシフェニルジフェニルメチルエーテル（MMTr-OR）、ジ（パラメトキシフェニル）フェニルメチルエーテル（DMTr-OR）、トリ（パラメトキシフェニル）フェニルメチルエーテル（TMTr-OR）、4-（4'-ブromoフェナシルオキシ）フェニルジフェニルメチルエーテル、4, 4', 4"-トリス（4, 5-ジクロロフタルイミドフェニル）メチルエーテル（CPTTr-OR）、4, 4', 4"-トリス（ベンゾイルオキシフェニル）メチルエーテル（TBTTr-OR）、4, 4'-ジメトキシ-3"-〔N-（イミダゾリルメチル）〕トリチルエーテル（IDTr-OR）、4, 4'-ジメトキシ-3"-〔N-（イミダゾリルエチル）カルバモイル〕トリチルエーテル（IETTr-OR）、1, 1-ビス（4-メトキシフェニル）-1'-ピレニルメチルエーテル（Bmpm-OR）、9-アントリルエーテル、9-（9-フェニル）キサントニルエー

30

40

50

テル (p i x y l - O R)、9 - (9 - フェニル - 10 - オキソ) アントリル (トリクロンエーテル)、4 - メトキシテトラヒドロピラニルエーテル (M T H P - O R)、4 - メトキシテトラヒドロチオピラニルエーテル、4 - メトキシテトラヒドロチオピラニル S、S - ジオキシド、1 - [(2 - クロロ - 4 - メチル) フェニル] - 4 - メトキシピペリジン - 4 - イルエーテル (C T M P - O R)、1 - (2 - フルオロフェニル) - 4 - メトキシピペリジン - 4 - イルエーテル (F p m p - O R)、1, 4 - ジオキサ - 2 - イルエーテル、テトラヒドロフラニルエーテル、テトラヒドロチオフラニルエーテル、2, 3, 3 a, 4, 5, 6, 7, 7 a - オクタヒドロ - 7, 8, 8 - トリメチル - 4, 7 - メタンベンゾフラン - 2 - イルエーテル (M B F - O R)、*t* - ブチルエーテル、アリルエーテル、プロパルギルエーテル、パラ - クロロフェニルエーテル、パラ - メトキシフェニルエーテル、パラ - ニトロフェニルエーテル、パラ - 2, 4 - ジニトロフェニルエーテル (D N P - O R)、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニルエーテル、ベンジルエーテル (B n - O R)) ;

置換されているベンジルエーテルタイプの保護基 (例えば、パラ - メトキシベンジルエーテル (M P M - O R)、3, 4 - ジメトキシベンジルエーテル (D M P M - O R)、オルト - ニトロベンジルエーテル、パラ - ニトロベンジルエーテル、パラ - ハロベンジルエーテル、2, 6 - ジクロロベンジルエーテル、パラ - アミノアシルベンジルエーテル (P A B - O R)、パラ - アジドベンジルエーテル (A z b - O R)、4 - アジド - 3 - クロロベンジルエーテル、2 - トリフルオロメチルベンジルエーテル、パラ - (メチルスルフィニル) ベンジルエーテル (M s i b - O R)) ;

シリルエーテルタイプの保護基 (例えば、トリメチルシリルエーテル (T M S - O R)、トリエチルシリルエーテル (T E S - O R)、トリイソプロピルシリルエーテル (T I P S - O R)、ジメチルイソプロピルシリルエーテル (I P D M S - O R)、ジエチルイソプロピルシリルエーテル (D E I P S - O R)、ジメチルヘキシルシリルエーテル (T D S - O R)、*t* - ブチルジメチルシリルエーテル (T B D M S - O R)、*t* - ブチルジフェニルシリルエーテル (T B D P S - O R)、トリベンジルシリルエーテル、トリ - パラ - キシルシリルエーテル、トリフェニルシリルエーテル (T P S - O R)、ジフェニルメチルシリルエーテル (D P M S - O R)、ジ - *t* - ブチルメチルシリルエーテル (D T B M S - O R)、トリス (トリメチルシリル) シリルエーテル (シシルエーテル)、ジ - *t* - ブチルメチルシリルエーテル (D T B M S - O R)、トリス (トリメチルシリル) シリルエーテル (シシルエーテル)、(2 - ヒドロキシシチル) ジメチルシリルエーテル (H S D M S - O R)、(2 - ヒドロキシシチル) ジイソプロピルシリルエーテル (H S D I S - O R)、*t* - ブチルメトキシフェニルシリルエーテル (T B M P S - O R)、*t* - ブトキシジフェニルシリルエーテル (D P T B O S - O R)) ;

エステルタイプの保護基 (例えば、ギ酸エステル、ベンゾイルギ酸エステル、酢酸エステル (A c - O R)、クロロ酢酸エステル、ジクロロ酢酸エステル、トリクロロ酢酸エステル、トリフルオロ酢酸エステル (T F A - O R)、メトキシ酢酸エステル、トリフェニルメトキシ酢酸エステル、フェノキシ酢酸エステル、パラ - クロロフェノキシ酢酸エステル、フェニル酢酸エステル、ジフェニル酢酸エステル (D P A - O R)、ニコチン酸エステル、3 - フェニルプロピオン酸エステル、4 - ペントエートエステル、4 - オキソペントエートエステル (レブリン酸エステル) (L e v - O R)、4, 4 - (エチレンジチオ) ペンタン酸エステル (L e v S - O R)、5 - [3 - ビス (4 - メトキシフェニル) ヒドロキシメトキシフェノキシ] レブリン酸エステル、ピバロエートエステル (P v - O R)、1 - アダマンタノエートエステル、クロトン酸エステル、4 - メトキシクロトン酸エステル、安息香酸エステル (B z - O R)、パラ - フェニル安息香酸エステル、2, 4, 6 - トリメチル安息香酸エステル (メシトエート)、4 - (メチルチオメトキシ) 酪酸エステル (M T M B - O R)、2 - (メチルチオメトキシメチル) 安息香酸エステル (M T M T - O R)) ;

炭酸エステルタイプの保護基 (例えば、炭酸メチル、炭酸メトキシメチル、炭酸 9 - フルオレニルメチル (F m o c - O R)、炭酸エチル、炭酸 2, 2, 2 - トリクロロエチル

10

20

30

40

50

(T r o c - O R)、炭酸 1, 1-ジメチル-2, 2, 2-トリクロロエチル (T C B O C - O R)、炭酸 2-(トリメチルシリル)エチル (T M S - O R)、炭酸 2-(フェニルスルホニル)エチル (P s - O R)、炭酸 2-(トリフェニルホスホニオ)エチル (P e o c - O R)、炭酸 t-ブチル (B o c - O R)、炭酸イソブチル、炭酸ビニル、炭酸アリル (A l l o c - O R)、炭酸パラ-ニトロフェニル、炭酸ベンジル (Z - O R)、炭酸パラ-メトキシベンジル、炭酸 3, 4-ジメトキシベンジル、炭酸オルト-ニトロベンジル、炭酸パラ-ニトロベンジル、炭酸 2-ダンシルエチル (D n s e o c - O R)、炭酸 2-(4-ニトロフェニル)エチル (N p e o c - O R)、炭酸 2-(2, 4-ジニトロフェニル)エチル (D n p e o c)) ; 及び、

スルフェートタイプの保護基 (例えば、アリルスルホネート (A l s - O R)、メタン
スルホネート (M s - O R)、ベンジルスルホネート、トシラート (T s - O R)、2-
[(4-ニトロフェニル)エチル]スルホネート (N p e s - O R)) 。

10

【0324】

本発明による調製方法において接触水素化を実施するのに適した触媒は、慣習的な全ての水素化触媒、例えば、白金触媒 (例えば、白金シート、白金スポンジ、白金黒、コロイド状白金、酸化白金、白金ワイヤー)、パラジウム触媒 (例えば、パラジウムスポンジ、パラジウム黒、酸化パラジウム、パラジウム-炭、コロイド状パラジウム、パラジウム硫酸バリウム、パラジウム炭酸バリウム、水酸化パラジウム)、ニッケル触媒 (例えば、還元ニッケル、酸化ニッケル、ラネーニッケル)、ルテニウム触媒、コバルト触媒 (例えば、還元コバルト、ラネーコバルト)、銅触媒 (例えば、還元銅、ラネー銅、ウルマン銅) などである。好ましくは、貴金属触媒 (例えば、白金及びパラジウム又はルテニウム触媒) (これらは、適切な支持体 (例えば、炭素又はシリコン) に担持してもよい)、ロジウム触媒 (例えば、トリフェニルホスフィンの存在下におけるトリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I) クロリド)) を使用する。さらに、「キラル水素化触媒」 (例えば、キラルジホスフィンリガンドを含んでいるキラル水素化触媒、例えば、(2 S, 3 S)-(-)-2, 3-ビス (ジフェニルホスフィノ) ブタン [(S, S)-キラホス]、又は、(R)-(+)-2, 2'-若しくは (S)-(-)-2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフタレン [R(+)-BINAP、及び、S(-)-BINAP]) を使用することも可能であり、それによって、異性体混合物の中の 1 種類の異性体の割合が増大されるか、又は、別の異性体の形成が実質的に完全に防止される。

20

30

【0325】

本発明による化合物の塩は、標準的な方法によって調製される。代表的な酸付加塩は、例えば、無機酸 (例えば、硫酸、塩酸、臭化水素酸、リン酸) 又は有機カルボン酸 (例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸、クエン酸、コハク酸、酪酸、乳酸、ギ酸、フマル酸、マレイン酸、マロン酸、ショウノウ酸、シュウ酸、フタル酸、プロピオン酸、グリコール酸、グルタル酸、ステアリン酸、サリチル酸、ソルビン酸、酒石酸、ケイ皮酸、吉草酸、ピクリン酸、安息香酸) 又は有機スルホン酸 (例えば、メタンスルホン酸及び 4-トルエンスルホン酸) との反応によって形成される酸付加塩である。

【0326】

一般式 (I) で表される化合物が下記塩を形成するのに適した構造要素を有している場合、有機塩基 (例えば、ピリジン又はトリエチルアミン) から形成される本発明化合物の塩又は無機塩基 (例えば、ナトリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム又はバリウムの水素化物、水酸化物又は炭酸塩) から形成される本発明化合物の塩も、代表的な塩である。

40

【0327】

ヘテロ環式 N-オキシド及び t-アミンを調製するための合成方法は、知られている。それらは、過酸 (例えば、過酢酸及びメタークロロ過安息香酸 (M C P B A)、過酸化水素)、アルキルヒドロペルオキシド (例えば、t-ブチルヒドロペルオキシド)、過ホウ酸ナトリウム及びジオキシラン (例えば、ジメチジオキシラン) を用いて得ることができる。これらの方法は、例えば、T. L. G i l c h r i s t (「C o m p r e h e n s i

50

ve Organic Synthesis, vol. 7, p. 748-750, 1992, S. V. Ley, (Ed.), Pergamon Press」、M. Tisler, B. Stanovnik (「Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, p. 18-20, 1984, A. J. Boulton, A. McKillop, (Eds.), Pergamon Press」、M. R. Grimmett, B. R. T. Keene (「Heterocyclic Chemistry, vol. 43, p. 149-163, 1988, A. R. Katritzky, (Ed.), Academic Press」の中の「Advances」、M. Tisler, B. Stanovnik (「Heterocyclic Chemistry, vol. p, S. 285-291, 1968, A. R. Katritzky, A. J. Boulton (Eds.), Academic Press」の中の「Advances」、G. W. H. Cheeseman, E. S. G. Werstiuk (「Heterocyclic Chemistry, vol. 22, p. 390-392, 1978, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, (Eds.), Academic Press」の中の「Advances」)によって記述されている。

10

【実施例】

【0328】

調製実施例

¹H NMRデータ

20

¹H-NMRデータは、フローセル（容積60μL）が装備されている「Bruker Avance 400」又は1.7mm cryo-CPTCIサンプルヘッドが装備されている「Bruker AVIII 400」又は5mm cryo-TCIサンプルヘッドが装備されている「Bruker AVII 600（600.13MHz）」又は5mm cryo-CPMNPサンプルヘッドが装備されている「Bruker AVIII 600（601.6MHz）」を用いて、記録した。これは、対照標準（0.0ppm）として、テトラメチルシランを使用し、及び、重水素化溶媒として、CD₃CN、CDCl₃又はD₆-DMSOを使用して、実施した。

【0329】

N- { 3 - [2' - メチル - 5' - (ペンタフルオロエチル) - 4' - (トリフルオロメチル) - 2' H - 1, 3' - ビピラゾール - 4 - イル] フェニル } イソニコチンアミド

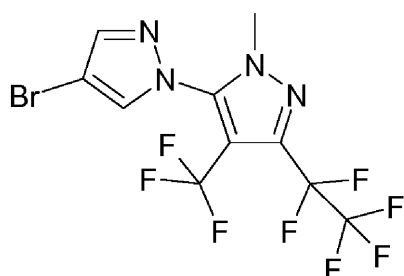
30

の合成

段階 1

4 - ブロモ - 2' - メチル - 5' - (ペンタフルオロエチル) - 4' - (トリフルオロメチル) - 2' H - 1, 3' - ビピラゾール

【化31】



40

【0330】

8g (27.9mmol) の 5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール (Nippon Kagaku Kaishi, 1985, (10), 1995-2000)、4.11g (27.9mmol) の 4 - ブロモピラゾール及び7.73g (55.9mmol) の炭酸カリウムを140mLのTHFの中で環流しながら12時間攪拌した。次いで、炭酸カリウムを濾

50

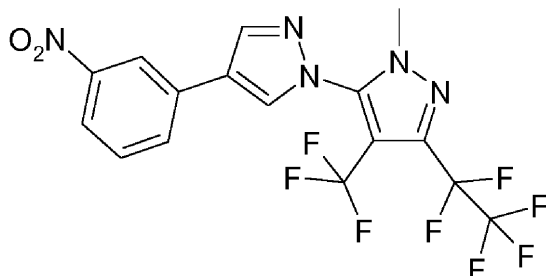
過し、溶媒をロータリーエバポレーター上で留去し、その残渣をシリカゲル（シクロヘキサン／酢酸エチル 勾配）を使用するクロマトグラフィーに付した。6.83 g（理論値の55.3%）が蠟状の固体として単離された。

【0331】

段階2

2'-メチル-4-(3-ニトロフェニル)-5'-(ペンタフルオロエチル)-4'-
-(トリフルオロメチル)-2'H-1,3'-ビピラゾール

【化32】



10

【0332】

110 mLの1,4-ジオキサンに、段階1からの5.5 g（13.3 mmol）のビピラゾール及び2.22 g（13.3 mmol）の3-ニトロフェニルボロン酸を最初に装入し、0.98 g（1.33 mmol）の1,1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（II）クロリド及び86.5 mLの2 M Na_2CO_3 水溶液を添加した。その混合物を、変換が完了するまで100℃で攪拌した。その反応混合物を冷却した後、その全混合物を、ロータリーエバポレーター上でシリカゲルで濃縮し、次いで、シリカゲル（シクロヘキサン／酢酸エチル 勾配）を使用するクロマトグラフィーに付した。5.21 g（理論値の78.4%）が無色の固体として得られた。

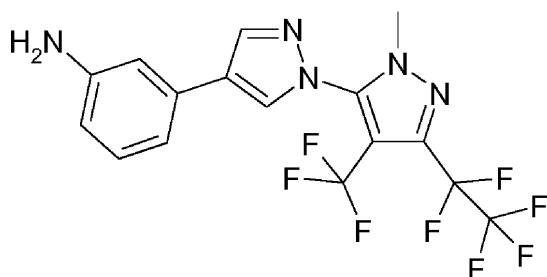
20

【0333】

段階3

N-{3-[2'-メチル-5'-(ペンタフルオロエチル)-4'-(トリフルオロ
メチル)-2'H-1,3'-ビピラゾール-4-イル]アニリン

【化33】



30

【0334】

段階2からの4.9 g（10.7 mmol）のニトロ化合物を36 mLのイソプロパノールに溶解させ、室温で、6.3 g（27.9 mmol）の塩化スズ（II）二水和物を添加した。その反応混合物を0℃まで冷却し、次いで、9 mLの濃HClを滴下して加え、次いで、その混合物を環流しながら2時間攪拌した。当該反応が終了した後、その反応混合物をロータリーエバポレーター上で体積が3分の2になるまで濃縮し、次いで、500 mLの水を添加し、次いで、その水性混合物を、30% NaOHを用いて、pH 8-9に調節した。その水性混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出し、その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、濃縮し、その残渣をシリカゲル（シクロヘキサン／酢酸エチル 勾配）を使用するクロマトグラフィーに付した。3.2 g（理論値の68.2%）の黄色がかった油状物が得られた。

40

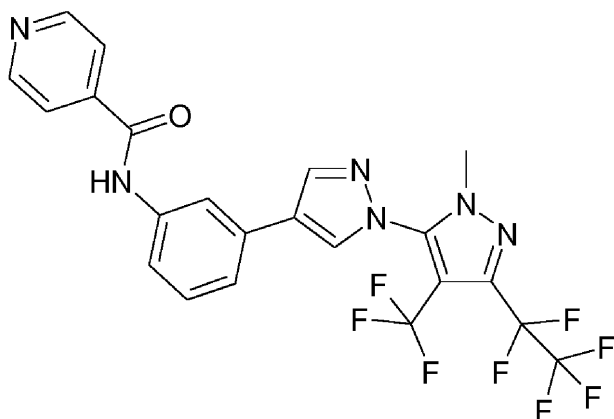
【0335】

50

段階 4

N- { 3 - [2' - メチル - 5' - (ペンタフルオロエチル) - 4' - (トリフルオロメチル) - 2' H - 1 , 3' - ビピラゾール - 4 - イル] - フェニル } イソニコチンアミ
ド

【化 3 4】



10

【0 3 3 6】

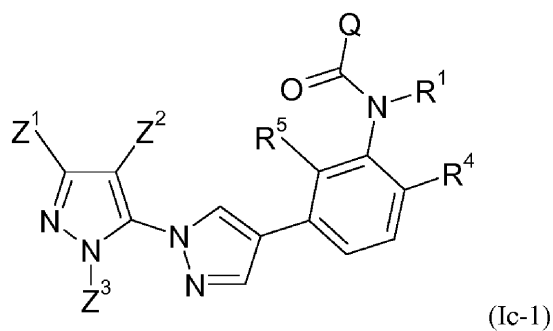
段階 3 からの 3 0 0 m g (0 . 7 m m o l) のアニリンを 2 m L の T H F に溶解させ、
1 2 6 m g (0 . 7 m m o l) の塩化イソニコチン塩酸塩及び 8 6 m g (0 . 8 4 m m
o l) のトリエチルアミンを室温で添加し、その混合物を、T L C でモニタリングし、変
換が完了するまで環流しながら攪拌した。冷却した後、5 m L の水を添加し、その混合物
をジクロロメタンで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、
濾過し、濃縮し、その残渣をシリカゲル (シクロヘキサン / 酢酸エチル 勾配) を使用する
クロマトグラフィーに付した。3 0 0 m g (理論値の 8 0 . 2 %) の目標化合物が黄色
がかった油状物として得られた。

20

【0 3 3 7】

上記で記載した調製方法を用いて、表 1 a 、表 1 b 及び表 2 に記載されている化合物を
調製した。

【表 1】
表 1 a



10

式 (Ic-1) で表される本発明の化合物は、一般式 (Ic) [式中、 $W = O$, $A_1 = A_2 = CH$, $A_3 = CR^4$, $A_4 = CR^5$ 及び $R^6 = H$ (即ち、 $n = 0$)] で表される化合物である

Ex. No.	Z^1	Z^2	Z^3	R^1	R^4	R^5	Q
1-001	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	4-ヒ°リジ°ニル
1-002	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	シクロプロピ°ル
1-003	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	4-F-フェニル
1-004	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3-F-4-ヒ°リジ°ニル
1-005	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3-Cl-2-ヒ°リジ°ニル
1-006	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2-Cl-4-ヒ°リジ°ニル
1-007	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	CF ₃ CH ₂ -
1-008	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	エチル
1-009	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	CHF ₂ CF ₂ -
1-010	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	フェニル
1-011	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2,6-Cl ₂ -4-ヒ°リジ°ニル
1-012	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2-F-フェニル
1-013	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3-F-フェニル
1-014	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3,5-F ₂ -フェニル
1-015	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2,6-F ₂ -フェニル
1-016	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3-チオフェニル

20

30

40

1-017	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2-チオフェニル
1-018	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	3-Cl-2-チオフェニル
1-019	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1-メチル-4- ヒ°ラソ°リル
1-020	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	F	3-Cl-2-ヒ°リジ°ニル
1-021	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-Cl-2-ヒ°リジ°ニル
1-022	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F-フェニル
1-023	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	フェニル
1-024	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-ヒ°リジ°ニル
1-025	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-ヒ°リジ°ニル
1-026	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	フェニル
1-027	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-F-フェニル
1-028	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	2-Cl-3-ヒ°リジ°ニル
1-029	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1-CN- シクロプ°ロヒ°ル
1-030	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1-Cl- シクロプ°ロヒ°ル
1-031	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1-オキサゾ°リル
1-032	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-Cl- シクロプ°ロヒ°ル
1-033	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	CHF ₂ CF ₂ -
1-034	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-ヒ°リミジ°ニル
1-035	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-Me-4-ヒ°ラソ°リル
1-036	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-ヒ°リミジ°ニル
1-037	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	F	H	4-F-フェニル
1-038	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F-フェニル
1-039	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	4-F-フェニル
1-040	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-ヒ°リジ°ニル
1-041	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-チオフェニル
1-042	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-MeO-フェニル
1-043	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Cl-6-Me-4- ヒ°リジ°ニル

10

20

30

40

1-044	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-Me-3-tBu-4-NO ₂ -5-ヒ°ラソ°リル
1-045	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-Cl-ヘ°ソ°チオフェン-2-イル
1-046	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(1, 1-ジ°メチル)-2-フルオロエチル
1-047	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	シス/トランス-4-MeO-シクロヘキサ-1-イル
1-048	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	MeOCH ₂ -
1-049	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-チオフェニル
1-050	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-CF ₃ -4-F-フェニル
1-051	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2,6-(MeO) ₂ -フェニル
1-052	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-1-メチルブ°ロヒ°ル
1-053	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-Me-シクロヘキサ-1-イル
1-054	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-(Me ₂ N)-フェニル
1-055	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	シクロブ°ロヒ°ル
1-056	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2,4,6-(iPr) ₃ -フェニル
1-057	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-CF ₃ -フェニル
1-058	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-Me-シクロブ°ロヒ°ル
1-059	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-Me-2-ヘ°ソ°フラニル
1-060	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-Me-フェニル
1-061	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	MeOCH ₂ CH ₂ -
1-062	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	7-(ジ°フルオロメチル)-5-メチル-[1, 2, 4]トリアゾ°ロ[1, 5-a]ヒ°リミジン-2-イル
1-063	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-CF ₃ -4-Me-フラン-2-イル
1-064	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	イソブ°ロヒ°ル
1-065	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1,1,2,2-テトラメチルエチル

10

20

30

40

1-066	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(R)-1-F-エチル
1-067	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Me-3-フエニル
1-068	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Me- フ [°] ロハ [°] -1-イル
1-069	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	5-Me-チエン-2-イル
1-070	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2,3-F ₂ -フェニル
1-071	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-F-フェニル
1-072	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-EtO-フェニル
1-073	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-F-フェニル
1-074	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-CF ₃ O-フェニル
1-075	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-シアノフェニル
1-076	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	エチル
1-077	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	シクロペンチル
1-078	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	t-ブチル
1-079	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2, 2-ジメチルフ [°] ロハ [°] -1-イル
1-080	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2, 3-ジメチルフェニル
1-081	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	5-メチルイソオキサゾール -4-イル
1-082	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1, 1-ジメチル-2- エトキシエチル
1-083	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-Cl-6-Me- ベンゾチオフェン-2-イル
1-084	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2, 2-ジフルオロ-1, 3- ベンゾジ [°] オキソール-5- イル
1-085	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-ヒ [°] リジニル
1-086	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-F-5-ヒ [°] リジニル
1-087	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Me-4-ヒ [°] リジニル
1-088	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-CN-フェニル
1-089	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-F-4-ヒ [°] リジニル

10

20

30

40

1-090	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3, 4-ジメチルフェニル
1-091	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-Me, 4-F-フェニル
1-092	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-F, 4-Me-フェニル
1-093	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1, 3-ベンゾジ オキソール-5-イル
1-094	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-MeO, 4-F- フェニル
1-095	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-F, 4-MeO- フェニル
1-096	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-Cl, 3-F-フェニル
1-097	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-MeO, 4-Me-Ph
1-098	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-099	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Cl-5-ヒ°リジニル
1-100	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-F-5-ヒ°リジニル
1-101	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-EtO, 4-F-フェニル
1-102	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-103	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	F	F	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-104	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	F	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-105	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	F	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-106	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	F	H	2-CN-5-ヒ°リジニル
1-128	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	2-チオフェニル
1-129	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	3-MeO-4-F- フェニル
1-130	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	3-F-4-MeO- フェニル
1-131	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	F	3-MeO-4-F- フェニル
1-132	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	F	2-F-5-ヒ°リジニル
1-133	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	F	F	2-F-5-ヒ°リジニル
1-334	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	H	F	2-F-5-ヒ°リジニル

10

20

30

40

【 0 3 3 8 】

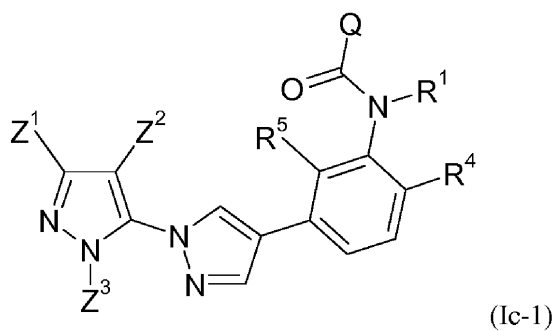
式 (I c-1) で表される特に好ましい化合物は、さらにまた、Z¹、Z²、Z³、R¹、R⁴、R⁵ 及び Q に関して表 1 a に記載されているラジカルの定義を任意に組み合わ

50

せることによって生じる化合物である。

【表 2】

表 1 b



10

式 (Ic-1) で表される本発明の化合物は、一般式 (Ic) [式中、 $W = O$, $A_1 = A_2 = CH$, $A_3 = CR^4$, $A_4 = CR^5$ 及び $R^6 = H$ (即ち、 $n = 0$)] で表される化合物である

Ex. No.	Z^1	Z^2	Z^3	R^1	R^4	R^5	Q
1-107	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	フェニルチオメチル
1-108	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-1-フェニルエチル
1-109	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-フェニル- シクロヘキシルメチル
1-110	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-テトラリン
1-111	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-(4-Me-フェニル) シクロヘキサ-1-イル
1-112	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-CF ₃ -4-Me- ピラゾール-1-イル -メチル
1-113	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-フェニル シクロプロパ-1-イル
1-114	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	ベンジルオキシメチル
1-115	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-(4-Cl-フェニル)- シクロブタ-1-イル
1-116	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-CF ₃ -ベンジル

20

30

40

1-117	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-チオフェニルメチル
1-118	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	フェノキシエチル
1-119	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-メチル-1-(3-Cl-フェニル)エチル
1-120	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-1-(4-Cl-フェニル)-2-メチルプロパ-1-イル
1-121	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	3-F-ベンジル
1-122	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	1-(4-Cl-フェニル)-シクロブタ-1-イル
1-123	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-1-フェノキシエチル
1-124	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	(rac)-1-フェニルプロパ-1-イル
1-125	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-フェニルエチル
1-126	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	2-Cl-4-F-ベンジル
1-127	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	N',N'-ジメチルオキサリルアミド

10

20

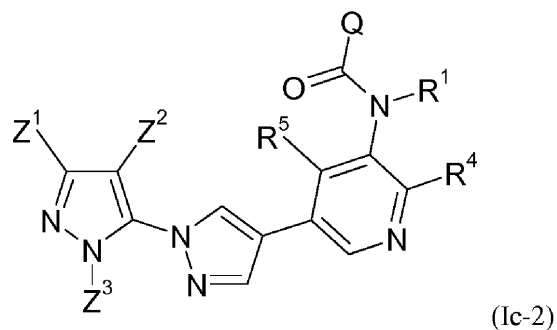
【0339】

式(Ic-1)で表される特に好ましい化合物は、さらにまた、Z¹、Z²、Z³、R¹、R⁴、R⁵及びQに関して表1bに記載されているラジカルの定義を任意に組み合わせることによって生じる化合物である。

30

【表3】

表2



40

式(Ic-2)で表される本発明の化合物は、一般式(Ic) W=O, A₁=CH, A₂=N, A₃=CR⁴, A₄=CR⁵及びR⁶=H(即ち、n=0)で表される化合物である

Ex. No.	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ⁴	R ⁵	Q
2-001	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-F-フェニル
2-002	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-Cl-2-ヒ°リジニル
2-003	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-F-フェニル
2-004	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	4-ヒ°リジニル
2-005	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	F	H	4-ヒ°リジニル
2-006	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	4-ヒ°リジニル
2-007	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	3-MeO, 4-F- フェニル
2-008	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	Cl	H	2-CN-5-ヒ°リジニル
2-009	CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	H	2-CN-5-ヒ°リジニル

10

【0340】

20

式（I c-2）で表される特に好ましい化合物は、さらにまた、Z¹、Z²、Z³、R¹、R⁴、R⁵及びQに関して表2に記載されているラジカルを任意に組み合わせることによって生じる化合物である。

【0341】

分析データ

NMRピークリスト法

選択された実施例の¹H NMRデータは、¹H NMRピークリストの形態で記録されている。各シグナルピークに対して、最初にδ値（ppm）が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関するδ値—シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

30

【0342】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態を有する：

δ₁（強度₁）；δ₂（強度₂）；．．．；δ_i（強度_i）；．．．；δ_n（強度_n）。

【0343】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ（cm）と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0344】

¹H NMRスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、及び／又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在するわけではない。

40

【0345】

¹H NMRピークのリストは、従来の¹H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0346】

さらに、それらは、従来の¹H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の対象の一部を形成する）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

50

【0347】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H NMRピークの本発明者らによるリストは、溶媒の通常のピーク、例えば、 $\text{DMSO}-d_6$ 中の DMSO のピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0348】

目標化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、90%を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【0349】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副産物の指紋（by-product fingerprints）」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0350】

目標化合物のピークを既知方法（Mestrec、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 ^1H NMRの慣習的な解釈における関連するピークのピッキングに類似しているであろう。

【0351】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【表4】

実施例 1-001: ^1H -NMR(400,0 MHz, DMSO): $\delta = 10,591(2,2); 8,817(3,5); 8,813(2,2); 8,806(2,3); 8,802(3,7); 8,707(3,9); 8,426(4,3); 8,317(0,4); 8,087(2,1); 7,954(2,2); 7,896(3,5); 7,892(2,2); 7,884(2,2); 7,880(3,4); 7,699(1,0); 7,680(1,2); 7,503(0,7); 7,500(0,5); 7,484(2,1); 7,480(1,3); 7,474(1,9); 7,455(1,9); 7,436(0,6); 4,039(0,3); 4,021(0,3); 3,829(10,2); 3,329(25,9); 2,892(16,0); 2,733(14,0); 2,525(0,5); 2,512(12,9); 2,508(25,5); 2,503(33,3); 2,499(24,2); 1,990(1,4); 1,193(0,4); 1,175(0,8); 1,158(0,4); 0,008(1,3); 0,000(30,9); -0,008(1,5)$
実施例 1-002: ^1H -NMR(400,0 MHz, DMSO): $\delta = 10,280(0,5); 8,656(1,2); 8,371(1,3); 7,954(2,2); 7,927(0,6); 7,364(1,0); 7,355(0,5); 7,351(0,8); 3,813(3,2); 3,330(8,0); 2,892(16,0); 2,733(13,6); 2,512(3,2); 2,508(6,4); 2,503(8,4); 2,499(6,0); 2,494(2,8); 1,235(0,3); 0,814(1,5); 0,806(1,1); 0,798(0,7); 0,793(0,9); 0,787(0,6); 0,781(0,4); 0,773(0,4); 0,769(0,5); 0,008(0,5);$

10

20

30

0,000(14,1); -0,009(0,5)	
実施例 1-003: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,350(2,4); 8,694(4,2); 8,416(4,7); 8,084(3,2); 8,080(3,1); 8,071(2,4); 8,063(2,3); 8,054(0,9); 8,049(2,1); 8,021(0,4); 8,007(0,5); 7,999(0,5); 7,985(0,4); 7,954(2,2); 7,693(0,7); 7,688(1,2); 7,682(0,7); 7,675(0,8); 7,670(1,4); 7,665(0,8); 7,466(0,5); 7,462(0,4); 7,447(3,9); 7,428(1,9); 7,420(0,4); 7,412(2,2); 7,390(3,9); 7,373(0,7); 7,368(1,9); 7,343(0,4); 7,321(0,8); 7,298(0,4); 3,827(11,1); 3,328(27,3); 2,891(16,0); 2,732(13,6); 2,512(16,7); 2,507(32,9); 2,503(42,8); 2,498(30,8); 2,494(15,0); 0,008(1,6); 0,000(37,7); -0,008(1,4)	
実施例 1-004: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,775(3,3); 8,781(3,7); 8,709(5,7); 8,617(2,2); 8,605(2,3); 8,421(6,2); 8,024(3,3); 7,953(0,6); 7,735(1,6); 7,721(2,3); 7,708(1,6); 7,613(1,5); 7,594(1,9); 7,509(1,2); 7,489(2,9); 7,473(2,5); 7,453(2,7); 7,434(0,9); 5,757(2,7); 3,824(16,0); 3,326(86,8); 2,891(4,8); 2,731(4,1); 2,676(0,5); 2,671(0,7); 2,667(0,5); 2,511(41,6); 2,507(80,7); 2,502(104,0); 2,498(74,1); 2,493(35,3); 2,334(0,5); 2,329(0,7); 2,325(0,5); 1,259(0,4); 1,235(0,4); 0,146(0,6); 0,008(6,0); 0,000(134,9); -0,009(5,0); -0,150(0,6)	10
実施例 1-005: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,741(3,4); 8,714(6,1); 8,653(2,4); 8,650(2,6); 8,641(2,6); 8,638(2,6); 8,426(6,6); 8,139(2,4); 8,136(2,4); 8,118(2,6); 8,115(2,6); 8,091(3,4); 7,669(1,6); 7,664(1,1); 7,649(2,1); 7,645(3,8); 7,633(2,5); 7,624(2,4); 7,613(2,3); 7,490(1,0); 7,486(0,7); 7,471(3,2); 7,461(2,9); 7,442(2,9); 7,423(1,0); 4,056(1,2); 4,038(3,7); 4,020(3,7); 4,003(1,3); 3,825(16,0); 3,806(0,6); 3,329(54,8); 2,891(0,9); 2,732(0,7); 2,676(0,3); 2,672(0,4); 2,667(0,3); 2,525(1,2); 2,511(26,9); 2,507(54,4); 2,503(71,2); 2,498(51,5); 2,494(24,9); 2,334(0,3); 2,330(0,4); 2,325(0,3); 1,990(16,0); 1,398(15,9); 1,193(4,3); 1,175(8,5); 1,157(4,2); 0,008(0,6); 0,000(18,3); -0,009(0,6)	
実施例 1-006: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,665(2,0); 8,709(3,6); 8,652(1,9); 8,639(2,0); 8,4273(3,9); 8,4265(3,9); 8,062(1,9); 8,025(2,4); 8,024(2,4); 7,903(1,5); 7,899(1,4); 7,890(1,4); 7,887(1,3); 7,695(0,9); 7,690(0,6); 7,675(1,1); 7,516(0,7); 7,512(0,5); 7,500(1,2); 7,497(1,9); 7,493(1,1); 7,483(1,6); 7,464(1,8); 7,444(0,6); 4,038(0,8); 4,020(0,8); 3,828(9,5); 3,569(4,9); 3,332(36,1); 2,525(0,6); 2,512(13,6); 2,508(27,3); 2,503(35,3); 2,499(24,9); 2,494(11,6); 1,990(3,7); 1,398(16,0); 1,193(1,0); 1,175(2,0); 1,157(1,0); 0,008(0,6); 0,000(18,1); -0,009(0,6)	20
実施例 1-007: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,402(3,3); 8,703(5,9); 8,411(6,4); 7,892(3,6); 7,468(1,2); 7,462(0,9); 7,450(3,1); 7,442(3,5); 7,438(3,5); 7,427(3,4); 7,408(1,8); 7,389(0,6); 3,817(16,0); 3,581(1,3); 3,553(3,9); 3,525(4,1); 3,497(1,4); 3,343(141,3); 3,314(0,4); 2,543(14,8); 2,508(29,0); 2,504(37,3); 2,500(28,6); 0,000(5,0)	
実施例 1-008: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,947(2,7); 8,657(6,0); 8,373(6,3); 7,919(2,9); 7,498(0,7); 7,493(0,8); 7,486(1,2); 7,482(1,5); 7,476(1,1); 7,471(1,1); 7,362(5,1); 7,350(4,1); 3,816(16,0); 3,334(77,4); 2,543(7,9); 2,525(0,5); 2,512(12,9); 2,508(26,7); 2,503(35,8); 2,499(26,7); 2,368(1,6); 2,350(5,1); 2,331(5,4); 2,312(1,7); 1,113(5,4); 1,094(11,2); 1,075(5,2); 0,000(5,1)	30
実施例 1-009: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11,137(2,2); 8,720(6,2); 8,436(6,7); 7,968(2,1); 7,964(3,6); 7,959(2,3); 7,614(1,5); 7,594(1,9); 7,589(1,7); 7,575(1,6); 7,555(2,4); 7,494(2,5); 7,474(3,3); 7,454(1,3); 7,006(0,7); 6,993(0,3); 6,891(0,7); 6,878(1,4); 6,864(0,7); 6,762(0,3); 6,749(0,7); 6,735(0,4); 5,756(1,3); 3,822(16,0); 3,326(30,7); 2,525(0,7); 2,512(16,3); 2,508(33,5); 2,503(44,8); 2,498(33,2); 2,494(16,8); 0,008(0,8); 0,000(24,6); -0,008(1,1)	
実施例 1-010: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,340(3,7); 8,697(6,1); 8,419(6,7); 8,106(3,5); 7,994(4,1); 7,977(4,4); 7,708(1,7); 7,702(1,0); 7,690(1,9); 7,685(1,2); 7,631(0,6); 7,613(2,3); 7,607(0,7); 7,595(2,0); 7,570(3,6); 7,551(4,5); 7,534(1,6); 7,463(0,6); 7,460(0,6); 7,446(5,9); 7,428(2,5); 7,409(0,7); 3,829(16,0); 3,334(74,1); 2,542(19,0); 2,507(29,3); 2,503(37,3); 2,499(28,0); 0,000(3,4)	
実施例 1-011: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,710(3,6); 8,707(5,8); 8,423(6,3); 8,039(16,0); 7,687(1,5); 7,668(1,8); 7,526(1,1); 7,506(2,8); 7,491(2,4); 7,471(2,7); 7,452(0,9); 3,826(15,3); 3,332(239,3); 2,675(0,5); 2,671(0,7); 2,542(34,9); 2,506(77,5); 2,502(102,4); 2,498(78,3); 2,329(0,7); 2,325(0,5); 1,234(0,6); 0,000(7,6)	
実施例 1-012: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,496(3,3); 8,695(5,8); 8,411(6,0); 8,059(2,7); 7,712(0,8); 7,708(1,0); 7,693(1,6); 7,690(1,9); 7,674(0,9); 7,671(1,0); 7,634(1,4); 7,629(1,1); 7,615(1,8); 7,608(1,6); 7,593(1,0); 7,587(1,2); 7,582(0,7); 7,573(0,6); 7,569(0,6); 7,470(0,9); 7,466(0,7); 7,451(3,5); 7,446(3,6); 7,426(2,5); 7,407(0,8); 7,392(1,3); 7,367(3,6); 7,348(3,6); 7,331(1,3); 7,329(1,2); 3,824(16,0); 3,334(99,1); 2,542(13,5); 2,525(0,6); 2,512(16,0); 2,507(33,0); 2,503(43,8); 2,498(32,2); 2,494(15,9); 1,235(0,4); 0,000(4,9)	
実施例 1-013: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,405(3,7); 8,702(6,2); 8,423(6,7); 8,088(3,4); 7,855(1,9); 7,836(2,3); 7,816(1,2); 7,810(1,5); 7,806(1,1); 7,791(1,1); 7,786(1,4); 7,782(1,1); 7,705(1,0); 7,701(1,7); 7,696(1,1); 7,687(1,2); 7,683(2,0); 7,678(1,2); 7,642(0,9); 7,627(1,0); 7,621(1,7); 7,607(1,7); 7,602(1,2); 7,587(1,0); 7,494(0,9); 7,487(1,1); 7,482(1,0); 7,473(1,7); 7,467(3,6); 7,463(4,2); 7,459(4,8); 7,447(0,9); 7,440(2,9); 7,421(0,9); 3,829(16,0); 3,337(68,0); 2,543(23,1); 2,526(0,5); 2,513(11,0); 2,508(22,3); 2,504(29,5); 2,500(21,7); 2,495(10,9); 0,000(3,1)	40
実施例 1-014: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,453(3,8); 8,705(6,1); 8,425(6,6); 8,068(3,6); 7,735(0,5); 7,723(2,5); 7,718(3,2); 7,702(3,3); 7,697(3,6); 7,674(2,1); 7,582(0,6); 7,576(0,9); 7,570(0,5); 7,559(1,2); 7,553(1,8); 7,547(0,9); 7,536(0,7); 7,530(0,9); 7,525(0,5); 7,498(1,1); 7,494(0,8); 7,479(3,5); 7,475(2,5); 7,470(3,1); 7,451(2,8); 7,432(0,9); 3,829(16,0); 3,338(76,8); 2,544(23,7); 2,509(23,6); 2,505(29,8); 2,500(22,4); 0,000(2,3)	
実施例 1-015: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,894(3,6); 8,714(6,2); 8,425(6,8); 8,021(3,5); 7,647(0,4); 7,630(1,0); 7,626(0,9); 7,609(1,8); 7,589(2,4); 7,571(2,5); 7,500(1,2); 7,497(0,9); 7,481(3,1); 7,465(2,8); 7,445(3,0); 7,426(1,0); 7,296(0,6); 7,289(3,1); 7,269(4,4); 7,24	

9(2,6);7,242(0,6);3,825(16,0);3,337(74,0);2,543(35,4);2,526(0,4);2,513(10,5);2,508(21,6);2,504(28,6);2,499(21,1);2,495(10,6);0,000(3,3)
実施例 1-016: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,134(3,6);8,691(6,1);8,412(6,7);8,377(2,3);8,374(2,6);8,370(2,8);8,367(2,5);8,316(0,8);8,049(3,3);7,683(1,3);7,676(2,0);7,670(4,6);7,663(4,3);7,654(5,3);7,644(1,6);7,641(1,4);7,445(0,6);7,434(5,5);7,418(2,6);7,399(0,6);3,824(16,0);3,323(116,1);2,675(0,9);2,671(1,2);2,666(1,0);2,506(134,0);2,502(180,9);2,497(139,8);2,333(0,8);2,328(1,1);2,324(0,9);1,989(0,6);1,398(7,7);0,146(0,4);0,008(2,9);0,000(80,9);-0,008(4,7);-0,150(0,4)
実施例 1-017: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,324(3,7);8,707(6,2);8,429(6,6);8,056(2,5);8,054(2,8);8,047(2,8);8,045(2,9);8,034(3,5);7,886(2,6);7,884(2,7);7,873(2,7);7,871(2,7);7,658(1,0);7,653(1,8);7,648(1,1);7,640(1,2);7,635(2,1);7,630(1,3);7,467(0,7);7,464(0,6);7,449(5,8);7,430(2,6);7,411(0,7);7,258(2,4);7,249(2,6);7,246(2,7);7,237(2,3);3,828(16,0);3,339(69,5);2,544(25,0);2,527(0,4);2,509(20,6);2,504(27,4);2,500(20,6);0,000(2,7)
実施例 1-018: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,261(1,3);8,707(2,2);8,425(2,4);7,999(1,2);7,994(0,8);7,936(1,8);7,923(1,9);7,606(0,5);7,601(0,4);7,586(0,7);7,582(0,5);7,485(0,4);7,469(0,7);7,466(1,1);7,462(0,6);7,449(1,0);7,429(1,1);7,410(0,4);7,235(1,9);7,222(1,8);3,822(5,6);3,325(13,7);2,525(0,3);2,511(8,2);2,507(17,3);2,502(23,4);2,498(17,4);2,493(8,7);1,989(0,4);1,398(16,0);0,008(0,7);0,000(22,6);-0,009(1,0)
実施例 1-019: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,900(3,2);8,685(5,2);8,406(5,7);8,320(5,0);8,035(5,5);8,006(2,8);7,642(0,8);7,637(0,9);7,626(1,5);7,619(1,0);7,614(1,0);7,410(4,4);7,398(3,5);3,905(16,0);3,825(13,4);3,342(106,7);2,543(30,5);2,526(0,5);2,512(12,0);2,508(23,5);2,504(30,2);2,499(22,3);0,000(1,8)
実施例 1-020: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,567(3,4);8,766(5,8);8,662(2,4);8,659(2,5);8,650(2,5);8,647(2,5);8,484(6,2);8,317(0,5);8,219(1,6);8,214(1,7);8,201(1,7);8,196(1,6);8,139(2,3);8,135(2,3);8,118(2,6);8,115(2,5);7,661(2,5);7,650(2,4);7,641(2,2);7,629(2,3);7,617(0,8);7,612(0,9);7,606(1,0);7,600(1,0);7,596(1,1);7,590(1,1);7,584(1,1);7,579(0,9);7,439(1,7);7,417(1,6);7,413(2,0);7,391(1,4);3,826(16,0);3,327(199,1);2,676(0,8);2,671(1,1);2,667(0,8);2,542(22,6);2,524(2,8);2,511(61,5);2,507(123,4);2,502(162,4);2,498(117,5);2,493(56,4);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,8);0,008(0,5);0,000(15,9);-0,008(0,5)
実施例 1-021: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,596(3,7);8,839(5,4);8,695(2,2);8,692(2,3);8,684(2,3);8,681(2,2);8,530(5,7);8,318(3,5);8,314(3,4);8,162(2,0);8,159(2,1);8,141(2,3);8,138(2,2);7,699(2,0);7,687(2,0);7,678(1,9);7,666(2,3);7,643(4,7);7,624(2,8);7,620(2,6);7,603(1,0);7,598(1,0);3,827(16,0);3,327(95,8);2,676(0,5);2,671(0,7);2,667(0,5);2,542(2,1);2,511(42,1);2,507(81,7);2,502(106,3);2,498(78,3);2,494(38,9);2,334(0,5);2,329(0,7);2,325(0,5);1,234(0,6);0,008(0,3);0,000(8,8);-0,008(0,4)
実施例 1-022: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 19,972(0,5);10,243(4,5);8,814(6,1);8,553(6,6);8,320(0,4);8,108(2,4);8,098(2,8);8,093(2,9);8,084(2,4);7,909(3,4);7,906(3,5);7,678(1,2);7,664(2,6);7,661(2,7);7,642(4,9);7,628(2,3);7,415(2,6);7,400(5,0);7,386(2,5);3,831(16,0);3,339(61,6);2,615(0,8);2,521(1,5);2,518(1,5);2,506(111,4);2,503(152,4);2,500(114,0);2,387(0,8);1,397(1,7);0,096(0,5);0,000(96,7);-0,100(0,4)
実施例 1-023: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,198(4,7);8,819(6,0);8,557(6,4);8,030(4,2);8,018(4,4);7,927(3,6);7,924(3,7);7,676(1,2);7,662(2,8);7,659(2,9);7,642(5,3);7,629(4,4);7,616(1,7);7,573(3,1);7,560(4,8);7,548(2,1);3,834(16,0);3,342(46,2);2,615(0,3);2,503(61,3);2,388(0,4);1,398(2,4);0,000(31,9)
実施例 1-024: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,544(4,4);8,833(4,5);8,823(10,5);8,561(6,8);7,932(3,6);7,929(3,8);7,922(3,7);7,913(3,5);7,711(1,4);7,707(1,2);7,697(2,5);7,693(2,5);7,666(4,6);7,652(2,5);7,620(0,5);3,835(16,0);3,344(18,4);2,507(24,0);2,505(31,9);2,502(23,2);0,000(24,7);-0,006(0,9)
実施例 1-026: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,237(4,1);8,744(6,0);8,495(6,7);8,322(0,5);8,014(3,7);8,002(4,1);8,000(3,3);7,918(1,5);7,914(1,6);7,906(1,6);7,902(1,5);7,637(1,8);7,625(3,0);7,615(1,7);7,613(1,9);7,567(3,1);7,554(4,7);7,542(2,0);7,412(1,5);7,398(1,7);7,395(1,8);7,381(1,4);3,830(16,0);3,341(59,7);2,615(0,4);2,524(0,7);2,521(0,8);2,518(0,8);2,509(25,0);2,506(54,8);2,503(75,7);2,500(54,7);2,497(25,3);2,388(0,4);1,990(0,6);1,398(4,8);0,005(1,8);0,000(54,9);-0,006(2,0)
実施例 1-027: ¹ H-NMR(601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,274(2,4);8,743(3,4);8,494(3,8);8,099(1,4);8,096(0,7);8,090(1,6);8,084(1,6);8,079(0,7);8,075(1,5);7,913(0,9);7,910(0,9);7,901(0,9);7,898(0,9);7,646(0,5);7,642(0,5);7,638(0,6);7,634(0,5);7,632(0,6);7,628(0,6);7,624(0,6);7,620(0,5);7,414(1,0);7,409(1,6);7,395(3,3);7,383(1,3);7,380(1,6);4,036(0,3);4,024(0,3);3,832(9,3);3,345(11,3);2,511(4,7);2,508(10,2);2,505(14,1);2,502(10,4);2,500(4,9);1,991(1,4);1,397(16,0);1,188(0,4);1,176(0,7);1,164(0,4);0,005(0,4);0,000(12,4);-0,006(0,5)
実施例 1-028: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,738(3,6);8,705(6,0);8,559(2,1);8,554(2,4);8,547(2,4);8,542(2,4);8,413(6,5);8,111(2,1);8,106(2,3);8,092(2,5);8,088(2,4);8,032(3,5);7,599(3,4);7,586(3,4);7,580(3,9);7,568(2,3);7,493(1,1);7,489(0,8);7,474(3,2);7,462(2,8);7,443(2,8);7,424(0,9);5,757(5,2);4,056(0,4);4,038(1,2);4,021(1,2);4,003(0,4);3,822(16,0);3,327(46,4);2,525(0,7);2,511(17,8);2,507(37,1);2,503(49,9);2,498(37,4);2,494(19,1);1,989(5,2);1,193(1,4);1,175(2,8);1,158(1,4);0,008(0,9);0,000(26,5);-0,008(1,1)
実施例 1-029: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,082(3,5);8,687(6,3);8,648(0,4);8,414(6,8);7,880(3,6);7,527(1,5);7,507(2,0);7,476(1,5);7,457(2,7);7,421(2,6);7,402(3,1);7,382(1,1);4,515(0,3);3,823(16,0);3,333(30,2);2,953(0,3);2,514(30,0);2,510(40,2);2,505(30,8);2,318(0,4);1,996(0,5);1,706(1,7);1,696(14,9);1,686(2,0);1,673(0,5);1,664(0,4);1,405(7,0);1,183(0,4)
実施例 1-030: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,954(1,2);8,679(2,4);8,411(2,6);7,939(0,8);7,935(1,3);7,931(0,9);7,584(0,6);7,580(0,5);7,564(0,7);7,563(0,7);7,560(0,6);7,472(0,3);7,469(0,6);7,466(0,4);7,453(0,7);7,450(1,0);7,447(0,7);7,413(1,0);7,394(1,3);7,374(0,5);3,817(6,0);3,325(6,9);2,512(4,0);2,508(8,4);2,503(11,4);2,498(8,3);2,494(4,1);1,989(0,6);1,625(0,8);1,612(1,9);1,604(1,9);1,592(1,0);1,398(16,0);1,385(2,1);1,377(2,1);1,363(0,8);1,176(0,3)
実施例 1-031: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,882(3,2);8,690(6,1);8,433(6,3);8,431(6,5);8,414(6,5);8,413(6,5);8,131(3,1);7,760(1,4);7,740(1,6);7,574(6,4);7,572(6,4);7,499(1,3);7,496(0,9);7,480(2,7);7,456(2,4);7,437(3,1);7,417(1,2);5,756(6,1);3,867(0,4);3,827(16,0);3,810(1,8);3,325(29,9);2,923(1,1);2,870(1,1);2,676(0,4);2,672(0,5);2,668(0,7);2,525(1,3);2,520(1,9);2,512(26,8);2,507(55,1);2,503(73,4);2,498(53,5);2,494(25,9);2,330(0,5);2,325(0,3);1,259(0,4);1,235(1,2);0,146(0,5);0,008(3,3);0,000(99,8);-0,009(3,6);-0,150(0,5)
実施例 1-032: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,871(3,6);8,726(5,5);8,479(6,2);7,808(1,5);7,802(1,6);7,790(1,5);7,784(1,5);7,643(0,8);7,638(0,8);7,632(0,9);7,626(1,0);7,622(1,1);7,616(1,0);7,610(1,0);7,605(0,9);7,385(1,6);7,363(1,7);7,360(1,9);7,338(1,4);3,821(14,4);3,327(10,1);2,511(13,7);2,507(26,4);2,503(34,2);2,498(25,6);1,612(1,6);1,598(4,1);1,590(4,5);1,578(2,1);1,425(2,3);1,413(4,7);1,405(5,4);1,398(16,0);0,008(1,0);0,000(20,7);-0,008(0,9)
実施例 1-033: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11,154(3,7);8,771(6,2);8,518(6,9);7,768(1,4);7,763(2,1);7,750(2,4);7,745(2,8);7,7

10

20

30

40

38(1,5);7,729(1,2);7,723(1,0);7,717(1,2);7,712(0,8);7,463(1,8);7,441(1,8);7,438(2,0);7,416(1,5);7,007(0,6);6,892(0,6);6,878(1,3);6,865(0,6);6,750(0,7);6,736(0,3);3,826(16,0);3,329(14,5);2,526(0,5);2,512(12,5);2,508(25,6);2,503(34,2);2,499(25,3);2,494(12,6);1,990(0,9);1,398(2,9);1,176(0,5);0,008(0,7);0,000(21,6);-0,008(0,8)	
実施例 1-034: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,655(3,0);9,399(6,1);9,299(11,6);8,739(5,9);8,480(6,4);8,015(1,7);8,010(1,8);7,997(1,8);7,992(1,8);7,671(0,9);7,666(1,0);7,660(1,1);7,654(1,2);7,650(1,3);7,644(1,3);7,639(1,2);7,633(1,0);7,456(1,6);7,431(2,1);7,409(1,4);3,827(16,0);3,325(69,7);2,671(1,3);2,506(154,5);2,502(193,0);2,498(152,5);2,329(1,3);1,989(1,2);1,192(0,3);1,175(0,6);1,157(0,4);0,146(1,4);0,000(263,3);-0,150(1,4)	
実施例 1-035: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,802(3,0);8,729(5,0);8,475(5,6);8,330(4,9);8,024(5,1);7,927(1,3);7,922(1,4);7,909(1,4);7,903(1,4);7,597(0,7);7,591(0,7);7,585(0,8);7,579(0,8);7,576(0,9);7,570(0,9);7,564(0,9);7,558(0,7);7,391(1,5);7,370(1,4);7,365(1,7);7,344(1,2);3,902(16,0);3,825(13,1);3,335(17,0);3,333(16,5);3,328(16,0);2,525(0,9);2,511(17,6);2,507(35,3);2,503(46,5);2,498(34,0);2,494(16,8);0,146(0,4);0,008(3,3);0,000(89,2);-0,009(3,5);-0,150(0,4)	
実施例 1-036: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,643(3,0);9,465(4,3);9,462(4,4);9,183(4,5);9,170(4,6);8,751(6,1);8,481(6,8);8,215(1,5);8,209(1,6);8,196(1,6);8,191(1,6);8,168(2,6);8,165(2,7);8,155(2,6);8,152(2,6);7,652(0,8);7,646(0,9);7,640(1,0);7,634(1,0);7,630(1,1);7,624(1,1);7,618(1,1);7,613(1,0);7,468(1,8);7,447(1,7);7,442(2,1);7,421(1,5);3,830(16,0);3,326(34,1);2,672(0,5);2,667(0,3);2,525(1,3);2,512(25,2);2,507(51,5);2,503(68,6);2,498(50,4);2,494(24,8);2,329(0,4);1,989(0,5);1,398(2,8);0,008(1,4);0,000(40,9);-0,009(1,5)	10
実施例 1-037: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8,701(5,6);8,482(6,5);7,941(1,6);7,936(1,7);7,923(1,7);7,917(1,7);7,615(0,7);7,609(0,8);7,603(0,8);7,597(0,9);7,594(0,9);7,588(0,9);7,582(0,9);7,577(0,7);7,407(1,6);7,391(1,2);7,258(0,8);7,234(1,3);7,211(0,8);7,130(1,1);7,108(1,9);7,087(1,0);5,758(1,8);3,820(16,0);3,367(18,3);3,327(20,9);2,672(0,4);2,525(1,0);2,520(1,5);2,512(22,7);2,507(46,1);2,503(60,8);2,498(44,6);2,494(22,1);2,330(0,4);1,989(0,6);1,398(0,5);0,000(8,7)	
実施例 1-038: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,019(3,9);8,712(6,2);8,473(6,9);8,099(2,4);8,094(1,1);8,085(2,7);8,077(2,9);8,068(1,1);8,063(2,5);7,656(3,2);7,653(3,5);7,544(1,7);7,540(1,6);7,525(2,0);7,520(2,0);7,404(2,9);7,399(1,0);7,382(5,7);7,359(5,3);7,338(2,4);3,824(16,0);3,324(93,0);2,675(0,8);2,671(1,2);2,666(0,9);2,524(2,8);2,519(4,3);2,511(65,7);2,506(136,0);2,502(182,1);2,497(134,5);2,493(67,2);2,337(0,4);2,333(0,9);2,329(1,2);2,324(0,9);2,249(14,0);1,398(9,9);0,146(0,8);0,008(5,8);0,000(177,8);-0,008(6,8);-0,150(0,8)	
実施例 1-039: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,293(4,1);8,741(2,9);8,736(3,1);8,533(5,6);8,316(2,6);8,110(2,6);8,097(3,1);8,088(3,2);8,075(2,8);7,986(0,9);7,963(0,5);7,955(2,9);7,950(1,2);7,941(3,1);7,933(3,4);7,925(1,3);7,919(3,1);7,911(0,5);7,904(0,7);7,882(1,1);7,867(1,1);7,846(0,6);7,430(2,6);7,408(5,5);7,395(1,9);7,385(3,6);7,379(2,2);7,355(2,0);7,331(0,9);7,306(0,4);7,299(3,1);7,294(1,0);7,282(1,1);7,277(5,9);7,260(0,9);7,255(3,0);4,037(0,7);4,019(0,7);3,813(16,0);3,323(533,1);2,675(5,6);2,671(8,0);2,666(6,0);2,524(19,7);2,510(444,0);2,506(919,6);2,502(1233,6);2,497(916,3);2,493(458,2);2,333(5,7);2,328(8,0);2,324(6,1);1,989(2,9);1,234(0,6);1,193(0,8);1,175(1,1);1,157(0,8);0,148(0,8);0,146(5,4);0,008(37,2);0,000(1198,0);-0,008(45,3);-0,065(0,5);-0,074(0,4);-0,150(5,7)	20
実施例 1-040: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,284(3,7);8,816(4,2);8,802(4,6);8,721(5,8);8,480(6,2);7,916(3,8);7,901(3,8);7,681(3,2);7,571(1,6);7,568(1,6);7,552(2,0);7,548(2,0);7,378(2,8);7,358(2,3);5,757(5,0);4,056(0,9);4,038(2,7);4,021(2,7);4,003(1,0);3,826(16,0);3,329(20,0);2,507(32,6);2,503(43,0);2,498(32,7);2,260(14,1);1,989(11,4);1,398(0,4);1,193(3,0);1,175(5,8);1,158(2,9);0,008(1,6);0,000(43,4);-0,008(2,0)	
実施例 1-041: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,049(4,0);8,736(6,2);8,485(6,8);8,393(2,5);8,390(2,7);8,386(2,8);8,382(2,6);8,317(0,4);7,906(1,5);7,900(1,7);7,887(1,6);7,882(1,6);7,686(1,7);7,679(1,7);7,674(3,3);7,666(3,3);7,647(3,3);7,644(3,4);7,635(2,6);7,631(2,2);7,623(1,0);7,617(1,0);7,613(1,1);7,607(1,1);7,601(1,0);7,596(0,9);7,411(1,8);7,390(1,7);7,386(2,1);7,364(1,5);3,826(16,0);3,325(124,6);2,675(0,9);2,671(1,3);2,666(0,9);2,524(3,2);2,519(4,8);2,511(70,9);2,506(146,7);2,502(195,5);2,497(142,8);2,493(70,0);2,333(0,9);2,329(1,3);2,324(0,9);2,320(0,5);1,398(7,1);0,146(0,9);0,008(6,6);0,000(202,2);-0,009(7,3);-0,150(0,9)	
実施例 1-085: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,462(4,1);9,152(3,0);9,147(3,0);8,802(2,1);8,798(2,3);8,790(2,3);8,786(2,3);8,740(6,0);8,489(6,6);8,350(1,1);8,345(1,7);8,340(1,2);8,330(1,2);8,325(1,8);8,320(1,2);7,958(1,6);7,952(1,7);7,940(1,7);7,934(1,7);7,664(0,9);7,658(0,9);7,652(1,0);7,646(1,0);7,643(1,1);7,637(1,2);7,631(1,1);7,625(1,0);7,612(1,6);7,600(1,6);7,592(1,6);7,580(1,5);7,437(1,7);7,415(1,8);7,412(2,1);7,390(1,5);3,828(16,0);3,331(246,9);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,525(2,1);2,507(93,6);2,502(123,0);2,498(92,8);2,334(0,6);2,329(0,8);2,325(0,6);1,989(1,2);1,193(0,3);1,175(0,7);1,157(0,3);0,008(0,4);0,000(11,8);-0,008(0,5)	30
実施例 1-086: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,550(3,0);9,033(3,4);8,843(3,5);8,836(3,6);8,739(6,1);8,534(0,5);8,485(6,7);8,288(0,6);8,255(1,1);8,250(1,3);8,248(1,4);8,244(1,1);8,231(1,1);8,227(1,4);8,225(1,3);8,220(1,1);7,963(1,6);7,958(1,7);7,945(1,7);7,940(1,7);7,675(0,9);7,669(0,9);7,664(1,0);7,658(1,0);7,654(1,1);7,648(1,1);7,642(1,1);7,637(0,9);7,449(1,8);7,427(1,8);7,424(2,1);7,402(1,5);5,225(0,4);4,038(0,5);4,020(0,5);3,828(16,0);3,803(1,5);3,324(112,5);2,676(0,8);2,671(1,1);2,667(0,8);2,524(3,0);2,511(60,6);2,507(121,7);2,502(160,0);2,497(116,9);2,493(57,3);2,338(0,4);2,333(0,8);2,329(1,0);2,324(0,8);1,989(1,9);1,398(0,5);1,193(0,5);1,175(1,1);1,157(0,5);0,146(0,7);0,008(5,3);0,000(155,6);-0,009(5,8);-0,150(0,7)	40
実施例 2-001: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,386(2,6);8,926(6,2);8,752(4,4);8,746(4,5);8,650(7,0);8,404(4,6);8,398(4,5);8,316(0,3);8,124(2,7);8,119(1,1);8,110(3,0);8,102(3,1);8,094(1,2);8,088(2,9);7,442(3,0);7,437(0,9);7,420(5,7);7,403(0,9);7,398(2,8);3,840(16,0);3,325(59,1);2,676(0,4);2,672(0,5);2,667(0,4);2,525(1,3);2,520(2,1);2,511(30,6);2,507(62,7);2,502(83,3);2,498(60,2);2,493(28,6);2,334(0,4);2,329(0,5);2,325(0,4);1,989(1,1);1,398(3,1);1,175(0,6);0,146(0,3);0,008(2,8);0,000(83,9);-0,009(2,7);-0,150(0,4)	
実施例 2-002: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 10,706(3,5);8,972(4,6);8,714(4,1);8,710(4,5);8,703(2,4);8,700(2,3);8,693(3,9);8,688(2,5);8,651(5,0);8,316(1,7);8,176(1,7);8,158(1,8);8,155(1,8);7,721(1,5);7,709(1,5);7,700(1,4);7,689(1,3);4,038(0,3);4,020(0,4);3,837(16,0);3,323(410,7);2,680(1,2);2,675(2,6);2,671(3,7);2,666(2,6);2,661(1,2);2,524(8,8);2,519(14,0);2,511(201,5);2,506(413,9);2,502(552,3);2,497(399,1);2,492(189,6);2,338(1,3);2,333(2,7);2,328(3,7);2,324(2,7);2,319(1,3);1,989(1,4);1,398(1,6);1,235(0,5);1,193(0,4);	

1,175(0,8); 1,157(0,4); 0,951(0,3); 0,935(0,3); 0,146(2,4); 0,008(18,0); 0,000(568,5); - 0,009(19,2); -0,022(1,0); -0,046(0,4); -0,150(2,4)
実施例 2-001: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ= 10,386(2,6); 8,926(6,2); 8,752(4,4); 8,746(4,5); 8,650(7,0); 8,404(4,6); 8,398(4,5); 8,316(0,3); 8,124(2,7); 8,119(1,1); 8,110(3,0); 8,102(3,1); 8,094(1,2); 8,088(2,9); 7,442(3,0); 7,437(0,9); 7,420(5,7); 7,403(0,9); 7,398(2,8); 3,840(16,0); 3,325(59,1); 2,676(0,4); 2,672(0,5); 2,667(0,4); 2,525(1,3); 2,520(2,1); 2,511(30,6); 2,507(62,7); 2,502(83,3); 2,498(60,2); 2,493(28,6); 2,334(0,4); 2,329(0,5); 2,325(0,4); 1,989(1,1); 1,398(3,1); 1,175(0,6); 0,146(0,3); 0,008(2,8); 0,000(83,9); -0,009(2,7); -0,150(0,4)

【表 5】

Ex. No.	NMR ピークリスト
1-049	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.44), 0.008 (0.40), 3.826 (16.00), 7.233 (2.29), 7.242 (2.50), 7.245 (2.50), 7.255 (2.42), 7.372 (1.56), 7.393 (2.08), 7.397 (1.83), 7.419 (1.85), 7.607 (0.95), 7.613 (1.10), 7.619 (1.15), 7.625 (1.14), 7.629 (1.04), 7.635 (1.04), 7.640 (0.93), 7.646 (0.90), 7.879 (3.45), 7.882 (3.96), 7.892 (2.69), 7.895 (3.80), 7.901 (1.79), 8.030 (2.52), 8.033 (2.68), 8.040 (2.60), 8.043 (2.47), 8.489 (6.71), 8.739 (6.14), 10.241 (4.28).
1-054	¹ H-NMR (500 MHz, CHLOROFORM-d) δ [ppm]: 0.000 (0.54), 3.059 (16.00), 3.831 (6.12), 6.714 (1.78), 6.719 (0.58), 6.728 (0.63), 6.733 (1.80), 7.157 (0.86), 7.177 (1.11), 7.183 (0.54), 7.189 (0.57), 7.193 (0.55), 7.794 (1.94), 7.798 (0.61), 7.808 (0.63), 7.812 (1.84), 7.899 (1.75), 8.037 (0.56), 8.044 (0.55), 8.135 (2.18), 8.136 (2.05), 8.768 (0.60), 8.773 (0.62), 8.783 (0.61), 8.788 (0.58).
1-058	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.75), 0.008 (1.51), 0.655 (1.51), 0.665 (4.77), 0.672 (4.84), 0.681 (1.70), 1.085 (1.51), 1.093 (4.07), 1.101 (3.87), 1.110 (1.32), 1.412 (16.00), 2.366 (0.40), 2.710 (0.41), 3.814 (13.84), 7.293 (1.38), 7.314 (1.82), 7.318 (1.53), 7.339 (1.61), 7.536 (0.84), 7.542 (0.98), 7.547 (0.98), 7.553 (0.99), 7.557 (0.89), 7.563 (0.89), 7.569 (0.80), 7.575 (0.76), 7.751 (1.51), 7.757 (1.48), 7.769 (1.53), 7.775 (1.38), 8.450 (5.54), 8.452 (5.32), 8.702 (5.35), 9.137 (3.29).
1-066	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.26), 0.008 (1.04), 1.507 (4.92), 1.523 (5.24), 1.568 (5.05), 1.585 (5.05), 3.802 (1.86), 3.817 (16.00), 5.195 (0.44), 5.211 (1.73), 5.228 (1.38), 5.245 (0.42), 5.316 (0.42), 5.333 (1.34), 5.350 (1.31), 5.754 (1.89), 7.343 (1.46), 7.364 (2.04), 7.369 (1.68), 7.390 (1.75), 7.566 (0.98), 7.572 (1.11), 7.577 (1.14), 7.584 (1.20), 7.588 (1.05), 7.593 (1.00), 7.599 (0.90), 7.605 (0.83), 7.924 (1.68), 7.930 (1.72), 7.942 (1.74), 7.948 (1.64), 8.284 (0.62), 8.452 (6.34), 8.531 (0.59), 8.715 (6.07), 9.971 (3.13).
1-084	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.04), 0.008 (1.90), 2.524 (0.51), 3.826 (16.00), 7.378 (1.61), 7.399 (2.16), 7.403 (1.81), 7.425 (1.87), 7.595 (3.76), 7.616 (4.94), 7.620 (1.44), 7.626 (1.24), 7.632 (1.16), 7.636 (1.06), 7.641 (1.08), 7.647 (0.95), 7.653 (0.91), 7.890 (1.81), 7.895 (1.81), 7.908 (1.92), 7.913 (1.98), 7.918 (2.66), 7.922 (2.69), 7.939 (2.05), 7.943 (2.38), 7.993 (4.31), 7.998 (3.89), 8.480 (6.38), 8.481 (6.54), 8.732 (6.18), 10.290 (4.27).
1-025	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) delta [ppm]: -0.149 (1.32), -0.008 (16.00), 0.008 (10.39), 0.146 (1.32), 1.148 (0.82), 2.327 (1.73), 2.366 (2.14), 2.670 (1.83), 2.710 (2.24), 3.826 (10.29), 7.394 (0.92), 7.416 (1.43), 7.441 (1.12), 7.888 (3.16), 7.903 (3.16), 7.918 (1.22), 7.936 (1.22), 8.488 (3.97), 8.739 (3.67), 8.807 (3.36), 8.822 (3.36), 10.527 (2.75).
1-087	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.82), 0.008 (2.63), 2.327 (0.43), 2.366 (0.62), 2.523 (1.06), 2.584 (16.00), 2.670 (0.43), 2.710 (0.65), 3.285 (0.60),

10

20

30

40

	3.826 (13.51), 7.387 (1.30), 7.409 (1.76), 7.413 (1.55), 7.434 (1.55), 7.629 (0.81), 7.634 (0.95), 7.640 (0.95), 7.646 (0.95), 7.650 (0.89), 7.656 (0.87), 7.661 (0.81), 7.667 (0.87), 7.678 (1.49), 7.680 (1.44), 7.693 (1.49), 7.764 (2.63), 7.766 (2.98), 7.899 (1.38), 7.905 (1.44), 7.917 (1.44), 7.923 (1.36), 8.482 (5.32), 8.484 (5.48), 8.656 (2.31), 8.667 (2.20), 8.735 (5.23), 10.458 (3.58).
1-088	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.53), 0.008 (2.23), 3.825 (16.00), 5.754 (1.02), 7.387 (1.48), 7.408 (2.02), 7.413 (1.78), 7.434 (1.74), 7.627 (0.95), 7.632 (1.09), 7.638 (1.13), 7.644 (1.11), 7.648 (1.02), 7.654 (1.01), 7.660 (0.91), 7.665 (0.86), 7.914 (1.69), 7.920 (1.73), 7.932 (1.76), 7.938 (1.62), 8.039 (4.08), 8.044 (1.66), 8.056 (2.11), 8.061 (6.58), 8.135 (6.02), 8.140 (2.08), 8.152 (1.73), 8.157 (3.86), 8.481 (6.11), 8.483 (6.43), 8.733 (6.06), 10.494 (4.24).
1-089	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.67), 0.008 (2.13), 2.366 (0.64), 2.670 (0.45), 2.711 (0.73), 3.826 (16.00), 7.404 (1.54), 7.425 (2.07), 7.430 (1.79), 7.451 (1.74), 7.645 (1.15), 7.651 (1.26), 7.657 (1.35), 7.662 (1.40), 7.666 (1.37), 7.673 (2.38), 7.678 (3.95), 7.684 (2.52), 7.854 (1.20), 7.859 (1.71), 7.871 (1.74), 7.928 (1.79), 7.934 (1.77), 7.946 (1.79), 7.952 (1.63), 8.475 (2.55), 8.477 (3.45), 8.481 (6.50), 8.483 (6.73), 8.490 (2.86), 8.736 (6.02), 10.616 (3.67).
1-090	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.86), 0.008 (2.81), 1.235 (0.39), 2.306 (12.07), 2.310 (16.00), 2.312 (14.43), 2.327 (0.82), 2.366 (0.85), 2.669 (0.52), 2.711 (0.85), 3.825 (12.34), 7.291 (1.90), 7.311 (2.06), 7.353 (1.24), 7.374 (1.67), 7.378 (1.44), 7.399 (1.41), 7.586 (0.82), 7.592 (0.92), 7.597 (0.92), 7.603 (0.92), 7.607 (0.88), 7.613 (0.82), 7.618 (0.75), 7.624 (0.69), 7.724 (1.28), 7.729 (1.47), 7.749 (1.34), 7.797 (2.39), 7.801 (2.45), 7.876 (1.37), 7.882 (1.37), 7.895 (1.37), 7.901 (1.28), 8.477 (4.38), 8.479 (5.01), 8.729 (4.65), 10.065 (3.24).
1-091	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.72), -0.008 (6.34), 0.008 (5.67), 0.146 (0.77), 2.321 (9.47), 2.327 (9.39), 2.367 (0.91), 2.710 (0.94), 3.826 (16.00), 7.292 (1.51), 7.315 (2.45), 7.338 (1.66), 7.364 (1.39), 7.385 (1.99), 7.410 (1.68), 7.599 (0.89), 7.638 (0.77), 7.874 (2.26), 7.881 (2.40), 7.893 (2.64), 7.898 (2.45), 7.953 (1.47), 7.972 (1.51), 8.479 (6.73), 8.728 (6.05), 10.183 (4.04).
1-092	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.55), 0.008 (1.36), 2.325 (9.00), 2.330 (8.62), 2.367 (0.78), 2.670 (0.45), 2.710 (0.78), 3.280 (0.52), 3.364 (0.65), 3.825 (16.00), 7.368 (1.43), 7.390 (2.01), 7.394 (1.81), 7.415 (1.75), 7.458 (1.04), 7.479 (2.20), 7.499 (1.10), 7.607 (0.84), 7.614 (1.10), 7.619 (1.10), 7.625 (1.10), 7.629 (1.04), 7.635 (0.97), 7.641 (0.91), 7.647 (0.84), 7.742 (1.55), 7.746 (1.88), 7.764 (2.07), 7.768 (4.08), 7.774 (1.55), 7.784 (2.14), 7.788 (1.55), 7.881 (1.75), 7.886 (1.81), 7.899 (1.81), 7.905 (1.68), 8.482 (6.67), 8.731 (6.02), 10.228 (4.02).
1-093	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.08), 0.008 (2.13), 2.366 (0.66), 2.710 (0.64), 3.287 (0.49), 3.824 (16.00), 6.143 (15.89), 7.061 (3.92), 7.081 (4.21), 7.351 (1.45), 7.373 (2.02), 7.377 (1.77), 7.398 (1.75), 7.526 (3.98), 7.531 (4.49), 7.586 (0.92), 7.592 (1.09), 7.598 (1.19), 7.603 (1.32), 7.607 (3.45), 7.612 (3.00), 7.619 (1.09), 7.628 (2.53), 7.632 (2.23), 7.864 (1.68), 7.870 (1.74), 7.882 (1.74), 7.888 (1.64), 8.477 (6.81), 8.726 (6.11), 10.027 (4.21).
1-094	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.52), 0.008 (0.42), 2.074 (0.74), 3.314 (15.90), 3.939 (16.00), 7.370 (1.25), 7.378 (1.11), 7.392 (1.58), 7.399 (2.48), 7.403 (1.28), 7.419 (1.55), 7.425 (1.29), 7.616 (0.73), 7.621 (1.33), 7.626 (1.41), 7.632 (1.36), 7.634 (1.16), 7.637 (1.46), 7.642 (1.21), 7.647 (1.16), 7.653 (1.03), 7.655 (0.99), 7.658 (0.74), 7.766 (1.21), 7.772 (1.16), 7.787 (1.24), 7.792 (1.14), 7.878 (1.12), 7.883 (1.12), 7.896 (1.15), 7.901 (1.08), 8.488 (4.32), 8.490 (4.24), 8.739 (4.10), 10.236 (2.82).
1-095	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.20), 0.008 (1.66), 2.367 (0.53), 2.524 (1.83), 2.710 (0.49), 3.825 (11.09), 3.937 (16.00), 7.316 (1.12), 7.337 (1.90), 7.359 (1.13), 7.363 (1.40), 7.384 (1.47), 7.388 (1.27), 7.410 (1.24), 7.599 (0.72), 7.605 (0.81), 7.611 (0.83), 7.617 (0.81), 7.621 (0.76), 7.626 (0.73), 7.632 (0.65), 7.638 (0.61), 7.840 (1.29), 7.846 (1.58), 7.872 (4.89), 7.877 (2.98), 7.890 (2.09), 7.896 (1.96), 7.899 (1.07), 8.480 (4.03), 8.481 (4.57), 8.730 (4.22), 10.140 (3.04).

10

20

30

40

1-096	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.12), 0.008 (1.08), 3.826 (16.00), 7.384 (1.49), 7.405 (2.04), 7.409 (1.79), 7.431 (1.75), 7.624 (0.94), 7.630 (1.11), 7.635 (1.14), 7.641 (1.12), 7.645 (1.04), 7.651 (1.02), 7.657 (0.92), 7.663 (0.88), 7.794 (1.35), 7.812 (1.84), 7.815 (2.57), 7.834 (2.38), 7.870 (2.38), 7.875 (2.36), 7.892 (2.61), 7.898 (2.24), 7.911 (1.76), 7.916 (1.64), 7.989 (1.95), 7.994 (1.81), 8.015 (1.92), 8.019 (1.80), 8.482 (6.69), 8.733 (6.04), 10.390 (4.26).
1-097	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.89), 0.008 (1.76), 2.228 (10.19), 3.827 (11.35), 3.881 (16.00), 7.293 (1.35), 7.296 (1.44), 7.314 (1.61), 7.316 (1.76), 7.366 (1.09), 7.387 (1.48), 7.392 (1.27), 7.413 (1.27), 7.527 (1.22), 7.531 (1.95), 7.540 (2.49), 7.545 (3.50), 7.601 (0.66), 7.607 (0.77), 7.613 (0.79), 7.619 (0.79), 7.623 (0.71), 7.629 (0.71), 7.634 (0.64), 7.640 (0.60), 7.878 (1.18), 7.883 (1.20), 7.896 (1.22), 7.902 (1.14), 8.487 (4.33), 8.489 (4.78), 8.739 (4.38), 10.130 (3.02).
1-098	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.47), 0.008 (2.26), 3.825 (16.00), 7.404 (1.42), 7.426 (1.96), 7.430 (1.71), 7.452 (1.67), 7.635 (0.94), 7.641 (1.12), 7.647 (1.14), 7.652 (1.14), 7.654 (1.00), 7.656 (1.05), 7.662 (1.00), 7.668 (0.91), 7.674 (0.84), 7.965 (1.64), 7.971 (1.69), 7.983 (1.69), 7.989 (1.60), 8.245 (2.42), 8.247 (2.56), 8.265 (2.90), 8.267 (2.94), 8.475 (6.00), 8.476 (6.28), 8.535 (1.92), 8.541 (1.92), 8.555 (1.64), 8.561 (1.67), 8.732 (6.07), 9.246 (2.42), 9.248 (2.81), 9.254 (2.53), 10.697 (2.37).
1-099	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.91), 0.000 (16.00), 0.008 (0.63), 1.989 (0.60), 3.826 (4.60), 7.393 (0.44), 7.415 (0.58), 7.419 (0.52), 7.440 (0.49), 7.726 (0.78), 7.728 (0.93), 7.747 (0.80), 7.749 (0.99), 7.936 (0.50), 7.942 (0.51), 7.954 (0.50), 7.960 (0.46), 8.367 (0.62), 8.373 (0.62), 8.387 (0.56), 8.394 (0.56), 8.479 (1.66), 8.480 (1.93), 8.734 (1.75), 8.980 (0.91), 8.987 (0.82), 10.519 (1.23).
1-100	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.56), 0.008 (1.39), 3.287 (0.43), 3.771 (1.39), 3.826 (16.00), 7.380 (1.69), 7.385 (1.71), 7.392 (1.72), 7.401 (1.86), 7.407 (1.89), 7.413 (2.21), 7.417 (1.86), 7.439 (1.82), 7.625 (0.99), 7.630 (1.10), 7.636 (1.17), 7.642 (1.15), 7.646 (1.05), 7.652 (1.02), 7.658 (0.92), 7.663 (0.88), 7.931 (1.65), 7.937 (1.69), 7.949 (1.71), 7.955 (1.61), 8.479 (6.19), 8.481 (6.45), 8.507 (0.95), 8.513 (1.01), 8.526 (1.40), 8.528 (1.47), 8.535 (1.45), 8.548 (0.92), 8.554 (0.93), 8.578 (0.43), 8.734 (6.14), 8.852 (2.56), 8.859 (2.50), 10.472 (4.29).
1-101	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.59), 0.008 (1.57), 1.377 (5.35), 1.394 (11.14), 1.412 (5.24), 3.826 (16.00), 4.181 (1.68), 4.199 (5.33), 4.216 (5.20), 4.234 (1.52), 5.754 (0.67), 7.363 (1.83), 7.374 (1.77), 7.384 (2.36), 7.391 (2.29), 7.395 (2.47), 7.399 (1.96), 7.412 (2.18), 7.421 (1.88), 7.608 (1.39), 7.611 (1.89), 7.613 (2.08), 7.618 (2.22), 7.624 (2.26), 7.629 (2.21), 7.633 (1.93), 7.639 (1.80), 7.645 (1.72), 7.650 (0.95), 7.749 (1.85), 7.755 (1.70), 7.770 (1.80), 7.775 (1.63), 7.872 (1.77), 7.878 (1.73), 7.890 (1.78), 7.896 (1.62), 8.486 (6.84), 8.736 (6.18), 10.216 (4.27).
1-106	¹ H-NMR (500 MHz, DICHLOROMETHANE-d ₂) δ [ppm]: 1.205 (0.41), 3.400 (0.91), 3.402 (0.74), 3.477 (8.64), 3.788 (1.36), 3.832 (16.00), 3.846 (1.35), 7.073 (0.56), 7.093 (0.99), 7.111 (0.58), 7.416 (1.25), 7.432 (1.90), 7.441 (1.39), 7.449 (1.18), 7.459 (0.92), 7.463 (0.70), 7.584 (0.87), 7.601 (0.92), 7.848 (1.01), 7.855 (1.40), 7.875 (4.32), 7.890 (0.44), 8.063 (3.69), 8.622 (1.14).
1-127	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.49), 0.008 (1.07), 2.524 (0.76), 2.937 (12.88), 3.057 (16.00), 3.815 (10.31), 7.395 (0.71), 7.414 (2.03), 7.433 (1.83), 7.450 (1.07), 7.454 (1.92), 7.458 (1.22), 7.469 (0.58), 7.473 (0.84), 7.477 (0.45), 7.524 (0.99), 7.529 (1.31), 7.533 (0.90), 7.544 (0.71), 7.549 (0.94), 7.552 (0.63), 7.971 (1.43), 7.976 (2.27), 7.981 (1.29), 8.402 (4.14), 8.687 (3.86), 10.760 (2.12).
1-128	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-d) δ [ppm]: 0.000 (1.41), 3.797 (8.35), 3.836 (12.86), 3.843 (16.00), 3.856 (3.05), 3.858 (2.78), 6.865 (1.32), 6.872 (1.95), 6.877 (2.99), 6.881 (1.58), 6.896 (3.91), 7.032 (0.59), 7.036 (0.57), 7.054 (1.24), 7.058 (1.21), 7.076 (0.68), 7.080 (0.66), 7.128 (1.23), 7.138 (1.66), 7.141 (1.54), 7.150 (1.36), 7.447 (0.52), 7.461 (0.64), 7.468 (0.90), 7.483 (0.89), 7.490 (0.59), 7.504 (0.50), 7.538 (1.99), 7.575 (1.70), 7.578 (1.58), 7.587 (1.70), 7.591 (1.47), 7.709 (2.45), 7.720 (1.83), 7.723 (1.71), 7.730 (1.82), 7.732 (1.60), 7.834 (2.81), 7.986

10

20

30

40

	(2.38), 7.988 (2.65), 7.992 (2.50), 8.001 (2.17), 8.007 (1.97), 8.153 (4.22), 8.163 (3.69).
1-129	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.63), -0.008 (6.67), 0.008 (6.56), 0.146 (0.63), 1.147 (0.63), 2.328 (0.48), 2.665 (0.44), 2.670 (0.52), 3.771 (0.67), 3.800 (0.85), 3.814 (11.41), 3.937 (16.00), 5.754 (4.85), 7.339 (0.70), 7.359 (1.33), 7.362 (1.41), 7.387 (1.74), 7.408 (1.48), 7.415 (1.30), 7.436 (1.37), 7.630 (0.70), 7.635 (0.93), 7.646 (0.89), 7.651 (0.81), 7.656 (0.81), 7.667 (0.67), 7.765 (1.22), 7.771 (1.26), 7.787 (1.33), 7.792 (1.22), 7.849 (0.48), 7.863 (0.63), 7.870 (0.93), 7.885 (0.96), 7.892 (0.59), 7.906 (0.48), 8.531 (3.96), 8.737 (2.26), 8.742 (2.30), 10.272 (3.41).
1-130	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-d) δ [ppm]: 0.000 (1.19), 1.622 (1.64), 3.799 (6.41), 3.844 (16.00), 3.856 (3.35), 3.961 (8.30), 6.866 (1.15), 6.875 (2.18), 6.878 (2.84), 6.898 (3.29), 7.012 (0.62), 7.033 (1.10), 7.043 (0.58), 7.047 (0.56), 7.049 (0.49), 7.055 (0.64), 7.065 (0.95), 7.069 (0.83), 7.087 (0.50), 7.091 (0.44), 7.464 (0.44), 7.471 (0.61), 7.484 (0.60), 7.492 (0.41), 7.533 (1.43), 7.668 (0.70), 7.674 (0.87), 7.698 (2.19), 7.703 (1.53), 7.709 (2.13), 7.717 (0.96), 7.723 (0.68), 7.725 (0.55), 7.836 (2.08), 7.986 (2.31), 7.988 (2.51), 7.991 (2.33), 8.005 (1.55), 8.008 (1.63), 8.010 (1.43), 8.153 (3.69), 8.167 (2.45).
1-132	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.68), 0.008 (2.24), 3.286 (0.41), 3.814 (16.00), 7.354 (0.96), 7.356 (0.92), 7.374 (1.74), 7.377 (1.99), 7.378 (1.93), 7.399 (2.65), 7.406 (1.80), 7.421 (1.70), 7.427 (1.70), 7.864 (0.67), 7.879 (0.84), 7.886 (1.35), 7.901 (1.30), 7.908 (0.84), 7.923 (0.66), 8.524 (1.09), 8.532 (6.02), 8.545 (1.61), 8.551 (1.52), 8.565 (0.88), 8.571 (0.88), 8.741 (3.12), 8.746 (3.05), 8.874 (2.62), 8.881 (2.61), 10.531 (4.56).
1-133	¹ H-NMR (500 MHz, DICHLOROMETHANE-d ₂) δ [ppm]: 0.000 (0.53), 3.398 (0.43), 3.410 (16.00), 3.829 (15.10), 6.810 (1.17), 6.811 (1.23), 6.816 (1.24), 6.817 (1.19), 6.827 (1.23), 6.828 (1.30), 6.833 (1.26), 6.834 (1.17), 6.964 (0.43), 6.970 (0.75), 6.981 (0.69), 6.984 (0.98), 6.988 (1.23), 6.990 (0.81), 7.002 (0.94), 7.501 (0.66), 7.513 (0.87), 7.519 (1.05), 7.529 (0.95), 7.534 (0.91), 7.547 (0.62), 7.849 (0.70), 7.854 (0.76), 7.864 (1.05), 7.866 (1.14), 7.869 (1.14), 7.871 (1.07), 7.881 (0.71), 7.886 (0.68), 7.998 (2.52), 8.001 (2.50), 8.142 (3.92), 8.176 (1.98), 8.181 (1.88).
1-134	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.92), 0.008 (0.86), 3.804 (0.47), 3.821 (16.00), 7.311 (1.34), 7.331 (2.91), 7.351 (1.66), 7.376 (1.70), 7.382 (1.68), 7.397 (1.75), 7.404 (1.69), 7.563 (0.91), 7.567 (1.06), 7.582 (1.60), 7.584 (1.78), 7.586 (1.73), 7.601 (0.86), 7.603 (0.83), 7.605 (0.81), 7.736 (0.93), 7.741 (1.02), 7.757 (1.79), 7.773 (0.90), 7.775 (0.91), 7.778 (0.84), 8.504 (0.95), 8.510 (1.01), 8.524 (1.65), 8.530 (1.87), 8.537 (5.74), 8.545 (1.13), 8.551 (0.99), 8.749 (3.21), 8.755 (3.05), 8.849 (2.71), 8.856 (2.68), 10.470 (4.17).
2-003	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.64), -0.008 (5.69), 0.008 (5.19), 0.146 (0.67), 2.073 (2.68), 2.327 (0.74), 2.366 (1.31), 2.465 (16.00), 2.670 (0.74), 2.674 (0.53), 2.710 (1.31), 3.286 (0.71), 3.833 (15.26), 7.382 (2.65), 7.388 (0.88), 7.399 (1.13), 7.404 (5.55), 7.410 (1.20), 7.421 (0.88), 7.427 (2.93), 8.072 (3.89), 8.076 (5.33), 8.089 (3.11), 8.097 (3.00), 8.106 (1.13), 8.111 (2.65), 8.577 (5.72), 8.579 (6.53), 8.748 (3.64), 8.753 (3.57), 8.837 (5.93), 10.173 (4.06).
2-004	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (3.40), 0.008 (3.32), 0.146 (0.41), 2.366 (0.44), 2.476 (16.00), 2.710 (0.43), 3.834 (15.30), 7.906 (4.24), 7.910 (2.90), 7.917 (2.90), 7.921 (4.44), 8.103 (3.02), 8.108 (3.05), 8.583 (6.05), 8.774 (3.52), 8.780 (3.53), 8.821 (5.10), 8.825 (3.12), 8.832 (3.18), 8.836 (5.17), 8.843 (6.10), 10.439 (3.94).
2-005	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.64), -0.008 (6.72), 0.008 (5.43), 0.146 (0.55), 2.073 (0.42), 2.327 (0.82), 2.366 (1.18), 2.524 (4.01), 2.710 (0.67), 3.286 (1.88), 3.836 (16.00), 7.889 (5.94), 7.893 (3.94), 7.900 (3.85), 7.904 (6.14), 8.508 (2.06), 8.516 (7.67), 8.537 (2.13), 8.542 (1.57), 8.591 (6.58), 8.593 (6.41), 8.822 (6.10), 8.826 (3.99), 8.833 (3.68), 8.837 (5.87), 8.861 (6.20), 10.720 (3.64).

10

20

30

40

2-008	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.25), 0.008 (2.02), 2.073 (3.44), 3.286 (0.71), 3.836 (16.00), 8.273 (2.62), 8.275 (2.59), 8.293 (3.03), 8.295 (3.05), 8.439 (4.09), 8.445 (4.26), 8.557 (2.31), 8.562 (2.29), 8.577 (1.97), 8.583 (2.00), 8.635 (6.89), 8.775 (4.13), 8.781 (3.92), 8.917 (6.29), 9.267 (2.59), 9.269 (3.03), 9.273 (2.95), 9.275 (2.62), 10.839 (3.89).
-------	--

【0352】

LC-MS データ

方法M1:

機器: Waters ACQUITY SQD UPLC System; カラム: Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50×1 mm; 10
 溶離液A: 1 Lの水+0.25 mLの99%ギ酸、溶離液B: 1 Lのアセトニトリル+0.25 mLの99%ギ酸; 勾配: 0.0分 90%A → 1.2分 5%A → 2.0分 5%A; オープン: 50℃; 流量: 0.40 mL/分; UV検出: 208–400 nm。

【0353】

方法M2:

機器: Agilent MS Quad 6150; HPLC: Agilent 1290; カラム: Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50×2.1 mm; 溶離液A: 1 Lの水+0.25 mLの99%ギ酸、溶離液B: 1 Lのアセトニトリル+0.25 mLの99%ギ酸; 勾配: 0.0分 90%A → 0.3分 90%A → 1.7分 5%A → 3.0分 5%A; オープン: 50℃ 20
 ; 流量: 1.20 mL/分; UV検出: 205–305 nm。

【0354】

方法M3:

機器 MS: Waters SQD; 機器 HPLC: Waters UPLC; カラム: Zorbax SB-Aq (Agilent)、50 mm×2.1 mm、1.8 μ m; 溶離液A: 水+0.025%ギ酸、溶離液B: アセトニトリル (ULC)+0.025%ギ酸; 勾配: 0.0分 98%A – 0.9分 25%A – 1.0分 5%A – 1.4分 5%A – 1.41分 98%A – 1.5分 98%A; オープン: 40℃; 流量: 0.600 mL/分; UV検出: DAD; 210 nm。 30

【0355】

方法M4:

機器: Waters ACQUITY SQD UPLC System; カラム: Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50×1 mm; 溶離液A: 1 Lの水+0.25 mLの99%ギ酸、溶離液B: 1 Lのアセトニトリル+0.25 mLの99%ギ酸; 勾配: 0.0分 95%A → 6.0分 5%A → 7.5分 5%A; オープン: 50℃; 流量: 0.35 mL/分; UV検出: 210–400 nm。

【表6】

Ex. No.	方 法	保 持 時 間 [分]	M+H
1-025	M1	1,12	549
1-042	M3	1,26	578
1-043	M3	1,3	597

1-044	M3	1,32	653
1-045	M3	1,41	638
1-046	M3	1,25	546
1-047	M3	1,24	584
1-048	M3	1,21	516
1-049	M1	1,22	554
1-050	M3	1,33	634
1-051	M3	1,24	608
1-052	M3	1,26	528
1-053	M3	1,33	568
1-054	M1	1,31	591
1-055	M3	1,22	512
1-056	M3	1,4	674
1-057	M3	1,31	616
1-058	M1	1,27	525
1-059	M3	1,38	602
1-060	M3	1,29	562
1-061	M3	1,22	530
1-062	M3	1,25	654
1-063	M3	1,3	620
1-064	M3	1,23	514
1-065	M3	1,31	556
1-066	M3	1,25	518
1-067	M3	1,26	552

10

20

30

40

1-068	M3	1,26	528
1-069	M3	1,28	568
1-070	M3	1,32	584
1-071	M3	1,3	566
1-072	M3	1,38	592
1-073	M3	1,27	566
1-074	M3	1,31	632
1-075	M3	1,25	573
1-076	M3	1,21	500
1-077	M3	1,28	540
1-078	M3	1,27	528
1-079	M3	1,29	542
1-080	M3	1,3	576
1-081	M3	1,22	553
1-082	M3	1,35	572
1-083	M3	1,43	652
1-084	M1	1,31	627
1-087	M1	1,12	563
1-088	M1	1,2	573
1-089	M2	1,51	567
1-090	M1	1,36	576
1-091	M1	1,3	580
1-092	M1	1,3	580
1-093	M1	1,22	592

10

20

30

40

1-094	M1	1,32	596
1-095	M1	1,28	596
1-096	M1	1,34	600
1-097	M1	1,38	592
1-098	M1	1,23	574
1-099	M1	1,28	583
1-100	M1	1,24	567
1-101	M1	1,33	619
1-106	M1	1,23	588
1-107	M3	1,28	594
1-108	M3	1,29	576
1-109	M3	1,35	630
1-110	M3	1,32	602
1-111	M3	1,38	644
1-112	M3	1,27	634
1-113	M3	1,35	588
1-114	M3	1,31	592
1-115	M3	1,35	636
1-116	M3	1,3	630
1-117	M3	1,26	568
1-118	M3	1,29	578
1-119	M3	1,34	624
1-120	M3	1,35	638
1-121	M3	1,27	580

10

20

30

40

1-122	M3	1,37	650
1-123	M3	1,31	591
1-124	M3	1,31	590
1-125	M3	1,29	576
1-126	M3	1,29	614
1-127	M1	1,14	525
1-128	M1	1,22	572
1-129	M1	1,25	614
1-130	M1	1,234	614
1-132	M1	1,22	585
1-133	M4	4,09	599
1-134	M1	1,23	567
2-003	M1	1,13	563
2-004	M1	0,98	546
2-005	M1	1,08	550
2-006	M1	1,09	565
2-007	M1	1,25	613
2-008	M1	1,21	591

10

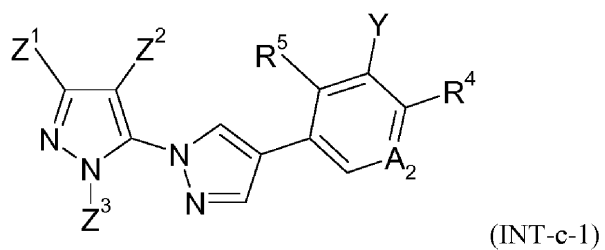
20

30

40

【表 7】

中間体



式 (INT-c-1) で表される本発明の化合物は、一般式7 ($Y = NO_2$) 又は一般式8 ($Y = NH_2$) [式中、 $A_1 = CH$, $A_3 = CR^4$, $A_4 = CR^5$ 及び $E_1 = N$, $E_2 = E_3 = CH$] で表される化合物である

Ex. No.	Z^1	Z^2	Z^3	A_2	R^4	R^5	Y
INT-001	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	H	NO_2
INT-002	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	H	NH_2
INT-003	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	F	H	NO_2
INT-004	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	F	H	NH_2
INT-005	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	Cl	H	NO_2
INT-006	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	Cl	H	NH_2
INT-007	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	F	NO_2
INT-008	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	F	NH_2
INT-009	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	MeO	NO_2
INT-010	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	H	MeO	NH_2
INT-011	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	N	H	H	NH_2
INT-012	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	N	Cl	H	NH_2
INT-013	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	F	F	NO_2
INT-014	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	CH	F	F	NH_2
INT-015	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	N	F	H	NH_2
INT-016	CF_2CF_3	CF_3	CH_3	N	CH_3	H	NH_2

【 0 3 5 6 】

中間体に関する分析データ

中間体に関する NMR ピークリスト

【 表 8 】

実施例 INT-001: ^1H-NMR(400,0 MHz, DMSO): $\delta = 8,991(6,2); 8,699(6,9); 8,563(2,3); 8,559(3,6); 8,554(2,2); 8,201(1,9); 8,197(1,4); 8,181(2,0); 8,180(1,9); 8,177(1,7); 8,174(1,7); 8,171(1,6); 8,168(1,5); 8,166(1,4); 8,153(1,7); 8,151(1,5); 8,147(1,7); 8,145(1,3); 7,769(2,2); 7,749(3,6); 7,729(1,8); 3,846(16,0); 3,775(0,4); 3,328(9,6); 2,527(0,5); 2,514(9,5); 2,510(18,6); 2,505(23,9); 2,501(16,8); 2,496(7,9); 1,398(2,4); 0,008(2,4); 0,000(53,5); -0,009(1,9)$
実施例 INT-002: ^1H-NMR(400,0 MHz, DMSO): $\delta = 8,548(6,1); 8,299(6,8); 7,087(1,2); 7,068(2,8); 7,047(1,7); 6,827(5,3); 6,823(6,0); 6,806(1,9); 6,527(1,4); 6,523(2,0); 6,520(1,3); 6,505(1,5); 6,502(1,5); 5,158(2,6); 4,056(0,3); 4,038(1,1); 4,021(1,1); 4,003(0,4); 3,806(16,0); 3,327(20,5); 2,525(0,6); 2,511(13,9); 2,507(27,9); 2,503(36,3);$

2,498(25,7); 2,494(12,2); 1,989(4,7); 1,398(0,4); 1,193(1,2); 1,175(2,5); 1,158(1,2); 0,008(1,0); 0,000(26,5); -0,009(0,9)	
実施例 INT-003: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,924(6,1); 8,651(6,7); 8,536(0,5); 8,530(0,5); 8,518(0,5); 8,512(0,6); 8,502(1,8); 8,496(1,9); 8,484(1,9); 8,478(1,9); 8,218(0,3); 8,180(1,0); 8,174(1,1); 8,170(1,2); 8,164(1,1); 8,158(1,2); 8,152(1,2); 8,148(1,2); 8,142(1,0); 7,778(0,4); 7,756(0,5); 7,750(0,5); 7,729(2,0); 7,708(1,8); 7,702(2,0); 7,680(1,7); 3,836(16,0); 3,733(0,9); 3,329(28,0); 2,509(25,6); 2,504(33,4); 2,500(25,5); 1,990(0,9); 1,398(14,1); 1,176(0,5); 0,000(5,0)	
実施例 INT-005: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,932(5,9); 8,656(6,2); 8,611(0,6); 8,607(0,6); 8,575(0,7); 8,463(4,1); 8,459(3,8); 8,289(0,9); 8,283(0,8); 8,235(0,8); 8,217(0,4); 8,211(0,3); 8,070(1,9); 8,065(1,7); 8,049(2,3); 8,044(2,1); 7,988(0,9); 7,963(0,6); 7,942(0,6); 7,912(0,5); 7,891(0,6); 7,873(3,7); 7,852(3,0); 7,800(0,5); 7,780(0,5); 7,767(0,4); 7,762(0,4); 6,691(0,6); 6,687(0,8); 3,833(16,0); 3,732(3,7); 3,330(49,3); 2,672(0,4); 2,503(63,4); 2,329(0,4); 1,990(1,2); 1,398(1,0); 1,193(0,3); 1,176(0,6); 1,158(0,3); 0,000(2,9)	10
実施例 INT-006: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,588(6,0); 8,318(6,6); 7,250(3,9); 7,230(4,3); 7,053(4,0); 7,048(4,2); 6,877(2,4); 6,872(2,3); 6,856(2,2); 6,851(2,1); 5,758(1,6); 5,427(5,0); 3,806(16,0); 3,331(66,3); 2,672(0,4); 2,525(0,9); 2,512(22,4); 2,507(45,9); 2,503(60,4); 2,498(43,4); 2,494(20,7); 2,329(0,4); 0,008(0,6); 0,000(18,7); -0,009(0,7)	
実施例 INT-007: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,926(6,0); 8,653(6,7); 8,536(1,2); 8,530(1,3); 8,518(1,2); 8,512(1,3); 8,502(1,8); 8,497(1,9); 8,485(1,8); 8,479(1,8); 8,251(0,7); 8,244(0,7); 8,240(0,8); 8,234(0,7); 8,229(0,8); 8,222(0,8); 8,218(0,8); 8,212(0,7); 8,181(0,9); 8,175(1,0); 8,170(1,1); 8,164(1,0); 8,159(1,1); 8,153(1,1); 8,149(1,1); 8,143(0,9); 7,778(1,3); 7,756(1,2); 7,751(1,4); 7,730(2,5); 7,709(1,8); 7,703(1,9); 7,681(1,7); 3,837(16,0); 3,333(29,8); 2,527(0,7); 2,513(13,7); 2,509(27,5); 2,505(36,0); 2,500(25,7); 2,496(12,3); 1,991(0,6); 1,398(1,9); 0,000(4,9)	20
実施例 INT-008: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,614(0,8); 8,537(5,9); 8,374(0,9); 8,291(6,5); 7,064(1,5); 7,043(2,0); 7,035(1,8); 7,029(2,0); 7,024(2,0); 7,014(2,1); 7,007(1,9); 7,002(1,9); 6,841(1,1); 6,835(1,1); 6,830(1,3); 6,824(1,2); 6,820(1,1); 6,814(1,0); 6,809(1,0); 6,804(0,9); 5,232(5,0); 3,835(0,5); 3,805(16,0); 3,332(43,9); 2,512(19,3); 2,508(37,2); 2,503(47,4); 2,499(33,8); 2,495(16,3); 1,990(1,0); 1,398(3,3); 1,175(0,5); 0,008(0,9); 0,000(16,5); -0,009(0,6)	
実施例 INT-009: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,823(4,1); 8,553(4,4); 8,095(1,4); 8,091(1,5); 8,075(1,6); 8,071(1,5); 7,880(1,5); 7,876(1,5); 7,860(1,7); 7,856(1,6); 7,459(1,6); 7,439(2,7); 7,419(1,4); 5,758(0,4); 3,826(10,4); 3,740(16,0); 3,331(21,6); 2,527(0,4); 2,513(9,2); 2,509(18,2); 2,504(23,4); 2,500(16,8); 2,495(8,1); 0,000(6,9)	30
実施例 INT-012: ¹ H-NMR(400,0 MHz, DMSO): δ = 8,718(3,0); 8,431(3,4); 8,430(2,9); 7,966(2,2); 7,961(2,2); 7,343(2,2); 7,337(2,1); 5,684(2,9); 3,933(2,3); 3,815(8,1); 3,329(29,3); 2,508(20,1); 2,503(24,5); 2,499(18,2); 1,990(1,1); 1,176(0,6); 1,070(16,0); 0,000(0,8)	

【 0 3 5 7 】

中間体に関する LC - MS データ

【 表 9 】

Ex. No.	方 法	保 持 時 間 [分]	M+H
INT-014	M1	1,20	462
INT-015	M1	1,09	445
INT-016	M1	0,80	441

【 0 3 5 8 】

生物学の実施例

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - 成体ネコノミを用いた

10

20

30

40

50

インビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9 mgの活性成分を、最初に、1 mLのアセトン p. a. に溶解させ、次いで、アセトン p. a. を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250 µL の該溶液を 25 mL 容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44.7 cm² の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5 µg/cm² の面積基準薬量が達成される。

【0359】

溶媒を蒸発させた後、該試験管に 5～10 匹の成体ネコノミ（*Ctenocephalides felis*）を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。48 時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該試験管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを試験管の底に落とす。試験管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0360】

この試験において、ある物質が、5 µg/cm² の施用量で少なくとも 80 % の効力を達成すれば、その物質は、ネコノミ（*Ctenocephalides felis*）に対して良好な効力を示す。100 % の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味する。0 % の効力は、損傷を受けたネコノミが無かったことを意味する。

【0361】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5 µg/cm²（500 g/h a）の施用量で、100 % の効力を示す： 1-001、1-003、1-004、1-006、1-010、1-012、1-013、1-016、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-031、1-034、1-036、1-037、1-040、1-041、1-049、1-058、1-064、1-066、1-068、1-069、1-073、1-076、1-081、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-091、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-127、2-005、2-006。

【0362】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5 µg/cm²（500 g/h a）の施用量で、80 % の効力を示す： 1-039、1-060、1-083。

【0363】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg/cm²（100 g/h a）の施用量で、80 % の効力を示す： 1-014。

【0364】

クリイロコイタマダニ（*Rhipicephalus sanguineus*）— 成体クリイロコイタマダニを用いたインビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9 mgの活性成分を、最初に、1 mLのアセトン p. a. に溶解させ、次いで、アセトン p. a. を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250 µL の該溶液を 25 mL 容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44.7 cm² の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5 µg/cm² の面積基準薬量が達成される。

【0365】

溶媒を蒸発させた後、該試験管に 5～10 匹の成体クリイロコイタマダニ（*Rhipicephalus sanguineus*）を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、暗所において水平位でインキュベートする。48 時間経過した後、効力を求める。この目的のために、トントンと叩いてクリイロコイタマダニを試験管の床面に落とし、5 分を超えない時間、ホットプレート上で 45～50 °C で

インキュベートする。試験管の床面上で動かないままにいるか又は這い上がることによって熱を意図的に避けることができないような動きがギクシャクとしているクリイロコイタマダニは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0366】

この試験において、ある物質が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成すれば、その物質は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのクリイロコイタマダニが死んだか又は死にかけていることを意味する。0%の効力は、損傷を受けたクリイロコイタマダニが無かったことを意味する。

【0367】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($500 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、100%の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-007、1-008、1-009、1-010、1-012、1-013、1-014、1-016、1-017、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-029、1-031、1-032、1-034、1-036、1-038、1-040、1-041、1-042、1-048、1-049、1-054、1-058、1-060、1-064、1-066、1-068、1-069、1-073、1-075、1-076、1-077、1-078、1-081、1-085、1-086、1-088、1-089、1-090、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-099、1-100、1-101、1-117、1-121、1-127、2-001、2-003。

【0368】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($500 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、80%の効力を示す： 1-011、1-015、1-030、1-035、1-055、1-061、1-070、1-084、1-087、1-098、2-006。

【0369】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($100 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、100%の効力を示す： 1-033。

【0370】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $1 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($100 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、80%の効力を示す： 1-043、2-005、2-007。

【0371】

アンブリオンマ・ヘバラエウム (*Amblyomma hebraeum*) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0372】

マダニ (アンブリオンマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)) の幼虫を孔があけてあるプラスチック製カップの中に配置し、所望濃度に1分間浸漬する。そのマダニを濾紙に載せてペトリ皿内に移し、人工気象室 (climate-controlled cabinet) 内に保存する。

【0373】

42日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全てのマダニが死んだことを意味し、0%は、死んだマダニが無かったことを意味する。

【0374】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： 1-022、1-024、1-025、1-038、1-040、1-041、1-088

10

20

30

40

50

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： 1-087。

【0375】

オウシマダニ (Boophilus microplus) - 浸漬試験

被験動物： Parkhurst 系統 (SP-抵抗性) のオウシマダニ (Boophilus microplus)

溶媒： ジメチルスルホキシド

10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドに溶解させる。適切な配合物を製造するために、活性成分の該溶液をいずれの場合にも水で希釈して所望の濃度とする。

10

【0376】

この活性成分配合物をピペットで管の中に入れる。8~10匹の充血した成体雌オウシマダニ (Boophilus microplus) を孔を有するさらなる管の中に移す。その管を活性成分の該配合物の中に浸漬し、全てのマダニを完全に濡らす。当該液体が流れ落ちた後、マダニをプラスチック製皿の中のフィルターディスクに移し、人工気象室 (climate-controlled room) の中に保存する。

【0377】

その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室 (climate-controlled cabinet) の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無かったことを意味し、0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

20

【0378】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： 1-004、1-022、1-024、1-025、1-026、1-027、1-038、1-040、1-041、1-049、1-060、1-073、1-080、1-087、1-088、1-089、1-094、1-098、1-099、1-100。

【0379】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%の効力を示す： 1-001。

30

【0380】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： 1-010、1-042。

【0381】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： 1-037、2-001。

【0382】

オウシマダニ (Boophilus microplus) - 注入試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

40

【0383】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (Boophilus microplus) の腹部に1μLの該活性成分溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室 (climate-controlled room) の中で維持する。

【0384】

その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室 (climate-controlled cabinet) の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無かったことを意味し、0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

50

【0385】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μ gの施用量で、100%の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-018、1-019、1-020、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-029、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-040、1-041、1-042、1-043、1-046、1-047、1-048、1-049、1-050、1-052、1-054、1-055、1-057、1-058、1-059、1-060、1-061、1-062、1-063、1-064、1-065、1-066、1-067、1-068、1-069、1-070、1-071、1-073、1-075、1-076、1-077、1-078、1-079、1-080、1-081、1-082、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-107、1-108、1-110、1-114、1-115、1-116、1-117、1-118、1-119、1-121、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、2-001、2-002、2-003、2-004、2-005、2-006、2-007。

10

20

【0386】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μ gの施用量で、95%の効力を示す： 1-112。

【0387】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μ gの施用量で、90%の効力を示す： 1-074。

【0388】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μ gの施用量で、80%の効力を示す： 1-083、1-109、1-111。

30

【0389】

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - 経口試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させる。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

【0390】

頂部と底部がガーゼで閉じられているチャンバーの中に、餌を与えていない約20匹の成体ネコノミ (Ctenocephalides felis) を入れる。下端部がパラフィルムで閉じられている金属製円筒を該チャンバーの上に配置する。該円筒は、血液/活性成分調製物を含んでおり、これは、パラフィルム膜を通してネコノミによって摂取され得る。

40

【0391】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを意味し、0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0392】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、

50

1-029、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-040、1-041、1-042、1-043、1-047、1-049、1-055、1-058、1-060、1-061、1-062、1-064、1-066、1-067、1-068、1-069、1-070、1-073、1-075、1-076、1-077、1-081、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-116、1-117、1-121、1-126、1-127、2-001、2-003、2-004、2-005、2-006、2-007。

【0393】

10

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%効力を示す： 1-020、1-048、1-057、1-079、1-080。

【0394】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%効力を示す： 1-052、1-063、1-065、1-071、1-082、1-115、1-123。

【0395】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%効力を示す： 1-021、1-078。

【0396】

20

ヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0397】

約20匹のヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性成分調製物を含んでいる被験容器の中に移す。

【0398】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのヒツジキンバエ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだヒツジキンバエ幼虫が無かったことを意味する。

30

【0399】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-008、1-009、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-016、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-029、1-030、1-031、1-032、1-033、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-040、1-041、1-042、1-043、1-046、1-047、1-049、1-050、1-052、1-054、1-055、1-057、1-058、1-060、1-062、1-064、1-067、1-068、1-069、1-070、1-071、1-073、1-075、1-077、1-078、1-079、1-081、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-116、1-117、1-119、1-121、1-126、1-127、2-001、2-003、2-004、2-005、2-006、2-007。

40

【0400】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%の効力を示す： 1-048、1-076。

【0401】

50

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： 1-020。

【0402】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： 1-065、1-066、1-115。

【0403】

イエバエ (*Musca domestica*) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

10

【0404】

砂糖溶液と所望濃度の活性成分配合物で処理されたスポンジを含んでいる容器に、10匹の成体イエバエ (*Musca domestica*) を生息させる。

【0405】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し、0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。

【0406】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-006、1-007、1-010、1-019、1-024、1-025、1-027、1-028、1-034、1-035、1-036、1-040、1-055、1-068、1-075、1-077、1-084、1-086、1-087、1-089、1-094、1-099、1-100、1-127、2-001、2-003。

20

【0407】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： 1-013、1-014、1-026、1-037、1-073、1-096、1-126、2-005、2-006。

【0408】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： 1-031、1-032、1-047、1-049、1-058、1-071、1-119、2-004。

30

【0409】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

40

【0410】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0411】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0412】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： 1-016、1-031。

50

【0413】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： 1-001、1-006、1-009、1-010、1-025、1-026、1-027、1-036、1-040、1-041、1-064、1-076、1-081、1-086、1-098、1-099、1-100。

【0414】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： 1-003、1-012、1-017、1-019、1-033、1-048、1-087、1-089。

【0415】

10

マスタードビートル (*Phaedon cochleariae*) - 噴霧試験

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1000 ppm の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0416】

ハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (*mustard beetle*) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫を寄生させる。

20

【0417】

7 日間経過した後、効力 (%) を求める。100 % は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し、0 % は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

【0418】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： 1-009、1-016、1-018、1-031。

【0419】

30

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、83 % の効力を示す： 1-029。

【0420】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-010、1-011、1-012、1-013、1-014、1-015、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-047、1-050、1-054、1-055、1-060、1-064、1-067、1-068、1-069、1-071、1-073、1-076、1-081、1-084、1-085、1-086、1-087、1-088、1-089、1-090、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-116、1-121、1-126、1-127、2-001、2-003、2-004、2-005、2-006、2-007。

40

【0421】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、83 % の効力を示す： 1-033。

【0422】

50

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1000 ppm の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0423】

トウモロコシ (Zea mays) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (armyworm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

10

【0424】

7 日間経過した後、効力 (%) を求める。100 % は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し、0 % は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0425】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： 1-009、1-016、1-018、1-029、1-030、1-031。

20

【0426】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： 1-001、1-003、1-004、1-005、1-006、1-007、1-010、1-012、1-013、1-014、1-015、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-034、1-035、1-036、1-037、1-038、1-039、1-040、1-041、1-043、1-052、1-054、1-055、1-064、1-067、1-068、1-069、1-071、1-073、1-076、1-078、1-081、1-084、1-086、1-087、1-088、1-089、1-091、1-092、1-093、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-117、1-121、1-127、2-001、2-003、2-004、2-005、2-006。

30

【0427】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、83 % の効力を示す： 1-002、1-057、1-058、1-060、1-085、1-094、1-116。

【0428】ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験；OP 抵抗性

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

40

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1000 ppm の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0429】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

50

【0430】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0431】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： 1-009、1-016。

【0432】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： 1-031。

【0433】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の効力を示す： 1-001、1-003、1-004、1-006、1-010、1-012、1-013、1-015、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-028、1-029、1-033、1-034、1-035、1-038、1-039、1-040、1-041、1-042、1-043、1-046、1-047、1-048、1-052、1-053、1-054、1-058、1-060、1-063、1-064、1-065、1-067、1-071、1-073、1-078、1-081、1-085、1-087、1-088、1-089、1-091、1-092、1-093、1-094、1-095、1-096、1-097、1-098、1-099、1-100、1-101、1-108、1-121、2-001、2-003、2-004、2-006。

【0434】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の効力を示す： 1-007、1-011、1-014、1-018、1-055、1-068、1-069、1-076、1-086。

【0435】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20g/haの施用量で、100%の効力を示す： 2-005。

【0436】

アノフェレス (Anopheles) 試験 (ANPHGB 表面処理)

溶媒： アセトン+2000ppmのナタネ油メチルエステル (RME)

活性成分の適切な配合物を製造するために、該活性成分を上記溶媒に溶解させる (2mg/mL)。その活性成分配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ガンビエハマダラカ (Anopheles gambiae) 種の系統RSPH (homozygote kdr) の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分間である。

【0437】

処理された表面に接触させてから24時間経過した後、死亡率(%)を求める。100%は、全ての蚊が死んだことを意味し、0%は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0438】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： 1-001、1-023、1-024、1-036、1-040。

【0439】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： 1-024、1-127。

【0440】

アノフェレス (Anopheles) 試験 (ANPHFU 表面処理)

溶媒： アセトン+2000ppmのナタネ油メチルエステル (RME)

活性成分の適切な配合物を製造するために、該活性成分を上記溶媒に溶解させる (2mg

10

20

30

40

50

g/mL)。その活性成分配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ハマダラカ (*Anopheles funestus*) 種の系統 FUMOZ-R (Hunt et al., Med Vet Entomol. 2005 Sep; 19 (3): 271-5) の成体蚊を配置する。暴露時間は、30 分間である。

【0441】

処理された表面に接触させてから 24 時間経過した後、死亡率 (%) を求める。100 % は、全ての蚊が死んだことを意味し、0 % は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0442】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 mg/m² の施用量で、90-100 % の効力を示す： 1-001、1-022、1-023、1-024、1-025、1-036、1-037、1-040、1-073。

10

【0443】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 mg/m² の施用量で、90-100 % の効力を示す： 1-001、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-036、1-040、1-081、1-127。

【0444】

アエデス (*Aedes*) 試験 (AEDSAE 表面処理)

溶媒： アセトン + 2000 ppm のナタネ油メチルエステル (RME)

20

活性成分の適切な配合物を製造するために、該活性成分を上記溶媒に溶解させる (2 mg/mL)。その活性成分配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*) 種の系統 MONEIM の成体蚊を配置する。暴露時間は、30 分間である。

【0445】

処理された表面に接触させてから 24 時間経過した後、死亡率 (%) を求める。100 % は、全ての蚊が死んだことを意味し、0 % は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0446】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 mg/m² の施用量で、90-100 % の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-006、1-010、1-012、1-013、1-014、1-016、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-034、1-035、1-036、1-037、1-073、1-081、1-085、1-094、1-099、1-100、1-127、2-001。

30

【0447】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 mg/m² の施用量で、90-100 % の効力を示す： 1-001、1-002、1-003、1-006、1-010、1-012、1-013、1-014、1-016、1-017、1-019、1-022、1-023、1-024、1-025、1-026、1-027、1-034、1-035、1-036、1-037、1-040、1-073、1-081、1-086、1-094、1-099、1-100、1-127、2-001。

40

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2014/079440

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D401/14 C07D231/38 A01N43/56
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2012/080376 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 21 June 2012 (2012-06-21) cited in the application	2-17
A	the whole document	1
Y	WO 2012/107434 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 16 August 2012 (2012-08-16) cited in the application	2-17
A	the whole document	1
Y,P	WO 2014/122083 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG [DE]) 14 August 2014 (2014-08-14) cited in the application	2-17
A,P	the whole document	1

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 February 2015

Date of mailing of the international search report

09/03/2015

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Von Daacke, Axel

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2014/079440

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012080376 A1	21-06-2012	AR 084308 A1 CN 103261188 A EP 2651921 A1 US 2013253011 A1 UY 33808 A WO 2012080376 A1	08-05-2013 21-08-2013 23-10-2013 26-09-2013 31-07-2012 21-06-2012
WO 2012107434 A1	16-08-2012	AR 085318 A1 CA 2826059 A1 CN 103354811 A EA 201300894 A1 EP 2673270 A1 KR 20140051835 A UY 33895 A WO 2012107434 A1	25-09-2013 16-08-2012 16-10-2013 30-01-2014 18-12-2013 02-05-2014 28-09-2012 16-08-2012
WO 2014122083 A1	14-08-2014	UY 35309 A WO 2014122083 A1	29-08-2014 14-08-2014

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/079440

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D401/14 C07D231/38 A01N43/56
ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2012/080376 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 21. Juni 2012 (2012-06-21) in der Anmeldung erwähnt	2-17
A	das ganze Dokument	1
Y	WO 2012/107434 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 16. August 2012 (2012-08-16) in der Anmeldung erwähnt	2-17
A	das ganze Dokument	1
Y,P	WO 2014/122083 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 14. August 2014 (2014-08-14) in der Anmeldung erwähnt	2-17
A,P	das ganze Dokument	1

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
 ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

26. Februar 2015

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

09/03/2015

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Von Daacke, Axel

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/079440

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012080376	A1	21-06-2012	AR	084308 A1	08-05-2013
			CN	103261188 A	21-08-2013
			EP	2651921 A1	23-10-2013
			US	2013253011 A1	26-09-2013
			UY	33808 A	31-07-2012
			WO	2012080376 A1	21-06-2012

WO 2012107434	A1	16-08-2012	AR	085318 A1	25-09-2013
			CA	2826059 A1	16-08-2012
			CN	103354811 A	16-10-2013
			EA	201300894 A1	30-01-2014
			EP	2673270 A1	18-12-2013
			KR	20140051835 A	02-05-2014
			UY	33895 A	28-09-2012
			WO	2012107434 A1	16-08-2012

WO 2014122083	A1	14-08-2014	UY	35309 A	29-08-2014
			WO	2014122083 A1	14-08-2014

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード (参考)
C 0 7 D 231/12 (2006.01)		C 0 7 D 231/12	E	
C 0 7 D 413/14 (2006.01)		C 0 7 D 413/14		
A 6 1 K 31/422 (2006.01)		A 6 1 K 31/422		
C 0 7 D 405/14 (2006.01)		C 0 7 D 405/14		
C 0 7 D 487/04 (2006.01)		C 0 7 D 487/04	1 4 6	
A 6 1 K 31/42 (2006.01)		A 6 1 K 31/42		
A 6 1 K 31/506 (2006.01)		A 6 1 K 31/506		
A 6 1 K 31/519 (2006.01)		A 6 1 K 31/519		
A 6 1 P 33/14 (2006.01)		A 6 1 P 33/14		
A 0 1 N 43/56 (2006.01)		A 0 1 N 43/56	D	
A 0 1 N 43/76 (2006.01)		A 0 1 N 43/76		
A 0 1 N 43/90 (2006.01)		A 0 1 N 43/90	1 0 5	
A 0 1 N 43/80 (2006.01)		A 0 1 N 43/80	1 0 1	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)		A 0 1 P 7/04		
A 0 1 P 7/02 (2006.01)		A 0 1 P 7/02		

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
- (74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
- (74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
- (74)代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也
- (74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

- (72)発明者 シュヴァルツ, ハンスーゲオルク
ドイツ国、4 6 2 8 2 ・ドルステン、アウフ・デム・ベアーエンカンフ・8 2 ベー
- (72)発明者 マウエ, ミヒヤエル
ドイツ国、4 0 7 6 4 ・ランゲンフェルト、ブルネンシュトラッセ・1 8 アー
- (72)発明者 イルク, ケルシュティン
ドイツ国、5 0 6 7 0 ・ケルン、ノイツサー・パール・3 2
- (72)発明者 ゲルゲンス, ウルリヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2 ・ラティンゲン、フエステル・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 トウルベルク, アンドレアス
ドイツ国、4 2 7 8 1 ・ハーン、ジントーシュトラッセ・8 6
- (72)発明者 ホルストマン, セバステイアン
ドイツ国、5 1 3 8 1 ・レーパークーゼン、オーバー・デム・ホーフ・1 1
- (72)発明者 ケーベルリング, ヨハネス
ドイツ国、4 1 4 6 6 ・ノイス、アツアリエンシュトラッセ・3 0
- (72)発明者 リントナー, ニールズ
ドイツ国、4 2 1 1 5 ・ヴツパータル、ボーデルシュヴァイングヴァーク・4
- F ターム(参考) 4C050 AA01 BB06 CC08 EE04 FF03 GG01 HH04
4C063 AA03 BB09 CC22 CC29 CC51 CC52 CC75 CC76 CC81 CC92
CC94 DD12 DD22 EE01 EE03
4C086 AA01 AA02 AA03 BC36 BC42 BC67 BC69 CB08 GA02 GA04
GA07 GA08 GA09 NA14 ZB37
4H011 AC01 AC04 BB09 BB10