

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2024-539634

(P2024-539634A)

(43)公表日 令和6年10月29日(2024.10.29)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 8 A 2 B 0 2 2
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 8 Q 2 B 0 5 1
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	C S P 4 H 0 1 1
A 0 1 N 47/18 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
A 0 1 N 47/12 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 3
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全238頁) 最終頁に続く		

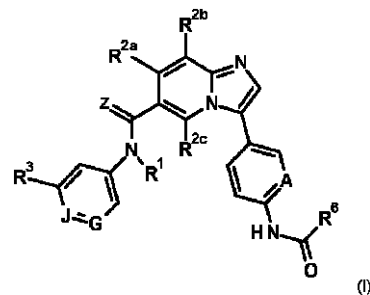
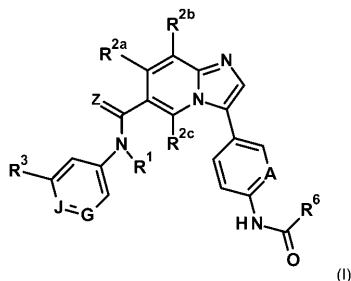
(21)出願番号	特願2024-522247(P2024-522247)	(71)出願人	520222106 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(86)(22)出願日	令和4年10月6日(2022.10.6)	(74)代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(85)翻訳文提出日	令和6年5月10日(2024.5.10)	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/077777	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(87)国際公開番号	WO2023/061838	(74)代理人	100111796 弁理士 服部 博信
(87)国際公開日	令和5年4月20日(2023.4.20)	(74)代理人	100123766 弁理士 松田 七重
(31)優先権主張番号	21202562.1		
(32)優先日	令和3年10月14日(2021.10.14)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		
(31)優先権主張番号	22183563.0		
(32)優先日	令和4年7月7日(2022.7.7)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA 最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 イミダゾ [1, 2-a] ピリジン誘導体

(57)【要約】

本発明は、式 (I)

【化1】



(式中、置換基は、請求項1に定義されているとおりである)

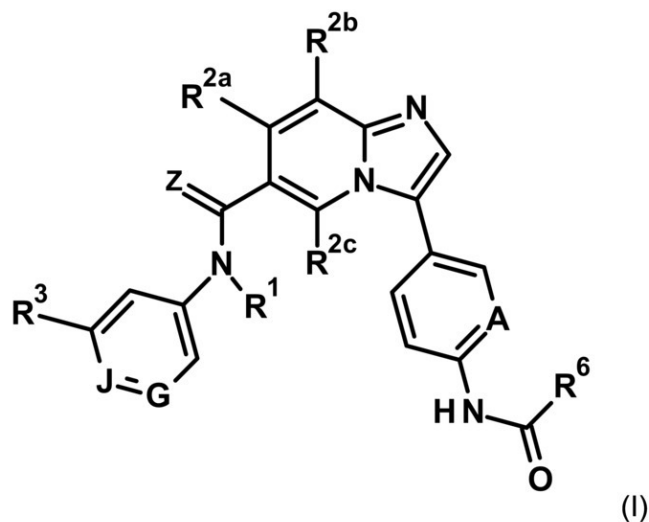
の化合物、式 (I) の化合物を調製するプロセス及び方法、請求項1に定義されている式 (I) の化合物を含む農薬組成物、これらの組成物の調製並びに植物病原性微生物、特に真菌による植物、収穫された食品作物、種子又は非生体材料の外寄生を駆除、予防又は防除するための、農業又は園芸におけるこれらの化合物又は組成物の使用に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、Zは、O又はSであり；

20

R¹は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルスルファニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルフィニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルホニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル及びCNから選択され、前記C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルスルファニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルフィニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルホニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル及びジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル基のそれぞれは、ハロゲン、ヒドロキシ及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

30

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシ、アミノ及びNH-C(=O)-C₁₋₆アルキルから独立して選択され；

Jは、CR⁴又はNであり；

Gは、CR⁵又はNであり；

JがNである場合、Gは、CR⁵であり；及びGがNである場合、Jは、CR⁴であり；

40

R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、前記C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボ

50

ニル、ジ C₁₋₆アルキルアミノカルボニル及び C₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；

A は、CH 又は N であり；及び

R⁶ は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノ、ジ C₁₋₆アルキルアミノ、C₁₋₆アルコシミアミノ及び C₁₋₆アルキル C₁₋₆アルコシミアミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい)

の化合物又はその塩若しくは N-オキシド。

10

【請求項 2】

A は、N であり；及び

R⁶ は、C₁₋₄アルキル及び C₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 3】

A は、CH であり；及び

R⁶ は、C₁₋₄アルキル及び C₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

20

【請求項 4】

R⁶ は、メチル、エチル及びメトキシから選択される、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 5】

R¹ は、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及び C₂₋₄アルキニルから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1～4 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 6】

J は、CR⁴ であり、且つ G は、CR⁵ であり；及び

30

R³、R⁴ 及び R⁵ は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、前記 C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及び C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】

J は、CR⁴ であり、且つ G は、N であり；及び

40

R³ 及び R⁴ は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN 及び C₂₋₄アルキニルから独立して選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 8】

J は、N であり、且つ G は、CR⁵ であり；及び

R³ 及び R⁵ は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN 及び C₂₋₄アルキニルから独立して選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

50

【請求項 9】

殺菌・殺カビ的に有効な量の、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 10】

追加の有効成分、適切な配合不活性成分、キャリア、補助剤及びそれらの任意の混合物の中から選択される少なくとも 1 種の化合物をさらに含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

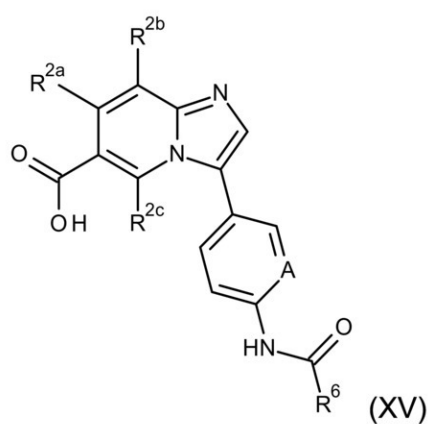
植物病原性病害を駆除、予防又は防除する方法であって、植物病原体、植物病原体の生息地又は植物病原体による被害を受けやすい植物若しくはその繁殖材料に、殺菌・殺カビ的に有効な量の、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物を適用することを含む方法。

10

【請求項 12】

式 (XV)

【化 2】



20

(式中、A は、CH 又は N であり；

R⁶ は、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルアミノ、ジ-C₁₋₆ アルキルアミノ、C₁₋₆ アルコキシアミノ及び C₁₋₆ アルキル-C₁₋₆ アルコキシアミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

30

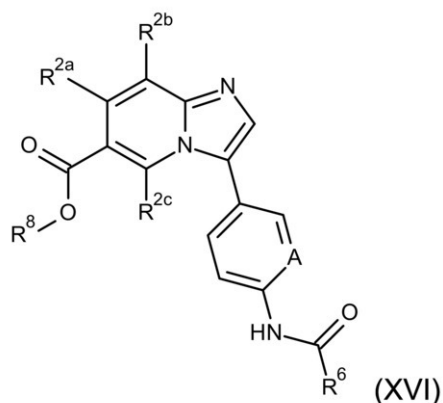
R^{2a}、R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₄ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アルコキシ、アミノ及び NH-C(=O)-C₁₋₆ アルキルから独立して選択される) の化合物、又は

式 (XVI)

40

50

【化 3】



10

(式中、A は、CH 又は N であり；

R⁶ は、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルアミノ、ジC₁₋₆ アルキルアミノ、C₁₋₆ アルコキシアミノ及びC₁₋₆ アルキルC₁₋₆ アルコキシアミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

20

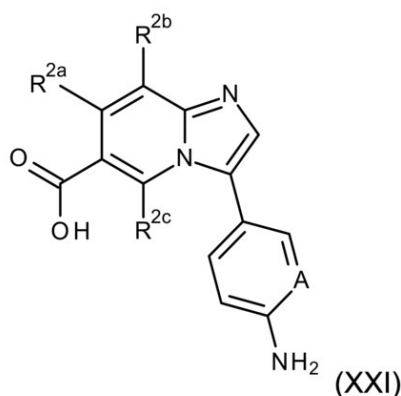
R⁸ は、C₁～C₆ アルキルであり；及び

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₄ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アルコキシ、アミノ及びNH C(O) C₁₋₆ アルキルから独立して選択される)の化合物。

【請求項 13】

式 (XXI)

【化 4】



30

(式中、A は、CH 又は N であり；及び

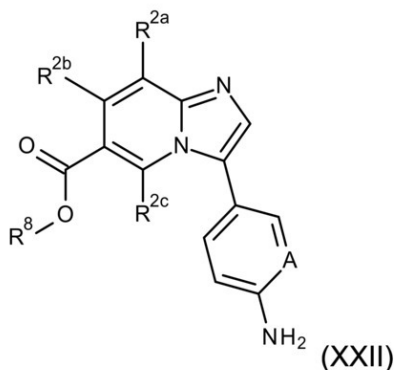
R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₄ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アルコキシ、アミノ及びNH C(O) C₁₋₆ アルキルから独立して選択される)の化合物、又は

40

式 (XXII)

50

【化 5】



10

(式中、A は、CH 又は N であり；

R⁸ は、C₁～C₆ アルキルであり；及び

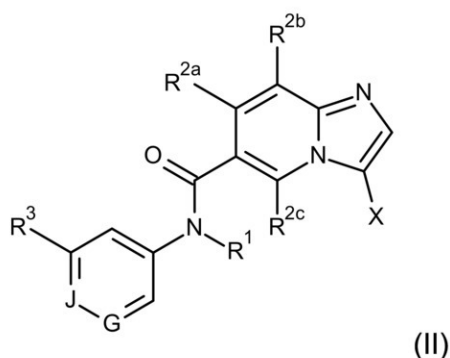
R^{2a}、R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₄ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アルコキシ、アミノ 及び NH C (O) C₁₋₆ アルキル から独立して選択される) の化合物。

20

【請求項 14】

式 (II)

【化 6】



30

(式中、R¹ は、C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ-C₁₋₄ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₃ アルキル、C₂₋₄ アルケニル、C₂₋₄ アルキニル、C₁₋₄ アルコキシ 及び CN から選択され、前記 C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ-C₁₋₄ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₃ アルキル、C₂₋₄ アルケニル、C₂₋₄ アルキニル 及び C₁₋₄ アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン 及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^{2a}、R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₄ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アルコキシ、アミノ 及び NH C (O) C₁₋₆ アルキル から独立して選択され；

40

J は、C R⁴ 又は N であり；

G は、C R⁵ 又は N であり；

J が N である場合、G は、C R⁵ であり；及び G が N である場合、J は、C R⁴ であり；

R³ 及び R⁵ は、H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ-C₁₋₆ アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルキル-C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルファニル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₁₋₆ アル

50

コキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-6} アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル及び C_{1-6} アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^4 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ、ハロゲン、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-6} アルキルカルボニル及びヒドロキシから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル及び C_{1-6} アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

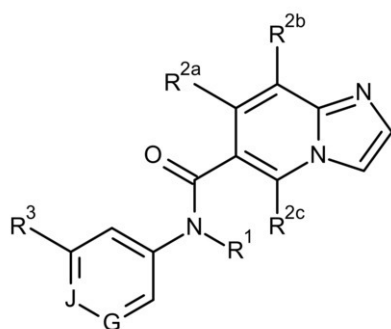
Xは、Cl、Br又はIである)

の化合物。

【請求項15】

式(XVII)

【化7】



(XVII)

(式中、 R^1 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ及びCNから選択され、前記 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル及び C_{1-4} アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ及びNHCO C_{1-6} アルキルから独立して選択され；

Jは、 CR^4 又はNであり；

Gは、 CR^5 又はNであり；

JがNである場合、Gは、 CR^5 であり；及びGがNである場合、Jは、 CR^4 であり

；及び

R^3 、 R^4 及び R^5 は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ、ハロゲン、 CN 、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、 C_{1-6} アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル及び C_{1-6} アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい)

10

の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、殺微生物活性、特に殺菌・殺カビ活性、より具体的には卵菌に対する活性を有する、例えば有効成分としての殺微生物性イミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体に関する。本発明は、これらのイミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体の調製、これらのイミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体の調製に有用な中間体、これらの中間体の調製、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体の少なくとも1つを含む農薬組成物、これらの組成物の調製及び植物病原性微生物、特に真菌、より具体的には卵菌による植物、収穫された食品作物、種子又は非生体材料の外寄生を駆除、防除又は予防するための、農業又は園芸におけるイミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体又は組成物の使用にも関する。

20

【背景技術】

【0002】

ここで、驚くべきことに、特定の新規なイミダゾ[1, 2-a]ピリジン誘導体が特に卵菌に対して有利な殺菌・殺カビ特性を有することが見出された。

30

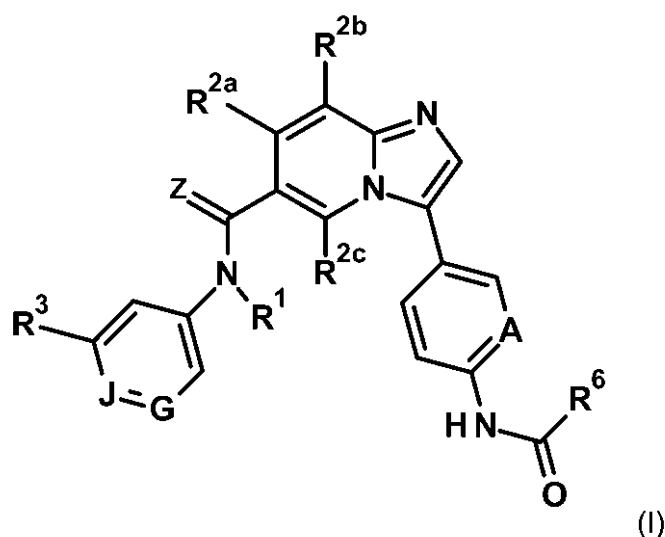
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

従って、第1の態様では、本発明は、実施形態1として、式(I)

【化1】



40

50

(式中、

Zは、O又はSであり、好ましくは、Zは、Oであり；

R¹は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルスルファニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルフィニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルホニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル及びCNから選択され、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルスルファニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルフィニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルホニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル及びジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル-C₁₋₆アルキル基のそれぞれは、ハロゲン、ヒドロキシ及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシ、アミノ及びNHCO-C₁₋₆アルキルから独立して選択され；

Jは、CR⁴又はNであり；

Gは、CR⁵又はNであり；

JがNである場合、Gは、CR⁵であり；及びGがNである場合、Jは、CR⁴であり；

R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル及びC₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

Aは、CH又はNであり；及び

R⁶は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノ、ジC₁₋₆アルキルアミノ、C₁₋₆アルコキシアミノ及びC₁₋₆アルキル-C₁₋₆アルコキシアミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい)

の化合物又はその塩若しくはN-オキシドを提供する。

【0004】

ZがOである好ましい実施形態1では、本発明は、式(I)

10

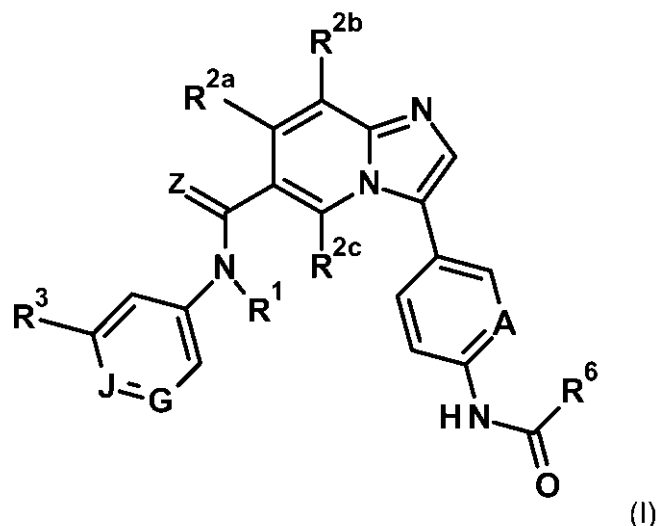
20

30

40

50

【化 2】



10

(式中、

R^1 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ及びCNから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル及び C_{1-4} アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

20

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ハロゲン、CN、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから独立して選択され；

Jは、 CR^4 又はNであり；

Gは、 CR^5 又はNであり；

JがNである場合、Gは、 CR^5 であり；及びGがNである場合、Jは、 CR^4 であり；

R^3 、 R^4 及び R^5 は、H、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

30

Aは、CH又はNであり；及び

R^6 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい)

の化合物又はその塩若しくはN-オキsidを提供する。

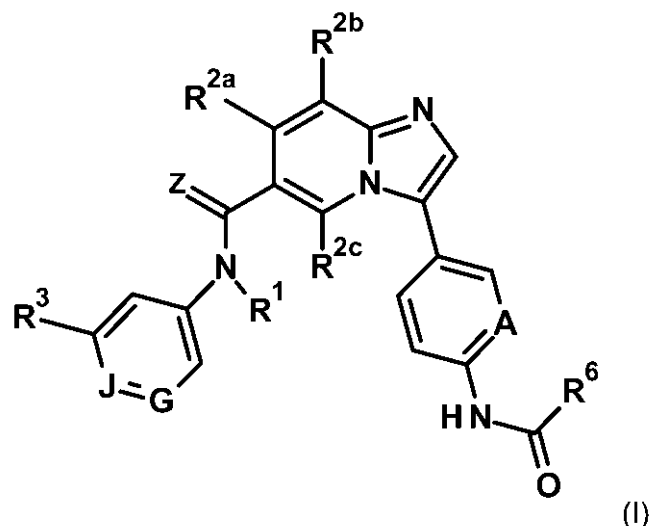
40

【0005】

ZがSである好ましい実施形態1では、本発明は、式(I)

50

【化 3】



10

(式中、

R^1 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ及びCNから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル及び C_{1-4} アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

20

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ハロゲン、CN、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから独立して選択され；

Jは、 CR^4 又はNであり；

Gは、 CR^5 又はNであり；

JがNである場合、Gは、 CR^5 であり；及びGがNである場合、Jは、 CR^4 であり；

R^3 、 R^4 及び R^5 は、H、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

30

Aは、CH又はNであり；及び

R^6 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい)

の化合物又はその塩若しくはN-オキシドを提供する。

40

【0006】

第2の態様では、本発明は、式(I)の化合物を含む農薬組成物、より具体的には殺菌・脱カビ的に有効な量の式(I)の化合物を含む農薬組成物を提供する。前記組成物は、追加の有効成分、適切な配合不活性成分、キャリア、補助剤及びそれらの任意の混合物の中から選択される少なくとも1種の化合物をさらに含むことができる。

【0007】

式(I)の化合物は、植物病原性微生物を防除するために用いられ得る。従って、植物病原体を防除するために、本発明に係る式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接又は植物病原体の生息地(特に植物病原体による被害を受けやすい植物)若しくは植物の繁殖材料に適用され得る。

50

【0008】

従って、第3の態様では、本発明は、植物病原体を駆除、予防又は防除するための、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0009】

第4の態様では、本発明は、植物病原体を駆除、予防又は防除する方法であって、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体又は前記植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）若しくは植物の繁殖材料に適用するステップを含む方法を提供する。

【0010】

式(I)の化合物は、植物病原性真菌、特に卵菌の駆除、予防又は防除に特に効果的である。従って、第5の態様では、本発明は、植物病原性真菌、特に卵菌を防除するための、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

10

【0011】

第6の態様では、本発明は、植物病原性真菌を駆除、予防又は防除する方法であって、前記植物病原性真菌又は前記植物病原性真菌の生息地（特に植物病原性真菌、特に卵菌による被害を受けやすい植物）若しくは植物の繁殖材料に、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物を適用することを含む方法を提供する。

【0012】

第7の態様では、本発明は、本発明でそれぞれ説明される式(XV)、式(XVI)、式(XXI)、式(XXII)、式(III)及び式(XVII)の化合物を提供する。

20

【0013】

1つの基が置換されていると示される場合（例えば、アルキル）、これは、他の基の一部であるこれらの基を含む（例えば、アルキルチオ中のアルキル）。

【発明を実施するための形態】

【0014】

定義：

－ 「ハロゲン」という用語は、フッ素（フルオロ又はF）、塩素（クロロ又はCl）、臭素（ブロモ又はBr）又はヨウ素（ヨード又はI）を指し、好ましくはフッ素、塩素又は臭素を指す。

30

【0015】

－ 本明細書において単独で又は化学基の一部として使用される「アルキル」という用語は、好ましくは1～6つの炭素原子を有する直鎖又は分岐の炭化水素を表し、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-エチルブチルを表す。1～4つの炭素原子を有するアルキル基が好ましく、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-ブチル又はt-ブチルである。

40

【0016】

－ 単独で又は化学基の一部としての「アルケニル」という用語は、好ましくは2～6つの炭素原子と少なくとも1つの二重結合とを有する直鎖又は分岐の炭化水素を表し、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,

50

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-プロペニルを表す。2~4つの炭素原子を有するアルケニル基が好ましく、例えば2-プロペニル、2-ブテニル又は1-メチル-2-プロペニルである。

10

【0017】

— 単独で又は化学基の一部としての「アルキニル」という用語は、好ましくは2~6つの炭素原子と少なくとも1つの三重結合とを有する直鎖又は分岐の炭化水素を表し、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-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-ヘキサジニルを表す。2~4つの炭素原子を有するアルキニルが好ましく、例えばエチニル、2-プロピニル又は2-ブチニル-2-プロペニルである。

20

【0018】

— 単独で又は化学基の一部としての「シクロアルキル」という用語は、好ましくは3~10個の炭素原子を有する飽和の又は部分的に不飽和の単環式、二環式又は三環式の炭化水素を表し、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である。3、4、5、6又は7つの炭素原子を有するシクロアルキルが好ましく、例えばシクロプロピル又はシクロブチルである。

30

【0019】

— ヒドロキシル又はヒドロキシは、-OH基を表す。

【0020】

各事例では、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N-オキシドとしての酸化型又は例えば農学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

40

【0021】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0022】

実施形態2として、

AがNであり；及び

R⁶がC₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1

50

による化合物が提供される。

【0023】

実施形態3として、

AがNであり；及び

R⁶がメチル、エチル及びメトキシから選択される、実施形態1又は2による化合物が提供される。

【0024】

実施形態4として、

AがNであり；及び

R⁶がメトキシである、実施形態1～3のいずれか1つによる化合物が提供される。

10

【0025】

実施形態5として、

AがCHであり；及び

R⁶がC₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1による化合物が提供される。

【0026】

実施形態6として、

AがCHであり；及び

R⁶がメチル、エチル及びメトキシから選択される、実施形態1～5のいずれか1つによる化合物が提供される。

20

【0027】

実施形態7として、

AがCHであり；及び

R⁶がメトキシである、実施形態1、5又は6のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0028】

実施形態8として、R¹がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びC₂₋₄アルキニルから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～7のいずれか1つによる化合物が提供される。

30

【0029】

実施形態9として、R¹がメチル、エチル、プロピル、-CH₂CH₂-O-CH₃、シクロプロピル、-CH₂-シクロプロピル、-CH₂-CF₃、-CH₂-C≡CH、CH₂CH₂CN及び-CH₂-CNから選択される、実施形態1～8のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0030】

実施形態10として、

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；及び

R³、R⁴及びR⁵がH、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～9のいずれか1つによる化合物が提供される。

40

【0031】

実施形態11として、

50

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；及び

R³、R⁴及びR⁵がH、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0032】

実施形態12として、

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；

R³及びR⁵がHであり；及び

R⁴がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0033】

実施形態13として、

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；

R³及びR⁵がHであり；及び

R⁴がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシ基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態12による化合物が提供される。

【0034】

実施形態14として、

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；

R³及びR⁵がHであり；及び

R⁴がメチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ブロモ、CN及びヒドロキシから選択される、実施形態12による化合物が提供される。

【0035】

実施形態15として、

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；

R³がHであり；及び

R⁴及びR⁵がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0036】

実施形態16として、

JがC₁₋₄⁴であり、且つGがC₁₋₄⁵であり；

R³がHであり；及び

R⁴及びR⁵がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態15による化合物が提供される。

【0037】

実施形態17として、

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R³がHであり；

R⁴がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシ基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

R⁵がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態15による化合物が提供される。

【0038】

実施形態18として、

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R³がHであり；

R⁴がメチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ブロモ、CN及びヒドロキシから選択され；及び

R⁵がメチル、-O-CH₂-CH₂-O-CH₃、-CH₂-CH₂O-CH₃、-O-CH₃、-CH₂-CF₂H、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シクロプロピル、-C≡CH、CN、-CF₃、イソプロピル及び-O-CF₂Hから選択される、実施形態15による化合物が提供される。

【0039】

実施形態19として、

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R³及びR⁴がHであり；及び

R⁵がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0040】

実施形態20として、

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R³及びR⁴がHであり；及び

R⁵がC₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル

、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態19による化合物が提供される。

【0041】

実施形態21として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 及び R^4 がHであり；及び

R^5 がメチル、 $-O-CH_2-CH_2-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2O-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CF_2H$ 、フルオロ、クロロ、ブromo、ヨード、シクロプロピル、 $-C\equiv CH$ 、CN、 $-CF_3$ 、イソプロピル及び $-O-CF_2H$ から選択される、実施形態19による化合物が提供される。

10

【0042】

実施形態22として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^4 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN及びヒドロキシから選択され、アルキル基が無置換であるか、又はハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

R^3 及び R^5 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1~10のいずれか1つによる化合物が提供される。

20

【0043】

実施形態23として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^4 がメチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ブromo、CN及びヒドロキシから選択され；及び

30

R^3 及び R^5 がメチル、 $-O-CH_2-CH_2-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2O-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-CH_2-CF_2H$ 、フルオロ、クロロ、ブromo、ヨード、シクロプロピル、 $-C\equiv CH$ 、CN、 $-CF_3$ 、イソプロピル及び $-O-CF_2H$ から独立して選択される、実施形態22による化合物が提供される。

【0044】

実施形態24として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；及び

R^3 、 R^4 及び R^5 がHである、実施形態1~10のいずれか1つによる化合物が提供される。

40

【0045】

実施形態25として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 及び R^5 がHであり；及び

R^4 がクロロ又はフルオロである、実施形態1~10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0046】

実施形態26として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

50

R^3 がHであり；
 R^4 がフルオロであり；及び
 R^5 がメチルである、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0047】

実施形態27として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 がHであり；

R^4 がフルオロであり；及び

R^5 が $-O-CH_2-CH_2-O-CH_3$ である、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

10

【0048】

実施形態28として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 がHであり；

R^4 がクロロ、フルオロ、ブromo又はヨードであり；及び

R^5 が $-O-CH_3$ である、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0049】

実施形態29として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 がHであり；

R^4 がHであり；及び

R^5 が $-CH_2-CF_2H$ である、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

20

【0050】

実施形態30として、

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^3 がHであり；

R^4 がHであり；及び

R^5 がクロロ、フルオロ、ブromo又はヨードである、実施形態1～10のいずれか1つによる化合物が提供される。

30

【0051】

実施形態31として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；及び

R^3 及び R^4 がH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～9のいずれか1つによる化合物が提供される。

40

【0052】

実施形態32として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；

R^3 がHであり；及び

R^4 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコ

50

キシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態31による化合物が提供される。

【0053】

実施形態33として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；及び

R^3 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^4 がHである、実施形態31による化合物が提供される。

【0054】

実施形態34として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；及び

R^3 及び R^4 がH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN及び C_{2-4} アルキニルから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ及び C_{2-4} アルキニル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態31による化合物が提供される。

【0055】

実施形態35として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；及び

R^3 及び R^4 がH、メチル、 $-OCH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_2H$ 、ハロゲン、 $-C\equiv C$ H及びCNから独立して選択される、実施形態34による化合物が提供される。

【0056】

実施形態36として、

Jが CR^4 であり、且つGがNであり；及び

R^3 及び R^4 がHである、実施形態34による化合物が提供される。

【0057】

実施形態37として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；及び

R^3 及び R^5 がH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1~9のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0058】

実施形態38として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；

R^3 がHであり；及び

R^5 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4}

4 アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態37による化合物が提供される。

【0059】

実施形態39として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；

R^3 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

R^5 がHである、実施形態37による化合物が提供される。

【0060】

実施形態40として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；及び

R^3 及び R^5 がH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN及び C_{2-4} アルキニルから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ及び C_{2-4} アルキニル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態37による化合物が提供される。

【0061】

実施形態41として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；及び

R^3 及び R^5 がH、メチル、 $-OCH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_2H$ 、ハロゲン、 $-C\equiv C$ H及びCNから独立して選択される、実施形態37による化合物が提供される。

【0062】

実施形態42として、

JがNであり、且つGが CR^5 であり；及び

R^3 及び R^5 がHである、実施形態37による化合物が提供される。

【0063】

好ましい実施形態10として、

AがNであり；

R^3 がHであり；

Jが CR^4 であり、且つGが CR^5 であり；

R^4 が C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシ基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^5 がH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、CN、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^6 が C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1~9のいずれか1つによる化合物が提供される。

【0064】

ZがOである好ましい実施形態10として、

AがNであり；

R³がHであり；

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R⁴がハロゲン又はCNであり；

R⁵がC₁₋₄アルコキシであり、C₁₋₄アルコキシ基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

R⁶がC₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～9のいずれか1つによる化合物が提供される。

10

【0065】

ZがSであるより好ましい実施形態10として、

AがNであり；

R³及びR⁵がHであり；

JがCR⁴であり、且つGがCR⁵であり；

R⁴がハロゲン又はCNであり；及び

R⁶がC₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから選択され、前記基のそれぞれが、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい、実施形態1～9のいずれか1つによる化合物が提供される。

20

【0066】

実施形態2～42のいずれか1つによる好ましい実施形態では、Zは、Oである。

【0067】

実施形態43として、化合物が、

－ 3－（4－アセトアミドフェニル）－N－（4－クロロフェニル）－N－メチル－イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－6－カルボキサミド、

－ メチルN－[4－[6－[(4－クロロフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ 3－（6－アセトアミド－3－ピリジル）－N－（4－クロロフェニル）－N－メチル－イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－6－カルボキサミド、

－ メチルN－[5－[6－[(4－クロロフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]－2－ピリジル]カルバメート、

30

－ メチルN－[4－[6－[(4－ヒドロキシフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(4－シアノフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(3－メトキシフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(4－メトキシフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[[3－(ジフルオロメトキシ)フェニル]－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

40

－ メチルN－[4－[6－[(3－エチルフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(4－フルオロフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[メチル－(2－メチル－4－ピリジル)カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(3, 4－ジメチルフェニル)－メチル－カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン－3－イル]フェニル]カルバメート、

－ メチルN－[4－[6－[(4－イソプロピルフェニル)－メチル－カルバモイル]

50

イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [5- [6- [(4-シアノフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダ
 ゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [メチル (p-トリル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-
 a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)-メチル-カル
 バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -7-
 メチル-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -8-
 メチル-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -5-
 メチル-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [5-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [8-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [7-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [メチル (4-ピリジル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-
 a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [5- [6- [(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル] イミ
 ダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(2-メトキシ-4-ピリジル)-メチル-カルバモイル
] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-シクロプロピル-カルバモイル
] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)- (シクロプロピルメチル) カル
 バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)- (2, 2, 2-トリフルオロエ
 チル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメ
 ート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-プロピル-カルバモイル] イミ
 ダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)- (シアノメチル) カルバモイル
] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-エチル-カルバモイル] イミダ
 ゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-プロプ-2-イニル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [7-ブロモ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [8-ブロモ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモ
 イル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -8-
 フルオロ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -8-
 メトキシ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
 - メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] -5-
 シアノ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、

10

20

30

40

50

- ー メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-
メトキシ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
- ー メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-8-
シアノ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
- ー メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-
シアノ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
- ー メチル N- [4- [6- [(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-
フルオロ-イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3-エチニルフェニル)-メチル-カルバモイル] イミ
ダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3-シアノフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダ
ゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(4-フルオロ-3-メトキシ-フェニル)-メチル-カル
バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメ
ート、
- ー メチル N- [5- [6- [(4-クロロ-3-メチル-フェニル)-メチル-カルバ
モイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3, 5-ジメチルフェニル)-メチル-カルバモイル]
イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(4-フルオロ-3-メチル-フェニル)-メチル-カル
バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート
、
- ー メチル N- [5- [6- [メチル- [3- (トリフルオロメチル) フェニル] カルバ
モイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3, 4-ジフルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]
イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(4-シアノ-3-メトキシ-フェニル)-メチル-カル
バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート
、
- ー メチル N- [5- [6- [(3-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル] イミ
ダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(4-シアノ-3-メチル-フェニル)-メチル-カルバ
モイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [メチル (m-トリル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-
a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(5-メトキシ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル]
イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [メチル- (5-メチル-3-ピリジル) カルバモイル] イ
ミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [[3- (ジフルオロメチル) フェニル]-メチル-カルバ
モイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3, 5-ジメトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]
イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [(3-メトキシ-5-メチル-フェニル)-メチル-カル
バモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート
、
- ー メチル N- [5- [6- [(6-フルオロ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル]
イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、
- ー メチル N- [5- [6- [メチル (フェニル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a
] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート、

10

20

30

40

50

- ー メチル N- [5- [6- [(3-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [メチル (p-トリル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(3, 4-ジメチルフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [[4- (ジフルオロメトキシ) フェニル]-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート
 - 、
 - ー メチル N- [5- [6- [(6-メトキシ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(4-ブロモフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(3-ブロモフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(2-メトキシ-4-ピリジル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(2-フルオロ-4-ピリジル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(3-シクロプロピルフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(3-ヨードフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [[3- (2, 2-ジフルオロエチル) フェニル]-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー メチル N- [5- [6- [(4-クロロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート
 - 、
 - ー メチル N- [5- [6- [(4-フルオロフェニル)- (2-メトキシエチル) カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート
 - 、
 - ー メチル N- [5- [6- [[4-フルオロ-3- (2-メトキシエトキシ) フェニル]-メチル-カルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート、
 - ー N- (4-フルオロ-3-メチルフェニル)-N-メチル-3- [6- (プロパノイルアミノ)-3-ピリジル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミド、及び
 - ー メチル N- [5- [6- [(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモチオイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] -2-ピリジル] カルバメート
- から選択される、実施形態 1～42 のいずれか 1 つによる化合物が提供される。

【0068】

以下の表 1. 1～1. 36 の化合物は、本発明の化合物を例示する。

【0069】

表 1. 1 は、式 (I)

10

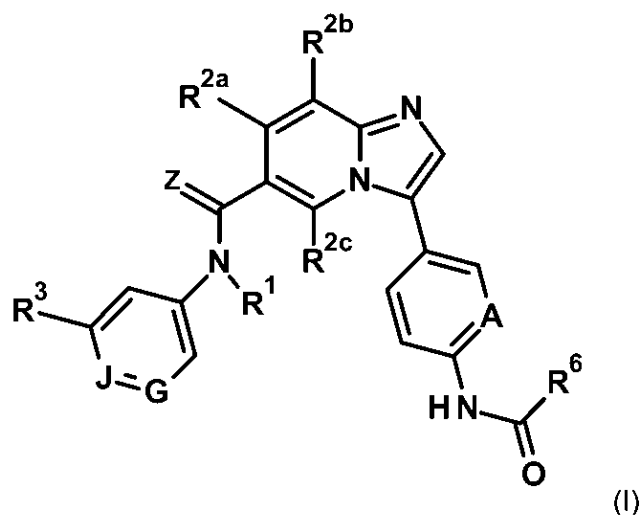
20

30

40

50

【化 4】



10

20

30

40

50

(式中、
 Z は、O であり；
 R^{2a} は、H であり、 R^{2b} は、H であり、 R^{2c} は、H であり、 R^6 は、メチルであり；及び
 R^1 、 R^3 、J、G 及び A の値は、以下の表 Z. 1 で定義されるとおりである)
 の化合物を提供する。

【0070】

(表 1. 1 に続く) 表 1. 2 ~ 表 1. 36 のそれぞれは、式中の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^6 が表 1. 2 ~ 表 1. 36 の中で具体的に定義される式 (I) のそれぞれの化合物を開示しており、これらについては、 R^1 、 R^3 、J、G 及び A が具体的に定義される表 Z. 1 が参照される。

【0071】

【表 1－1】

表 Z.1

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.1	CH ₃	H	CH	CH	CH
E1.2	CH ₃	CH ₃	CH	CH	CH
E1.3	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.4	CH ₃	F	CH	CH	CH
E1.5	CH ₃	Cl	CH	CH	CH
E1.6	CH ₃	Br	CH	CH	CH
E1.7	CH ₃	CN	CH	CH	CH
E1.8	CH ₃	OCH ₃	CH	CH	CH
E1.9	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.10	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	CH
E1.11	CH ₃	OH	CH	CH	CH
E1.12	CH ₃	H	N	CH	CH
E1.13	CH ₃	CH ₃	N	CH	CH
E1.14	CH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.15	CH ₃	F	N	CH	CH
E1.16	CH ₃	Cl	N	CH	CH
E1.17	CH ₃	Br	N	CH	CH
E1.18	CH ₃	CN	N	CH	CH
E1.19	CH ₃	OCH ₃	N	CH	CH
E1.20	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.21	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	CH
E1.22	CH ₃	OH	N	CH	CH
E1.23	CH ₃	H	CH	N	CH
E1.24	CH ₃	CH ₃	CH	N	CH
E1.25	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.26	CH ₃	F	CH	N	CH
E1.27	CH ₃	Cl	CH	N	CH
E1.28	CH ₃	Br	CH	N	CH
E1.29	CH ₃	CN	CH	N	CH

【表 1 - 2】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.30	CH ₃	OCH ₃	CH	N	CH
E1.31	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.32	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	CH
E1.33	CH ₃	OH	CH	N	CH
E1.34	CH ₃	H	C-F	CH	CH
E1.35	CH ₃	CH ₃	C-F	CH	CH
E1.36	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.37	CH ₃	F	C-F	CH	CH
E1.38	CH ₃	Cl	C-F	CH	CH
E1.39	CH ₃	Br	C-F	CH	CH
E1.40	CH ₃	CN	C-F	CH	CH
E1.41	CH ₃	OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.42	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.43	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.44	CH ₃	OH	C-F	CH	CH
E1.45	CH ₃	H	C-Cl	CH	CH
E1.46	CH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.47	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.48	CH ₃	F	C-Cl	CH	CH
E1.49	CH ₃	Cl	C-Cl	CH	CH
E1.50	CH ₃	Br	C-Cl	CH	CH
E1.51	CH ₃	CN	C-Cl	CH	CH
E1.52	CH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.53	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.54	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.55	CH ₃	OH	C-Cl	CH	CH
E1.56	CH ₃	H	C-CH ₃	CH	CH
E1.57	CH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.58	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.59	CH ₃	F	C-CH ₃	CH	CH
E1.60	CH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	CH
E1.61	CH ₃	Br	C-CH ₃	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

化合物	R ¹	R ²	J	G	A
E1.62	CH ₃	CN	C-CH ₃	CH	CH
E1.63	CH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.64	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.65	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.66	CH ₃	OH	C-CH ₃	CH	CH
E1.67	CH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.68	CH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.69	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.70	CH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.71	CH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.72	CH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.73	CH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.74	CH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.75	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.76	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.77	CH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.78	CH ₃	H	C-CN	CH	CH
E1.79	CH ₃	CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.80	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.81	CH ₃	F	C-CN	CH	CH
E1.82	CH ₃	Cl	C-CN	CH	CH
E1.83	CH ₃	Br	C-CN	CH	CH
E1.84	CH ₃	CN	C-CN	CH	CH
E1.85	CH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.86	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.87	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.88	CH ₃	OH	C-CN	CH	CH
E1.89	CH ₃	H	CH	CH	N
E1.90	CH ₃	CH ₃	CH	CH	N
E1.91	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.92	CH ₃	F	CH	CH	N
E1.93	CH ₃	Cl	CH	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 4】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.94	CH ₃	Br	CH	CH	N
E1.95	CH ₃	CN	CH	CH	N
E1.96	CH ₃	OCH ₃	CH	CH	N
E1.97	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.98	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	N
E1.99	CH ₃	OH	CH	CH	N
E1.100	CH ₃	H	N	CH	N
E1.101	CH ₃	CH ₃	N	CH	N
E1.102	CH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.103	CH ₃	F	N	CH	N
E1.104	CH ₃	Cl	N	CH	N
E1.105	CH ₃	Br	N	CH	N
E1.106	CH ₃	CN	N	CH	N
E1.107	CH ₃	OCH ₃	N	CH	N
E1.108	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.109	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	N
E1.110	CH ₃	OH	N	CH	N
E1.111	CH ₃	H	CH	N	N
E1.112	CH ₃	CH ₃	CH	N	N
E1.113	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.114	CH ₃	F	CH	N	N
E1.115	CH ₃	Cl	CH	N	N
E1.116	CH ₃	Br	CH	N	N
E1.117	CH ₃	CN	CH	N	N
E1.118	CH ₃	OCH ₃	CH	N	N
E1.119	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.120	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	N
E1.121	CH ₃	OH	CH	N	N
E1.122	CH ₃	H	C-F	CH	N
E1.123	CH ₃	CH ₃	C-F	CH	N
E1.124	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.125	CH ₃	F	C-F	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 5】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.126	CH ₃	Cl	C-F	CH	N
E1.127	CH ₃	Br	C-F	CH	N
E1.128	CH ₃	CN	C-F	CH	N
E1.129	CH ₃	OCH ₃	C-F	CH	N
E1.130	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.131	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	N
E1.132	CH ₃	OH	C-F	CH	N
E1.133	CH ₃	H	C-Cl	CH	N
E1.134	CH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.135	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.136	CH ₃	F	C-Cl	CH	N
E1.137	CH ₃	Cl	C-Cl	CH	N
E1.138	CH ₃	Br	C-Cl	CH	N
E1.139	CH ₃	CN	C-Cl	CH	N
E1.140	CH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.141	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.142	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.143	CH ₃	OH	C-Cl	CH	N
E1.144	CH ₃	H	C-CH ₃	CH	N
E1.145	CH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.146	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.147	CH ₃	F	C-CH ₃	CH	N
E1.148	CH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	N
E1.149	CH ₃	Br	C-CH ₃	CH	N
E1.150	CH ₃	CN	C-CH ₃	CH	N
E1.151	CH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.152	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.153	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.154	CH ₃	OH	C-CH ₃	CH	N
E1.155	CH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.156	CH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.157	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 6】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.158	CH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.159	CH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.160	CH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.161	CH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.162	CH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.163	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.164	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.165	CH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.166	CH ₃	H	C-CN	CH	N
E1.167	CH ₃	CH ₃	C-CN	CH	N
E1.168	CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.169	CH ₃	F	C-CN	CH	N
E1.170	CH ₃	Cl	C-CN	CH	N
E1.171	CH ₃	Br	C-CN	CH	N
E1.172	CH ₃	CN	C-CN	CH	N
E1.173	CH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.174	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.175	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.176	CH ₃	OH	C-CN	CH	N
E1.177	CH ₂ CH ₃	H	CH	CH	CH
E1.178	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH	CH	CH
E1.179	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.180	CH ₂ CH ₃	F	CH	CH	CH
E1.181	CH ₂ CH ₃	Cl	CH	CH	CH
E1.182	CH ₂ CH ₃	Br	CH	CH	CH
E1.183	CH ₂ CH ₃	CN	CH	CH	CH
E1.184	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH	CH	CH
E1.185	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.186	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	CH
E1.187	CH ₂ CH ₃	OH	CH	CH	CH
E1.188	CH ₂ CH ₃	H	N	CH	CH
E1.189	CH ₂ CH ₃	CH ₃	N	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 7】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.190	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.191	CH ₂ CH ₃	F	N	CH	CH
E1.192	CH ₂ CH ₃	Cl	N	CH	CH
E1.193	CH ₂ CH ₃	Br	N	CH	CH
E1.194	CH ₂ CH ₃	CN	N	CH	CH
E1.195	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	N	CH	CH
E1.196	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.197	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	CH
E1.198	CH ₂ CH ₃	OH	N	CH	CH
E1.199	CH ₂ CH ₃	H	CH	N	CH
E1.200	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH	N	CH
E1.201	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.202	CH ₂ CH ₃	F	CH	N	CH
E1.203	CH ₂ CH ₃	Cl	CH	N	CH
E1.204	CH ₂ CH ₃	Br	CH	N	CH
E1.205	CH ₂ CH ₃	CN	CH	N	CH
E1.206	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH	N	CH
E1.207	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.208	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	CH
E1.209	CH ₂ CH ₃	OH	CH	N	CH
E1.210	CH ₂ CH ₃	H	C-F	CH	CH
E1.211	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-F	CH	CH
E1.212	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.213	CH ₂ CH ₃	F	C-F	CH	CH
E1.214	CH ₂ CH ₃	Cl	C-F	CH	CH
E1.215	CH ₂ CH ₃	Br	C-F	CH	CH
E1.216	CH ₂ CH ₃	CN	C-F	CH	CH
E1.217	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.218	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.219	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.220	CH ₂ CH ₃	OH	C-F	CH	CH
E1.221	CH ₂ CH ₃	H	C-Cl	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 8】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.222	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.223	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.224	CH ₂ CH ₃	F	C-Cl	CH	CH
E1.225	CH ₂ CH ₃	Cl	C-Cl	CH	CH
E1.226	CH ₂ CH ₃	Br	C-Cl	CH	CH
E1.227	CH ₂ CH ₃	CN	C-Cl	CH	CH
E1.228	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.229	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.230	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.231	CH ₂ CH ₃	OH	C-Cl	CH	CH
E1.232	CH ₂ CH ₃	H	C-CH ₃	CH	CH
E1.233	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.234	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.235	CH ₂ CH ₃	F	C-CH ₃	CH	CH
E1.236	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	CH
E1.237	CH ₂ CH ₃	Br	C-CH ₃	CH	CH
E1.238	CH ₂ CH ₃	CN	C-CH ₃	CH	CH
E1.239	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.240	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.241	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.242	CH ₂ CH ₃	OH	C-CH ₃	CH	CH
E1.243	CH ₂ CH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.244	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.245	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.246	CH ₂ CH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.247	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.248	CH ₂ CH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.249	CH ₂ CH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.250	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.251	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.252	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.253	CH ₂ CH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 9】

化合物	R ¹	R ²	J	G	A
E1.254	CH ₂ CH ₃	H	C-CN	CH	CH
E1.255	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.256	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.257	CH ₂ CH ₃	F	C-CN	CH	CH
E1.258	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CN	CH	CH
E1.259	CH ₂ CH ₃	Br	C-CN	CH	CH
E1.260	CH ₂ CH ₃	CN	C-CN	CH	CH
E1.261	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.262	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.263	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.264	CH ₂ CH ₃	OH	C-CN	CH	CH
E1.265	CH ₂ CH ₃	H	CH	CH	N
E1.266	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH	CH	N
E1.267	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.268	CH ₂ CH ₃	F	CH	CH	N
E1.269	CH ₂ CH ₃	Cl	CH	CH	N
E1.270	CH ₂ CH ₃	Br	CH	CH	N
E1.271	CH ₂ CH ₃	CN	CH	CH	N
E1.272	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH	CH	N
E1.273	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.274	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	N
E1.275	CH ₂ CH ₃	OH	CH	CH	N
E1.276	CH ₂ CH ₃	H	N	CH	N
E1.277	CH ₂ CH ₃	CH ₃	N	CH	N
E1.278	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.279	CH ₂ CH ₃	F	N	CH	N
E1.280	CH ₂ CH ₃	Cl	N	CH	N
E1.281	CH ₂ CH ₃	Br	N	CH	N
E1.282	CH ₂ CH ₃	CN	N	CH	N
E1.283	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	N	CH	N
E1.284	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.285	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 0】

化合物	R ¹	R ²	J	G	A
E1.286	CH ₂ CH ₃	OH	N	CH	N
E1.287	CH ₂ CH ₃	H	CH	N	N
E1.288	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH	N	N
E1.289	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.290	CH ₂ CH ₃	F	CH	N	N
E1.291	CH ₂ CH ₃	Cl	CH	N	N
E1.292	CH ₂ CH ₃	Br	CH	N	N
E1.293	CH ₂ CH ₃	CN	CH	N	N
E1.294	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	CH	N	N
E1.295	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.296	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	N
E1.297	CH ₂ CH ₃	OH	CH	N	N
E1.298	CH ₂ CH ₃	H	C-F	CH	N
E1.299	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-F	CH	N
E1.300	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.301	CH ₂ CH ₃	F	C-F	CH	N
E1.302	CH ₂ CH ₃	Cl	C-F	CH	N
E1.303	CH ₂ CH ₃	Br	C-F	CH	N
E1.304	CH ₂ CH ₃	CN	C-F	CH	N
E1.305	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-F	CH	N
E1.306	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.307	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	N
E1.308	CH ₂ CH ₃	OH	C-F	CH	N
E1.309	CH ₂ CH ₃	H	C-Cl	CH	N
E1.310	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.311	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.312	CH ₂ CH ₃	F	C-Cl	CH	N
E1.313	CH ₂ CH ₃	Cl	C-Cl	CH	N
E1.314	CH ₂ CH ₃	Br	C-Cl	CH	N
E1.315	CH ₂ CH ₃	CN	C-Cl	CH	N
E1.316	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.317	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 1】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.318	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.319	CH ₂ CH ₃	OH	C-Cl	CH	N
E1.320	CH ₂ CH ₃	H	C-CH ₃	CH	N
E1.321	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.322	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.323	CH ₂ CH ₃	F	C-CH ₃	CH	N
E1.324	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	N
E1.325	CH ₂ CH ₃	Br	C-CH ₃	CH	N
E1.326	CH ₂ CH ₃	CN	C-CH ₃	CH	N
E1.327	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.328	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.329	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.330	CH ₂ CH ₃	OH	C-CH ₃	CH	N
E1.331	CH ₂ CH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.332	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.333	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.334	CH ₂ CH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.335	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.336	CH ₂ CH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.337	CH ₂ CH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.338	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.339	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.340	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.341	CH ₂ CH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.342	CH ₂ CH ₃	H	C-CN	CH	N
E1.343	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C-CN	CH	N
E1.344	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.345	CH ₂ CH ₃	F	C-CN	CH	N
E1.346	CH ₂ CH ₃	Cl	C-CN	CH	N
E1.347	CH ₂ CH ₃	Br	C-CN	CH	N
E1.348	CH ₂ CH ₃	CN	C-CN	CH	N
E1.349	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 2】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.350	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.351	CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.352	CH ₂ CH ₃	OH	C-CN	CH	N
E1.353	CH ₂ OCH ₃	H	CH	CH	CH
E1.354	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	CH	CH
E1.355	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.356	CH ₂ OCH ₃	F	CH	CH	CH
E1.357	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	CH	CH
E1.358	CH ₂ OCH ₃	Br	CH	CH	CH
E1.359	CH ₂ OCH ₃	CN	CH	CH	CH
E1.360	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	CH	CH
E1.361	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.362	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	CH
E1.363	CH ₂ OCH ₃	OH	CH	CH	CH
E1.364	CH ₂ OCH ₃	H	N	CH	CH
E1.365	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N	CH	CH
E1.366	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.367	CH ₂ OCH ₃	F	N	CH	CH
E1.368	CH ₂ OCH ₃	Cl	N	CH	CH
E1.369	CH ₂ OCH ₃	Br	N	CH	CH
E1.370	CH ₂ OCH ₃	CN	N	CH	CH
E1.371	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	N	CH	CH
E1.372	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.373	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	CH
E1.374	CH ₂ OCH ₃	OH	N	CH	CH
E1.375	CH ₂ OCH ₃	H	CH	N	CH
E1.376	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	N	CH
E1.377	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.378	CH ₂ OCH ₃	F	CH	N	CH
E1.379	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	N	CH
E1.380	CH ₂ OCH ₃	Br	CH	N	CH
E1.381	CH ₂ OCH ₃	CN	CH	N	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 3】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.382	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	N	CH
E1.383	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.384	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	CH
E1.385	CH ₂ OCH ₃	OH	CH	N	CH
E1.386	CH ₂ OCH ₃	H	C-F	CH	CH
E1.387	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-F	CH	CH
E1.388	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.389	CH ₂ OCH ₃	F	C-F	CH	CH
E1.390	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-F	CH	CH
E1.391	CH ₂ OCH ₃	Br	C-F	CH	CH
E1.392	CH ₂ OCH ₃	CN	C-F	CH	CH
E1.393	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.394	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.395	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.396	CH ₂ OCH ₃	OH	C-F	CH	CH
E1.397	CH ₂ OCH ₃	H	C-F	CH	CH
E1.398	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.399	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.400	CH ₂ OCH ₃	F	C-Cl	CH	CH
E1.401	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-Cl	CH	CH
E1.402	CH ₂ OCH ₃	Br	C-Cl	CH	CH
E1.403	CH ₂ OCH ₃	CN	C-Cl	CH	CH
E1.404	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.405	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.406	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.407	CH ₂ OCH ₃	OH	C-Cl	CH	CH
E1.408	CH ₂ OCH ₃	H	C-Cl	CH	CH
E1.409	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.410	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.411	CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₃	CH	CH
E1.412	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	CH
E1.413	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₃	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 4】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.414	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₃	CH	CH
E1.415	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.416	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.417	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.418	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₃	CH	CH
E1.419	CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₃	CH	CH
E1.420	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.421	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.422	CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.423	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.424	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.425	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.426	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.427	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.428	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.429	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.430	CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.431	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.432	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.433	CH ₂ OCH ₃	F	C-CN	CH	CH
E1.434	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CN	CH	CH
E1.435	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CN	CH	CH
E1.436	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CN	CH	CH
E1.437	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.438	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.439	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.440	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CN	CH	CH
E1.441	CH ₂ OCH ₃	H	CH	CH	N
E1.442	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	CH	N
E1.443	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.444	CH ₂ OCH ₃	F	CH	CH	N
E1.445	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 5】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.446	CH ₂ OCH ₃	Br	CH	CH	N
E1.447	CH ₂ OCH ₃	CN	CH	CH	N
E1.448	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	CH	N
E1.449	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.450	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	N
E1.451	CH ₂ OCH ₃	OH	CH	CH	N
E1.452	CH ₂ OCH ₃	H	N	CH	N
E1.453	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N	CH	N
E1.454	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.455	CH ₂ OCH ₃	F	N	CH	N
E1.456	CH ₂ OCH ₃	Cl	N	CH	N
E1.457	CH ₂ OCH ₃	Br	N	CH	N
E1.458	CH ₂ OCH ₃	CN	N	CH	N
E1.459	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	N	CH	N
E1.460	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.461	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	N
E1.462	CH ₂ OCH ₃	OH	N	CH	N
E1.463	CH ₂ OCH ₃	H	CH	N	N
E1.464	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	N	N
E1.465	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.466	CH ₂ OCH ₃	F	CH	N	N
E1.467	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	N	N
E1.468	CH ₂ OCH ₃	Br	CH	N	N
E1.469	CH ₂ OCH ₃	CN	CH	N	N
E1.470	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	N	N
E1.471	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.472	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	N
E1.473	CH ₂ OCH ₃	OH	CH	N	N
E1.474	CH ₂ OCH ₃	H	C-F	CH	N
E1.475	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-F	CH	N
E1.476	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.477	CH ₂ OCH ₃	F	C-F	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 6】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.478	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-F	CH	N
E1.479	CH ₂ OCH ₃	Br	C-F	CH	N
E1.480	CH ₂ OCH ₃	CN	C-F	CH	N
E1.481	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-F	CH	N
E1.482	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.483	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	N
E1.484	CH ₂ OCH ₃	OH	C-F	CH	N
E1.485	CH ₂ OCH ₃	H	C-Cl	CH	N
E1.486	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.487	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.488	CH ₂ OCH ₃	F	C-Cl	CH	N
E1.489	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-Cl	CH	N
E1.490	CH ₂ OCH ₃	Br	C-Cl	CH	N
E1.491	CH ₂ OCH ₃	CN	C-Cl	CH	N
E1.492	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.493	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.494	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.495	CH ₂ OCH ₃	OH	C-Cl	CH	N
E1.496	CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₃	CH	N
E1.497	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.498	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.499	CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₃	CH	N
E1.500	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	N
E1.501	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₃	CH	N
E1.502	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₃	CH	N
E1.503	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.504	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.505	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.506	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₃	CH	N
E1.507	CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.508	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.509	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 7】

化合物	R ¹	R ²	J	G	A
E1.510	CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.511	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.512	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.513	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.514	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.515	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.516	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.517	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.518	CH ₂ OCH ₃	H	C-CN	CH	N
E1.519	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CN	CH	N
E1.520	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.521	CH ₂ OCH ₃	F	C-CN	CH	N
E1.522	CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CN	CH	N
E1.523	CH ₂ OCH ₃	Br	C-CN	CH	N
E1.524	CH ₂ OCH ₃	CN	C-CN	CH	N
E1.525	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.526	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.527	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.528	CH ₂ OCH ₃	OH	C-CN	CH	N
E1.529	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH	CH	CH
E1.530	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	CH	CH
E1.531	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.532	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH	CH	CH
E1.533	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	CH	CH
E1.534	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	CH	CH	CH
E1.535	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	CH	CH	CH
E1.536	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	CH	CH
E1.537	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.538	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	CH
E1.539	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	CH	CH	CH
E1.540	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	N	CH	CH
E1.541	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 8】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.542	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.543	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	N	CH	CH
E1.544	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	N	CH	CH
E1.545	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	N	CH	CH
E1.546	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	N	CH	CH
E1.547	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	N	CH	CH
E1.548	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.549	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	CH
E1.550	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	N	CH	CH
E1.551	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH	N	CH
E1.552	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	N	CH
E1.553	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.554	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH	N	CH
E1.555	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	N	CH
E1.556	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	CH	N	CH
E1.557	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	CH	N	CH
E1.558	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	N	CH
E1.559	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.560	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	CH
E1.561	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	CH	N	CH
E1.562	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-F	CH	CH
E1.563	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-F	CH	CH
E1.564	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.565	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-F	CH	CH
E1.566	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-F	CH	CH
E1.567	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-F	CH	CH
E1.568	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-F	CH	CH
E1.569	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.570	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.571	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.572	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-F	CH	CH
E1.573	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-Cl	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 9】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.574	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.575	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.576	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-Cl	CH	CH
E1.577	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-Cl	CH	CH
E1.578	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-Cl	CH	CH
E1.579	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-Cl	CH	CH
E1.580	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.581	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.582	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.583	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-Cl	CH	CH
E1.584	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₃	CH	CH
E1.585	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.586	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.587	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₃	CH	CH
E1.588	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	CH
E1.589	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₃	CH	CH
E1.590	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₃	CH	CH
E1.591	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.592	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.593	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.594	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₃	CH	CH
E1.595	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.596	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.597	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.598	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.599	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.600	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.601	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.602	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.603	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.604	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.605	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH

【表 1 - 2 0】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.606	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CN	CH	CH
E1.607	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.608	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.609	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CN	CH	CH
E1.610	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CN	CH	CH
E1.611	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CN	CH	CH
E1.612	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CN	CH	CH
E1.613	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.614	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.615	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.616	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CN	CH	CH
E1.617	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH	CH	N
E1.618	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	CH	N
E1.619	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.620	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH	CH	N
E1.621	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	CH	N
E1.622	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	CH	CH	N
E1.623	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	CH	CH	N
E1.624	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	CH	N
E1.625	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.626	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	N
E1.627	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	CH	CH	N
E1.628	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	N	CH	N
E1.629	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	N	CH	N
E1.630	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.631	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	N	CH	N
E1.632	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	N	CH	N
E1.633	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	N	CH	N
E1.634	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	N	CH	N
E1.635	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	N	CH	N
E1.636	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.637	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 1】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.638	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	N	CH	N
E1.639	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH	N	N
E1.640	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH	N	N
E1.641	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.642	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	CH	N	N
E1.643	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	CH	N	N
E1.644	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	CH	N	N
E1.645	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	CH	N	N
E1.646	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	CH	N	N
E1.647	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.648	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	N
E1.649	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	CH	N	N
E1.650	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-F	CH	N
E1.651	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-F	CH	N
E1.652	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.653	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-F	CH	N
E1.654	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-F	CH	N
E1.655	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-F	CH	N
E1.656	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-F	CH	N
E1.657	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-F	CH	N
E1.658	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.659	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	N
E1.660	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-F	CH	N
E1.661	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-Cl	CH	N
E1.662	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.663	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.664	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-Cl	CH	N
E1.665	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-Cl	CH	N
E1.666	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-Cl	CH	N
E1.667	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-Cl	CH	N
E1.668	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.669	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 2】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.670	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.671	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-Cl	CH	N
E1.672	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₃	CH	N
E1.673	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.674	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.675	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₃	CH	N
E1.676	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₃	CH	N
E1.677	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₃	CH	N
E1.678	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₃	CH	N
E1.679	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.680	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.681	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.682	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₃	CH	N
E1.683	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.684	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.685	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.686	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.687	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.688	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.689	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.690	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.691	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.692	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.693	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.694	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C-CN	CH	N
E1.695	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C-CN	CH	N
E1.696	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.697	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F	C-CN	CH	N
E1.698	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl	C-CN	CH	N
E1.699	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br	C-CN	CH	N
E1.700	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	C-CN	CH	N
E1.701	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	C-CN	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 3】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.702	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.703	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.704	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OH	C-CN	CH	N
E1.705	CH ₂ CN	H	CH	CH	CH
E1.706	CH ₂ CN	CH ₃	CH	CH	CH
E1.707	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.708	CH ₂ CN	F	CH	CH	CH
E1.709	CH ₂ CN	Cl	CH	CH	CH
E1.710	CH ₂ CN	Br	CH	CH	CH
E1.711	CH ₂ CN	CN	CH	CH	CH
E1.712	CH ₂ CN	OCH ₃	CH	CH	CH
E1.713	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
E1.714	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	CH
E1.715	CH ₂ CN	OH	CH	CH	CH
E1.716	CH ₂ CN	H	N	CH	CH
E1.717	CH ₂ CN	CH ₃	N	CH	CH
E1.718	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.719	CH ₂ CN	F	N	CH	CH
E1.720	CH ₂ CN	Cl	N	CH	CH
E1.721	CH ₂ CN	Br	N	CH	CH
E1.722	CH ₂ CN	CN	N	CH	CH
E1.723	CH ₂ CN	OCH ₃	N	CH	CH
E1.724	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	N	CH	CH
E1.725	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	CH
E1.726	CH ₂ CN	OH	N	CH	CH
E1.727	CH ₂ CN	H	CH	N	CH
E1.728	CH ₂ CN	CH ₃	CH	N	CH
E1.729	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.730	CH ₂ CN	F	CH	N	CH
E1.731	CH ₂ CN	Cl	CH	N	CH
E1.732	CH ₂ CN	Br	CH	N	CH
E1.733	CH ₂ CN	CN	CH	N	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 4】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.734	CH ₂ CN	OCH ₃	CH	N	CH
E1.735	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	CH	N	CH
E1.736	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	CH
E1.737	CH ₂ CN	OH	CH	N	CH
E1.738	CH ₂ CN	H	C-F	CH	CH
E1.739	CH ₂ CN	CH ₃	C-F	CH	CH
E1.740	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.741	CH ₂ CN	F	C-F	CH	CH
E1.742	CH ₂ CN	Cl	C-F	CH	CH
E1.743	CH ₂ CN	Br	C-F	CH	CH
E1.744	CH ₂ CN	CN	C-F	CH	CH
E1.745	CH ₂ CN	OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.746	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	CH
E1.747	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	CH
E1.748	CH ₂ CN	OH	C-F	CH	CH
E1.749	CH ₂ CN	H	C-Cl	CH	CH
E1.750	CH ₂ CN	CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.751	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.752	CH ₂ CN	F	C-Cl	CH	CH
E1.753	CH ₂ CN	Cl	C-Cl	CH	CH
E1.754	CH ₂ CN	Br	C-Cl	CH	CH
E1.755	CH ₂ CN	CN	C-Cl	CH	CH
E1.756	CH ₂ CN	OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.757	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.758	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	CH
E1.759	CH ₂ CN	OH	C-Cl	CH	CH
E1.760	CH ₂ CN	H	C-CH ₃	CH	CH
E1.761	CH ₂ CN	CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.762	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.763	CH ₂ CN	F	C-CH ₃	CH	CH
E1.764	CH ₂ CN	Cl	C-CH ₃	CH	CH
E1.765	CH ₂ CN	Br	C-CH ₃	CH	CH

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 5】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.766	CH ₂ CN	CN	C-CH ₃	CH	CH
E1.767	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.768	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.769	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	CH
E1.770	CH ₂ CN	OH	C-CH ₃	CH	CH
E1.771	CH ₂ CN	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.772	CH ₂ CN	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.773	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.774	CH ₂ CN	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.775	CH ₂ CN	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.776	CH ₂ CN	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.777	CH ₂ CN	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.778	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.779	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.780	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.781	CH ₂ CN	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	CH
E1.782	CH ₂ CN	H	C-CN	CH	CH
E1.783	CH ₂ CN	CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.784	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.785	CH ₂ CN	F	C-CN	CH	CH
E1.786	CH ₂ CN	Cl	C-CN	CH	CH
E1.787	CH ₂ CN	Br	C-CN	CH	CH
E1.788	CH ₂ CN	CN	C-CN	CH	CH
E1.789	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.790	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	CH
E1.791	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	CH
E1.792	CH ₂ CN	OH	C-CN	CH	CH
E1.793	CH ₂ CN	H	CH	CH	N
E1.794	CH ₂ CN	CH ₃	CH	CH	N
E1.795	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.796	CH ₂ CN	F	CH	CH	N
E1.797	CH ₂ CN	Cl	CH	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 6】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.798	CH ₂ CN	Br	CH	CH	N
E1.799	CH ₂ CN	CN	CH	CH	N
E1.800	CH ₂ CN	OCH ₃	CH	CH	N
E1.801	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	CH	CH	N
E1.802	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	CH	N
E1.803	CH ₂ CN	OH	CH	CH	N
E1.804	CH ₂ CN	H	N	CH	N
E1.805	CH ₂ CN	CH ₃	N	CH	N
E1.806	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.807	CH ₂ CN	F	N	CH	N
E1.808	CH ₂ CN	Cl	N	CH	N
E1.809	CH ₂ CN	Br	N	CH	N
E1.810	CH ₂ CN	CN	N	CH	N
E1.811	CH ₂ CN	OCH ₃	N	CH	N
E1.812	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	N	CH	N
E1.813	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	N	CH	N
E1.814	CH ₂ CN	OH	N	CH	N
E1.815	CH ₂ CN	H	CH	N	N
E1.816	CH ₂ CN	CH ₃	CH	N	N
E1.817	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.818	CH ₂ CN	F	CH	N	N
E1.819	CH ₂ CN	Cl	CH	N	N
E1.820	CH ₂ CN	Br	CH	N	N
E1.821	CH ₂ CN	CN	CH	N	N
E1.822	CH ₂ CN	OCH ₃	CH	N	N
E1.823	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	CH	N	N
E1.824	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH	N	N
E1.825	CH ₂ CN	OH	CH	N	N
E1.826	CH ₂ CN	H	C-F	CH	N
E1.827	CH ₂ CN	CH ₃	C-F	CH	N
E1.828	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.829	CH ₂ CN	F	C-F	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 7】

化合物	R ¹	R ²	J	G	A
E1.830	CH ₂ CN	Cl	C-F	CH	N
E1.831	CH ₂ CN	Br	C-F	CH	N
E1.832	CH ₂ CN	CN	C-F	CH	N
E1.833	CH ₂ CN	OCH ₃	C-F	CH	N
E1.834	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-F	CH	N
E1.835	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-F	CH	N
E1.836	CH ₂ CN	OH	C-F	CH	N
E1.837	CH ₂ CN	H	C-Cl	CH	N
E1.838	CH ₂ CN	CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.839	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.840	CH ₂ CN	F	C-Cl	CH	N
E1.841	CH ₂ CN	Cl	C-Cl	CH	N
E1.842	CH ₂ CN	Br	C-Cl	CH	N
E1.843	CH ₂ CN	CN	C-Cl	CH	N
E1.844	CH ₂ CN	OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.845	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-Cl	CH	N
E1.846	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-Cl	CH	N
E1.847	CH ₂ CN	OH	C-Cl	CH	N
E1.848	CH ₂ CN	H	C-CH ₃	CH	N
E1.849	CH ₂ CN	CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.850	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.851	CH ₂ CN	F	C-CH ₃	CH	N
E1.852	CH ₂ CN	Cl	C-CH ₃	CH	N
E1.853	CH ₂ CN	Br	C-CH ₃	CH	N
E1.854	CH ₂ CN	CN	C-CH ₃	CH	N
E1.855	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.856	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.857	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₃	CH	N
E1.858	CH ₂ CN	OH	C-CH ₃	CH	N
E1.859	CH ₂ CN	H	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.860	CH ₂ CN	CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.861	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 8】

化合物	R ¹	R ³	J	G	A
E1.862	CH ₂ CN	F	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.863	CH ₂ CN	Cl	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.864	CH ₂ CN	Br	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.865	CH ₂ CN	CN	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.866	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.867	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.868	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.869	CH ₂ CN	OH	C-CH ₂ CH ₃	CH	N
E1.870	CH ₂ CN	H	C-CN	CH	N
E1.871	CH ₂ CN	CH ₃	C-CN	CH	N
E1.872	CH ₂ CN	CH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.873	CH ₂ CN	F	C-CN	CH	N
E1.874	CH ₂ CN	Cl	C-CN	CH	N
E1.875	CH ₂ CN	Br	C-CN	CH	N
E1.876	CH ₂ CN	CN	C-CN	CH	N
E1.877	CH ₂ CN	OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.878	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₃	C-CN	CH	N
E1.879	CH ₂ CN	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	C-CN	CH	N
E1.880	CH ₂ CN	OH	C-CN	CH	N

10

20

30

【0072】

表 1. 2 : この表は、R^{2a}がHであり、R^{2b}がHであり、R^{2c}がHであり、R⁶がメトキシであり、R¹、R³、J、G及びAの値が表 Z. 1 で定義されているとおりである、式 (I) の特定の化合物を開示する。

【0073】

表 1. 3 : この表は、R^{2a}がメチルであり、R^{2b}がHであり、R^{2c}がHであり、R⁶がメチルであり、R¹、R³、J、G及びAの値が表 Z. 1 で定義されているとおりである、式 (I) の特定の化合物を開示する。

40

【0074】

表 1. 4 : この表は、R^{2a}がメチルであり、R^{2b}がHであり、R^{2c}がHであり、R⁶がメトキシであり、R¹、R³、J、G及びAの値が表 Z. 1 で定義されているとおりである、式 (I) の特定の化合物を開示する。

【0075】

表 1. 5 : この表は、R^{2a}がフルオロであり、R^{2b}がHであり、R^{2c}がHであり、R⁶がメチルであり、R¹、R³、J、G及びAの値が表 Z. 1 で定義されているとおりである、式 (I) の特定の化合物を開示する。

50

【0076】

表1. 6: この表は、 R^{2a} がフルオロであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0077】

表1. 7: この表は、 R^{2a} がクロロであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0078】

表1. 8: この表は、 R^{2a} がクロロであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

10

【0079】

表1. 9: この表は、 R^{2a} がブロモであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0080】

表1. 10: この表は、 R^{2a} がブロモであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

20

【0081】

表1. 11: この表は、 R^{2a} がシアノであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0082】

表1. 12: この表は、 R^{2a} がシアノであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0083】

表1. 13: この表は、 R^{2a} がメトキシであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

30

【0084】

表1. 14: この表は、 R^{2a} がメトキシであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0085】

表1. 15: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がメチルであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

40

【0086】

表1. 16: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がメチルであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0087】

表1. 17: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がメトキシであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0088】

表1. 18: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がメトキシであり、 R^{2c} がHであり、

50

R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0089】

表1. 19: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がフルオロであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0090】

表1. 20: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がフルオロであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

10

【0091】

表1. 21: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がクロロであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0092】

表1. 22: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がクロロであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0093】

表1. 23: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がブロモであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

20

【0094】

表1. 24: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がブロモであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0095】

表1. 25: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がシアノであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

30

【0096】

表1. 26: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がシアノであり、 R^{2c} がHであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0097】

表1. 27: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がメチルであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0098】

表1. 28: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がメチルであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

40

【0099】

表1. 29: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がフルオロであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0100】

表1. 30: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がフルオロであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

50

【0101】

表1.31: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がクロロであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0102】

表1.32: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がクロロであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0103】

表1.33: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がブロモであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

10

【0104】

表1.34: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がブロモであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0105】

表1.35: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がシアノであり、 R^6 がメチルであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

20

【0106】

表1.36: この表は、 R^{2a} がHであり、 R^{2b} がHであり、 R^{2c} がシアノであり、 R^6 がメトキシであり、 R^1 、 R^3 、J、G及びAの値が表Z. 1で定義されているとおりである、式(I)の特定の化合物を開示する。

【0107】

本発明に係る化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性又は農芸化学的有効成分としての使用に係る優れた特性（例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル、向上した物理化学的特性又は高い生分解性）を含む、多数の有益性を有し得る。本発明に係る化合物は、フィトフソラ（*Phytophthora*）、プラズモパラ（*Plasmopara*）及びピシウム（*Pythium*）などの卵菌に対する植物の保護に関して特に有利なレベルの生物学的活性を有する。

30

【0108】

本発明の化合物は、以下のスキームに示されているとおりに製造され得、それらの中では、別段の定めがある場合を除き、各可変部位の定義は、実施形態1で定義されている式(I)の化合物について上で定義されているとおりである。

【0109】

ZがOである式(I)の化合物は、以下のスキーム1～14に示されるとおりに製造することができ、それらの中では、別段の定めがある場合を除き、各可変部位の定義は、本発明で定義されているとおりである。

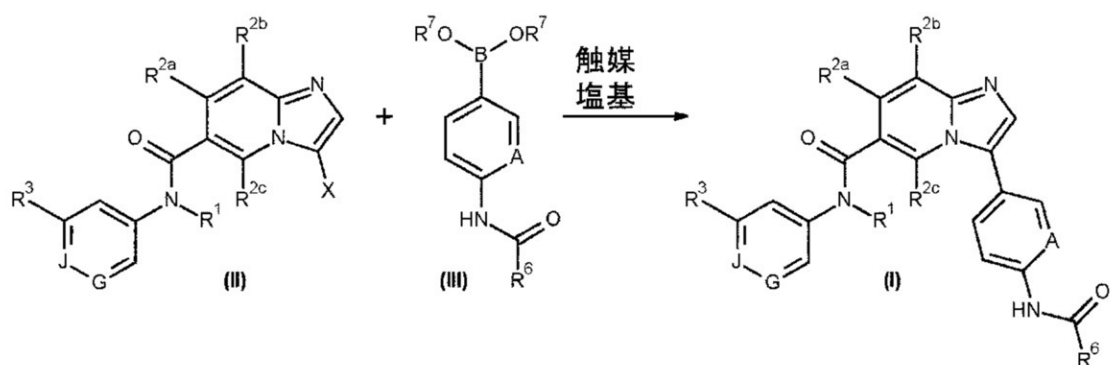
40

【0110】

式(I)の化合物は、 Cs_2CO_3 、 K_2CO_3 又は $NaOtBu$ などの塩基の存在下及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、塩化パラジウム、[1,1-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)、酢酸パラジウム又は塩化ビス(ジフェニルホスフィン)パラジウム(II)などの適切なパラジウム触媒の存在下、ジメチルホルムアミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エタノール又は水などの適切な溶媒中、Xがクロロ(Cl)、ブロモ(Br)又はヨード(I)である式(II)の化合物と、 R^7 が互いに独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、又は2つの R^7 が一緒になって $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを形成し得る式(III)の化合物とを鈴木クロスカップリングさせることによって調製することができる。この変換をスキーム1に示す

50

。【化 5】



10

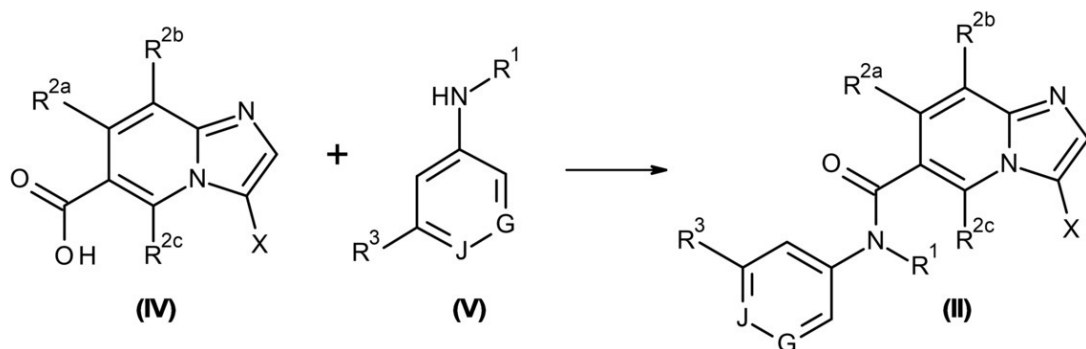
スキーム 1

【0111】

X が C l、B r 又は I である式 (I I) の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、X が C l、B r 又は I である式 (I V) の化合物を式 (V) の化合物及びカップリング剤、例えば N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸クロリド、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又は N-メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム 2 に示す。

20

【化 6】



30

スキーム 2

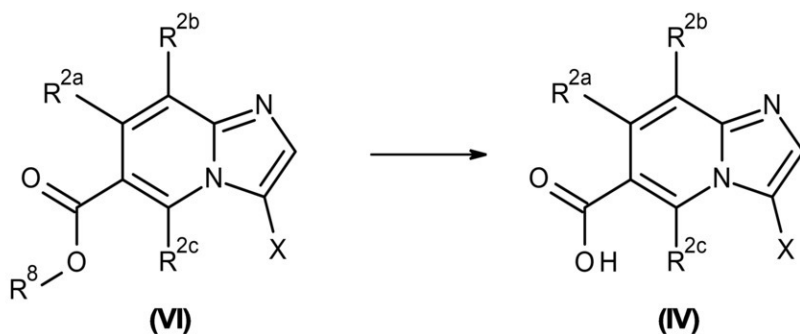
【0112】

X が C l、B r 又は I である式 (I V) の化合物は、市販されているか、又は X が C l、B r 又は I であり、R⁸ が C₁~C₆アルキルである式 (V I) の化合物をメタノール、エタノール又は水などの適切な溶媒中、保持時間 (R T) から還流の温度で N a O H 又は L i O H などの塩基を使用して鹼化することによって調製され得る。この変換をスキーム 3 に示す。

40

50

【化 7】



10

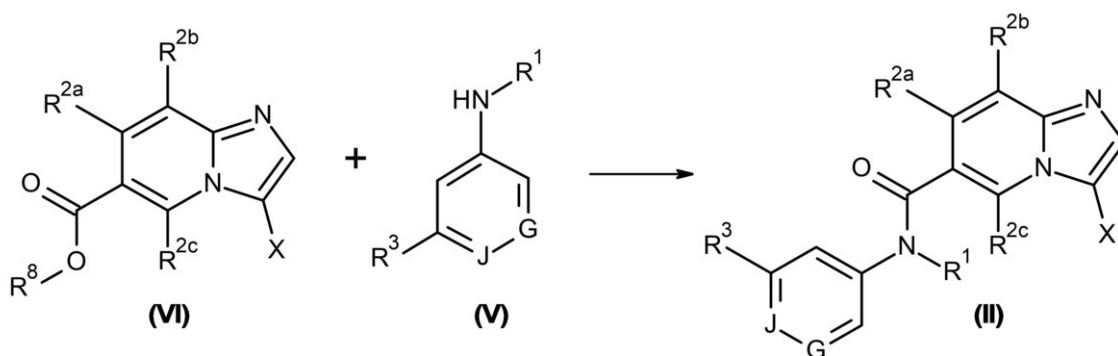
スキーム 3

【0113】

代わりに、XがCl、Br又はIである式(II)の化合物は、テトラヒドロフラン又はトルエンなどの適切な溶媒中、 $(\text{CH}_3)_3\text{Al}$ 又はビス(トリメチルアルミニウム)-1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン付加物の存在下、XがCl、Br又はIであり、 R^8 が $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルである式(VI)の化合物と、式(V)の化合物とを反応させることによって直接調製することができる。これらの変換は、文献に記載されている(例えば、Weinreb, S. M. et al. Tetrahedron Lett. 1977, 48, 4171; Woodward, S. et al. in Tetrahedron Letters 2006, 47, 5767; Woodward S. et al. in Org. Process Res. Dev. 2015, 19, 831を参照されたい)。この変換をスキーム4に示す。

20

【化 8】



30

スキーム 4

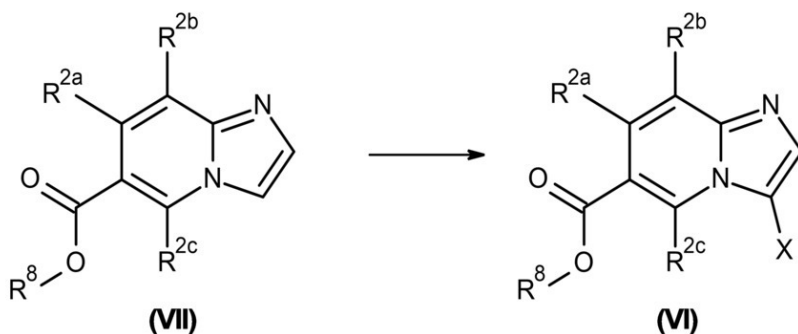
【0114】

XがCl、Br又はIであり、 R^8 が $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルである式(VI)の化合物は、市販されているか、又はジクロロメタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン又はアセトニトリルなどの適切な溶媒中、 R^8 が $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルである式(VII)の化合物と、N-クロロスクシンイミド、N-ブモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド又は臭素などのハロゲン化剤とを反応させることから調製され得る。この変換をスキーム5に示す。

40

50

【化 9】



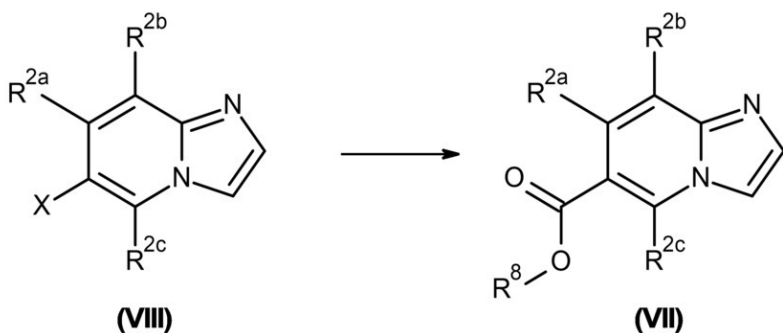
10

スキーム 5

【0115】

R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式(VII)の化合物は、市販されているか、又はPdCl₂dppfなどの触媒の存在下及び任意にトリエチルアミンなどの塩基の存在下、XがCl、Br又はIである式(VIII)の化合物と、一酸化炭素及びアルコール R^8OH (R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである)との反応によって調製され得る。この変換をスキーム6に示す。

【化10】



20

スキーム 6

【0116】

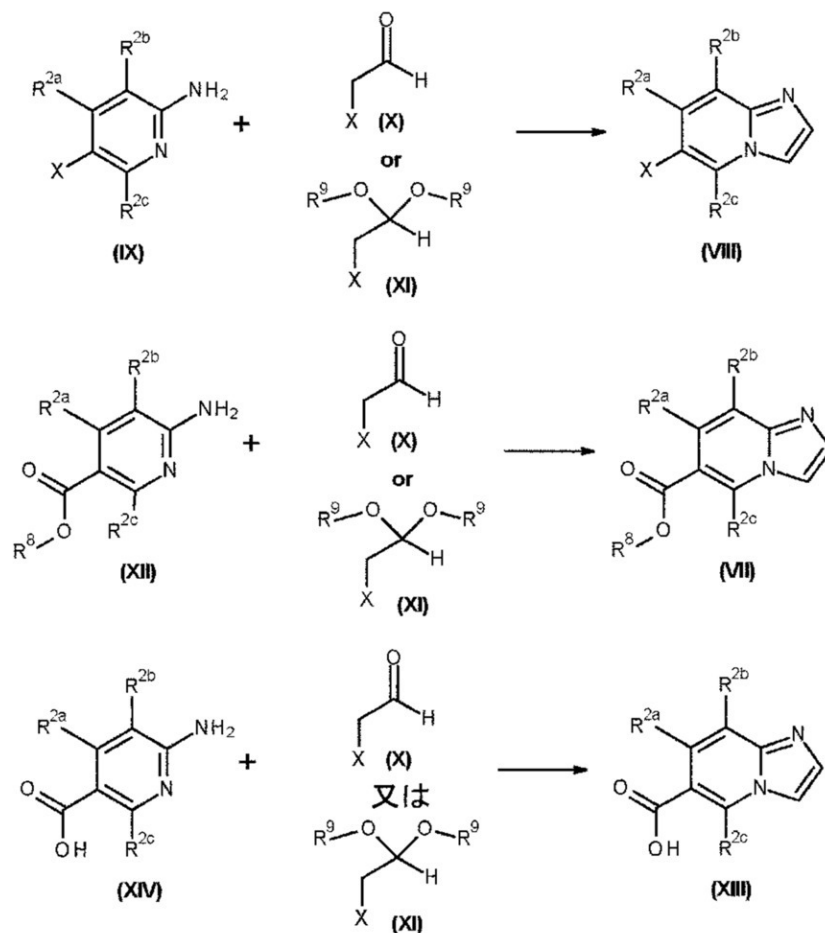
式(VIII)の化合物は、市販されているか、又は水、エタノール、アセトン又はアセトニトリルなどの溶媒中、XがCl、Br若しくはIである式(IX)の化合物と、XがCl、Br若しくはIである式(X)の化合物又はXがCl、Br若しくはIであり、 R^9 が互いに独立して $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、2つの R^9 が一緒になって $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを形成し得る式(XI)のその対応するアセタールとを反応させることによって調製され得る。場合により、炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸カリウムなどの塩基を使用するか、又はp-トルエンスルホン酸若しくは臭化水素などの酸を使用することによって反応の結果を改善することができる。さらに、この変換は、 R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式(XII)の化合物から、 R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式(VII)の化合物を調製し、且つ式(XIV)の化合物から式(XIII)の化合物を調製するために利用することができる。これらの変換をスキーム7に示す。

30

40

50

【化 1 1】



10

20

スキーム 7

【0117】

XがCl、Br又はIである式(IX)の化合物、 R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式(XII)の化合物及び式(XIV)の化合物は、公知の方法によって調製されるか又は市販されている。

30

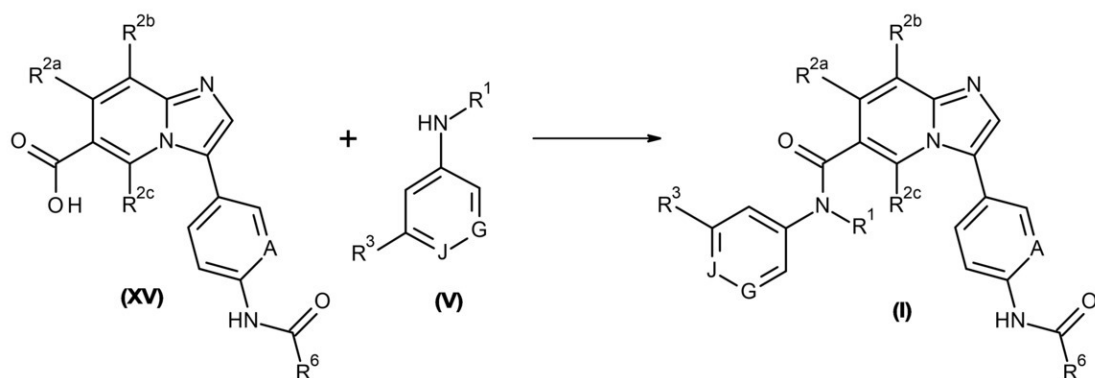
【0118】

代わりに、式(I)の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、式(XV)の化合物を式(V)の化合物及びカップリング剤、例えばN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸クロリド、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又はN-メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム8に示す。

40

50

【化 1 2】



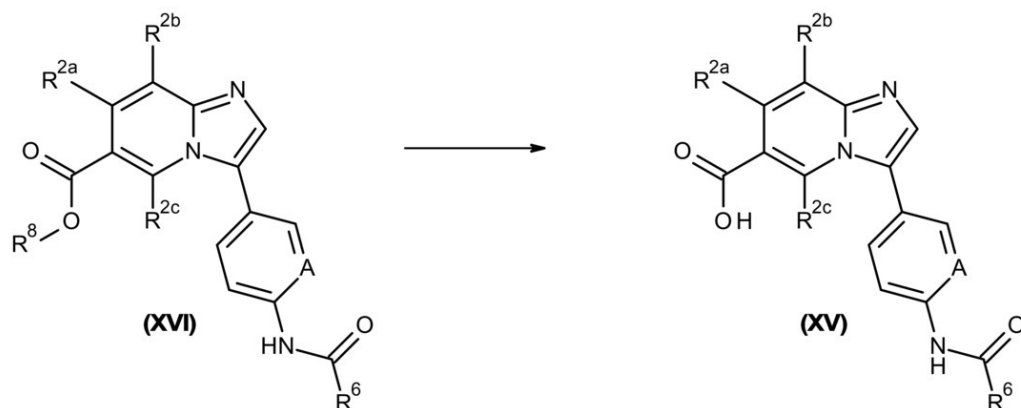
10

スキーム 8

【0119】

式 (XV) の化合物は、 R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式 (XVI) の化合物をメタノール、エタノール又は水などの適切な溶媒中、 $RT \sim$ 還流の温度で $NaOH$ 又は $LiOH$ などの塩基を使用して鹼化することによって調製することができる。この変換をスキーム 9 に示す。

【化 1 3】



20

30

スキーム 9

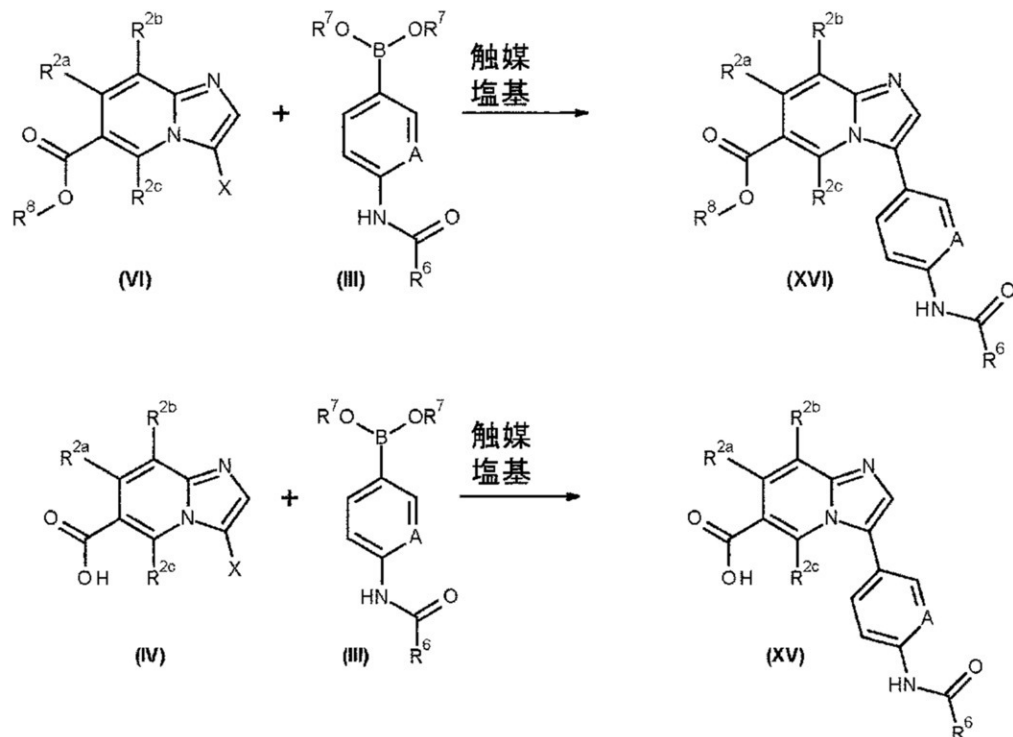
【0120】

R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式 (XVI) の化合物は、 Cs_2CO_3 、 K_2CO_3 又は $NaOtBu$ などの塩基の存在下及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、塩化パラジウム、[1, 1-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II)、酢酸パラジウム又は塩化ビス (ジフェニルホスフィン) パラジウム (II) などの適切なパラジウム触媒の存在下、ジメチルホルムアミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エタノール又は水などの適切な溶媒中、 X が Cl 、 Br 又は I であり、 R^8 が $C_1 \sim C_6$ アルキルである式 (VI) の化合物と、 R^7 が互いに独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、又は 2 つの R^7 が一緒になって $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを形成し得る式 (III) の化合物とを鈴木クロスカップリングさせることによって調製することができる。さらに、この変換は、式 (IV) の化合物から式 (XV) の化合物を調製するために利用することができる。これらの変換をスキーム 10 に示す。

40

50

【化 1 4】



10

20

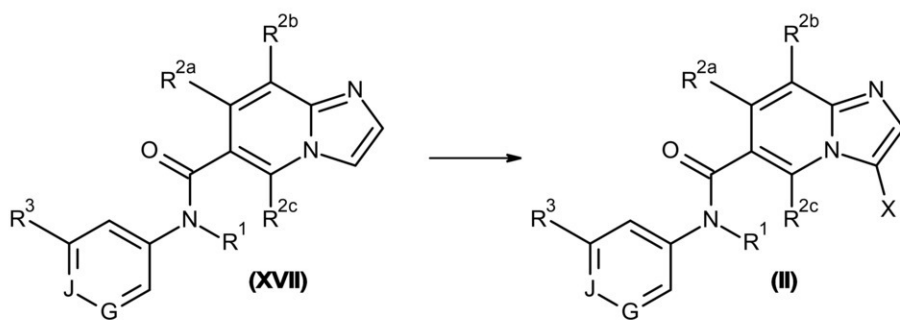
スキーム 1 0

【 0 1 2 1】

代わりに、XがCl、Br又はIである式 (I I) の化合物は、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン又はアセトニトリルなどの適切な溶媒中、式 (X V I I) の化合物と、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド又は臭素などのハロゲン化剤とを反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム 1 1 に示す。

30

【化 1 5】



40

スキーム 1 1

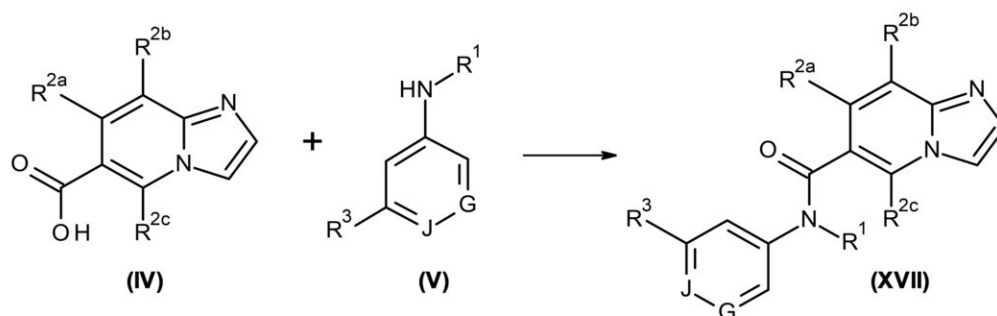
【 0 1 2 2】

式 (X V I I) の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、式 (X I I I) の化合物を式 (V) の化合物及びカップリング剤、例えばN, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸クロリド、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン

50

又はN-メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム12に示す。

【化16】



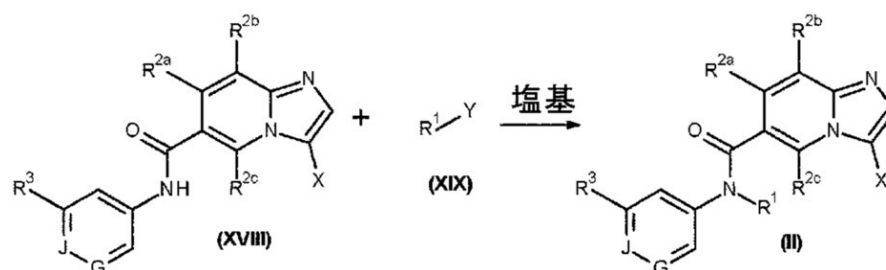
10

スキーム12

【0123】

代わりに、式(II)の化合物は、 Cs_2CO_3 、 K_2CO_3 又は NaOtBu などの塩基の存在下、式(XVII)の化合物を式(XX)の化合物(式中、Yは、Cl、Br、I、 OSO_2CF_3 、 $\text{OSO}_2\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$ 又は OSO_2CH_3 である)と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム13に示す。

【化17】



20

スキーム13

【0124】

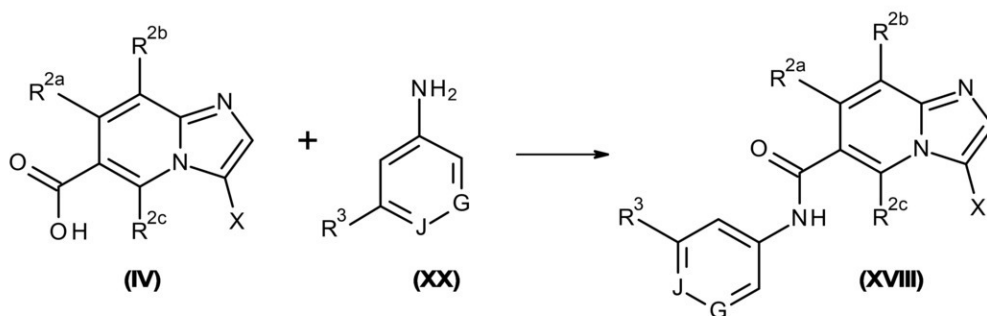
XがCl、Br又はIである式(XVII)の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、XがCl、Br又はIである式(IV)の化合物を式(XX)の化合物及びカップリング剤、例えばN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸クロリド、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又はN-メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム14に示す。

30

40

50

【化 18】



10

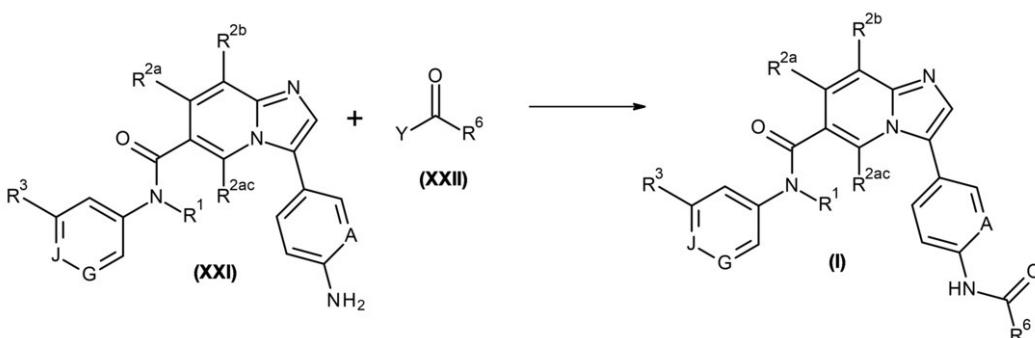
スキーム 14

【0125】

代わりに、式 (I) の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、式 (XXI) の化合物を式 (XXII) の化合物 (式中、Y は OH である) 及びカップリング剤、例えば N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス (2-オキソ-3-オキサゾリジニル) ホスフィン酸クロリド、2- (1H-ベンゾトリアゾール-1-イル) -1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1- (3-ジメチルアミノプロピル) -3-エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又は N-メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換は、酢酸エチル、ピリジン又はテトラヒドロフランなどの適切な溶媒中、式 (XXI) の化合物を式 (XXII) の化合物 (式中、Y は Cl である) 及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又はピリジンなどの塩基と反応させることによって行うこともできる。この変換をスキーム 15 に示す。

20

【化 19】



30

スキーム 15

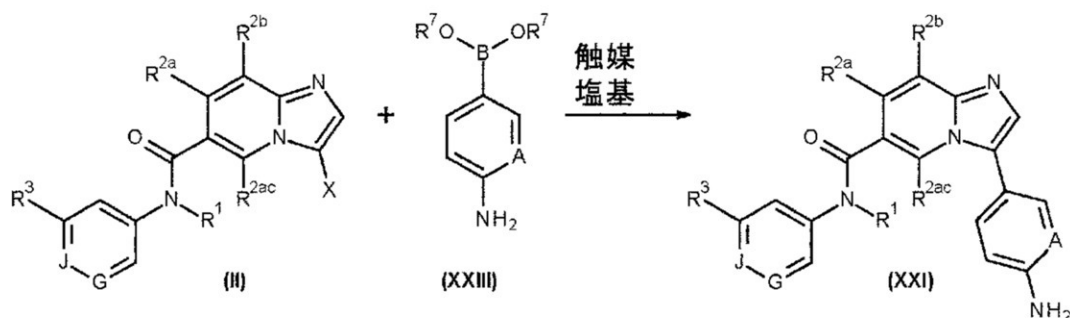
【0126】

式 (XXI) の化合物は、Cs₂CO₃、K₂CO₃又は NaOtBu などの塩基の存在下及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、塩化パラジウム、[1, 1-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (II)、酢酸パラジウム又は塩化ビス (ジフェニルホスフィン) パラジウム (II) などの適切なパラジウム触媒の存在下、ジメチルホルムアミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エタノール又は水などの適切な溶媒中、X が Cl、Br 又は I である式 (II) の化合物と、R⁷ が互いに独立して水素、C₁~C₆アルキルであるか、又は 2 つの R⁷ が一緒になって C₃~C₈シクロアルキルを形成し得る式 (XXIII) の化合物とを鈴木クロスカップリングさせることによって調製することができる。この変換をスキーム 16 に示す。

40

50

【化 2 0】



10

スキーム 1 6

【0 1 2 7】

式 (V) の化合物及び式 (X X) の化合物は、公知の方法によって調製されるか又は市販されている。

【0 1 2 8】

R^7 が互いに独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、又は 2 つの R^7 が一緒になって $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを形成し得る式 (I I I) の化合物は、公知の方法によって調製されるか又は市販されている。

20

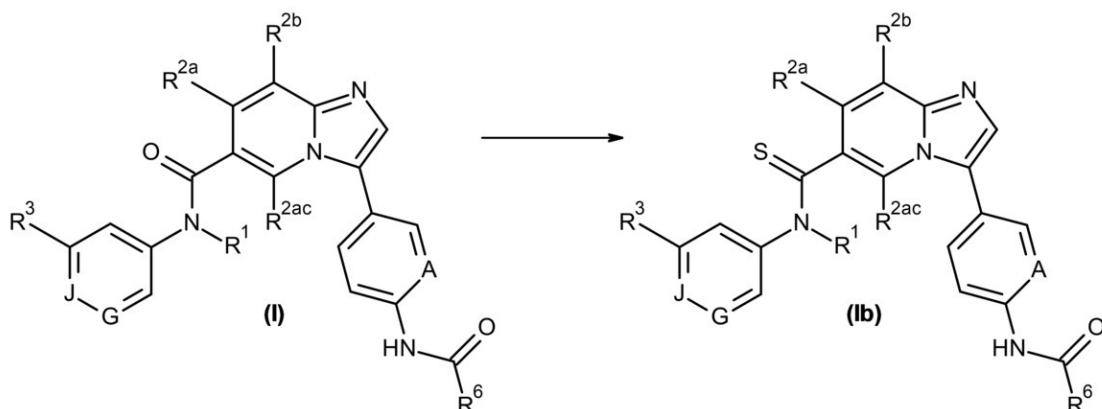
【0 1 2 9】

当業者であれば、酸、アミン及びカップリング剤間の上記のアミドカップリング反応が、対応する酸塩化物及びアミンを使用しても行われ得ることを認識することが理解される。酸からその対応する酸塩化物への変換は、当業者に周知である。

【0 1 3 0】

式 (I b) の化合物は、トルエン、キシレン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、 Z が O である式 (I) の化合物を五硫化リン又はローソン試薬 (C A S : 1 9 1 7 2 - 4 7 - 5) と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム 1 7 に示す。

【化 2 1】



40

スキーム 1 7

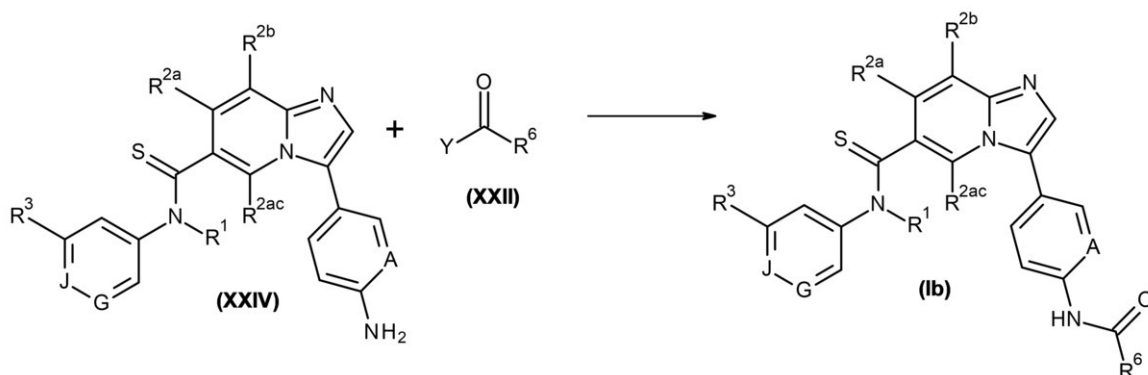
【0 1 3 1】

代わりに、 Z が S である式 (I b) の化合物は、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、式 (X X I V) の化合物を式 (X X I I) の化合物 (式中、 Y は OH である) 及びカップリング剤、例えば N, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、ビス (2-オキソ-3-オキサゾリジニル) ホスフィン酸クロリド、2- (1H-ベンゾトリアゾール-1-イル) -1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、1- (3-ジメチルアミノプロピル)

50

ー３－エチルカルボジイミド塩酸塩、プロピルホスホン酸無水物又は塩化シアヌル及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又はＮ－メチルモルホリンなどの塩基と反応させることによって調製することができる。この変換は、酢酸エチル、ピリジン又はテトラヒドロフランなどの適切な溶媒中、式（XXI）の化合物を式（XXII）の化合物（式中、ＹはＣしである）及び任意にトリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン又はピリジンなどの塩基と反応させることによって行うこともできる。この変換をスキーム１８に示す。

【化２２】



10

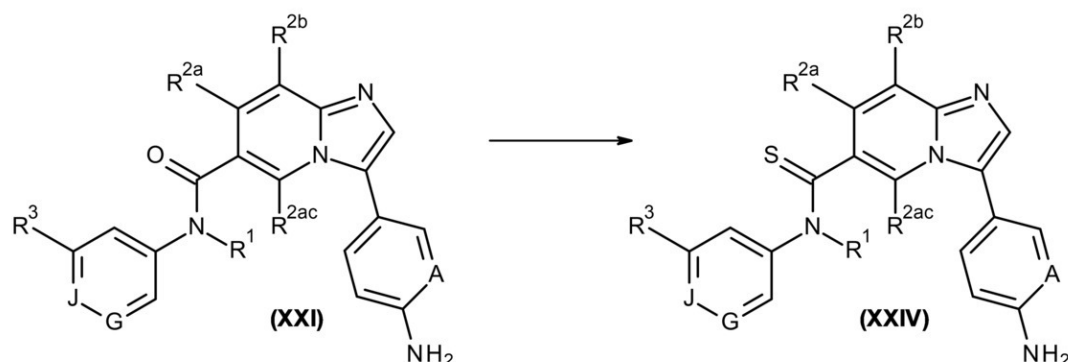
スキーム１８

20

【０１３２】

式（XXIV）の化合物は、トルエン、キシレン又はジクロロメタンなどの適切な溶媒中、式（XXI）の化合物を五硫化リン又はローソン試薬（CAS：１９１７２－４７－５）と反応させることによって調製することができる。この変換をスキーム１９に示す。

【化２３】



30

スキーム１９

【０１３３】

「本発明に係る化合物」という用語が使用される場合、これは、上で定義した実施形態１～４３のいずれか１つによる化合物を指す。

40

【０１３４】

代わりに、実施形態１～４３のいずれか１つによる化合物は、当業者に公知である標準的な合成技術を用いる変換により得ることが可能である。網羅的ではないが、例としては、酸化反応、還元反応、加水分解反応、カップリング反応、芳香族求核又は求電子置換反応、求核置換反応、求核付加反応、オレフィン化反応、オキシム形成反応、アルキル化反応及びハロゲン化反応が挙げられる。

【０１３５】

実施形態１～４３のいずれか１つによる化合物は、それ自体公知の方法において、実施形態１～４３のいずれか１つによる出発化合物の１つ以上の置換基を、慣用的な方法において、本発明による（１つ以上の）別の置換基で置き換えることにより、実施形態１～４

50

3のいずれか1つによる別の化合物に変換され得る。

【0136】

それぞれの場合に適切な反応条件及び出発物質の選択に応じて、例えば1つの反応ステップで1つの置換基のみを本発明による別の置換基で置換することが可能であるか、又は同じ反応ステップで複数の置換基を本発明による別の置換基で置換することが可能である。

【0137】

実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製することができる。従って、例えば、実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の酸付加塩は、適切な酸又は適切なイオン交換体試薬を用いた処理によって得られ、塩基との塩は、適切な塩基を用いた処理又は適切なイオン交換体試薬を用いた処理によって得られる。

10

【0138】

実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の塩は、酸付加塩を、例えば適切な塩基性化合物又は適切なイオン交換体試薬を用いて処理し、且つ塩基との塩を、例えば適切な酸又は適切なイオン交換体試薬を用いて処理することにより、慣用的な方法で遊離化合物に変換され得る。

【0139】

実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の塩は、形成される無機塩、例えば塩化銀が不溶性であり、そのため、反応混合物から析出する適切な溶媒中において例えば塩酸塩などの無機酸の塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの酸の適切な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、それ自体公知の方法において、実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の別の塩である酸付加塩、例えば別の酸付加塩に変換され得る。

20

【0140】

手順又は反応条件に応じて、塩を形成する特性を有する実施形態1～43のいずれか1つによる化合物は、遊離形態又は塩の形態で得ることができる。

【0141】

それぞれの場合に遊離形態又は塩形態である、実施形態1～43のいずれか1つによる化合物及び適切な場合にはその互変異性体は、可能な立体異性体の1つの形態において又はこれらの混合物として存在し得、例えば分子中に生じる不斉炭素原子の数、絶対配置及び相対配置に応じて且つ／又は分子中に生じる非芳香族二重結合の配置に応じて、対掌体及び／若しくはジアステレオマーなどの純粋な立体異性体の形態において又はエナンチオマー混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物若しくはラセミ体混合物などの立体異性体混合物として存在し得る。本発明は、純粋な立体異性体のみならず、可能な全ての立体異性体混合物にも関し、立体化学的な詳細がそれぞれの場合に具体的に言及されない場合でも、それぞれの場合に本明細書の上記及び以下においてこの意味で理解されるべきである。

30

【0142】

いずれの出発物質及び手順を選択したかに応じて得ることができる、遊離形態又は塩形態の、実施形態1～43のいずれか1つによる化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ体混合物は、例えば、分別結晶化、蒸留及び／又はクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて公知の方法で純粋なジアステレオマー又はラセミ体に分離され得る。

40

【0143】

同様の方法で得ることができるラセミ体などのエナンチオマー混合物は、公知の方法、例えば光学活性溶媒からの再結晶、キラル吸着剤上でのクロマトグラフィー、例えばアセチルセルロース上での高速液体クロマトグラフィー（HPLC）、適切な微生物を利用した特定の固定化酵素による開裂、包接化合物の形成、例えば1つのエナンチオマーのみと複合体化するキラルクラウンエーテルの使用又はジアステレオマー塩への変換により、例えば塩基性の最終生成物であるラセミ体を光学活性な酸、例えばカルボン酸、例えばカン

50

ファー、酒石酸若しくはリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などと反応させ、このようにして得ることができるジアステレオマー混合物を、例えばそれらの異なる溶解性に基づく分別結晶化によって分離してジアステレオマーを得る（これから例えば塩基性試薬などの適切な試薬の作用によって目的のエナンチオマーを遊離させることができる）ことにより、光学対掌体に分割することができる。

【0144】

純粋なジアステレオマー又はエナンチオマーは、適当な立体異性体混合物を分離することによってのみならず、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的な合成の一般に知られている方法、例えば適切な立体化学の出発物質を用いて本発明による方法を行うことによっても、本発明に従って得ることができる。

10

【0145】

N-オキシドは、酸無水物、例えばトリフルオロ酢酸無水物の存在下、実施形態1～5のいずれか1つによる化合物を適切な酸化剤、例えばH₂O₂／尿素付加物と反応させることによって調製することができる。そのような酸化は文献公知であり、例えばJ. Med. Chem., 32(12), 2561-73, 1989又は国際公開第00/15615号から公知である。

【0146】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれの場合に生物学的により有効な立体異性体、例えばエナンチオマー若しくはジアステレオマー又は立体異性体混合物、例えばエナンチオマー混合物若しくはジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

20

【0147】

それぞれの場合に遊離形態又は塩形態である、実施形態1～5のいずれか1つによる化合物及び適切な場合にはその互変異性体は、適切な場合には水和物の形態で得ることもでき、且つ／又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用された可能性のある溶媒を含むこともできる。

【0148】

以下の例は、本発明を例示するが、限定するものではない。

【0149】

本発明は、実施形態1～43のいずれか1つによる化合物の調製に有用な中間体も提供する。

30

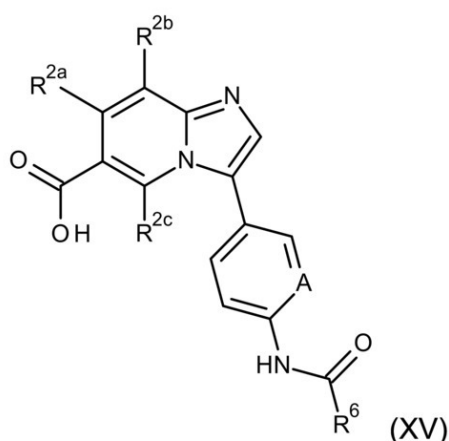
【0150】

以下の中間体は新規であり、それ自体が本発明の追加の態様を形成する。

【0151】

式(XV)

【化24】



40

(式中、

50

A は、CH 又は N であり；

R^6 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルコシアマミノ及び C_{1-6} アルキル- C_{1-6} アルコシアマミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく、好ましくは、 R^6 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ及び $NHC(O)-C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され、好ましくは、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ハロゲン、CN、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから独立して選択される)

の化合物。

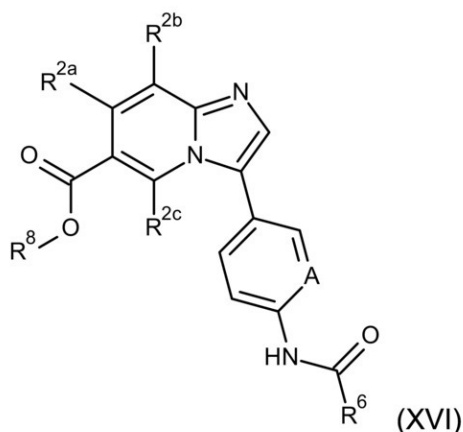
【0152】

A、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^6 についての好ましいものは、式 (I) の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

【0153】

式 (XVI)

【化25】



(式中、

A は、CH 又は N であり；

R^6 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルコシアマミノ及び C_{1-6} アルキル- C_{1-6} アルコシアマミノから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲン及び CN から独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；好ましくは、 R^6 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキルから選択され、前記基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される 1～3 つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、好ましくは、 R^8 はメチル及びエチルから選択され；及び

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニ

ル、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ及び $NHC(O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され、好ましくは、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ハロゲン、CN、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから独立して選択される)

の化合物。

【0154】

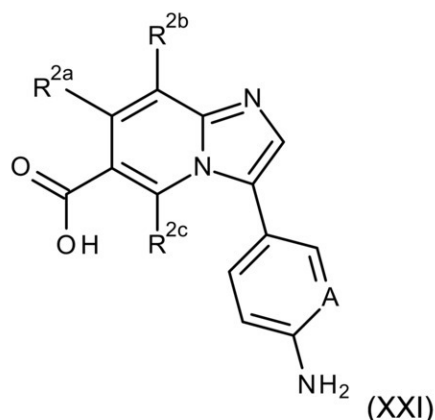
A、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^6 についての好ましいものは、式(I)の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

【0155】

式(XXI)

【化26】

10



20

(式中、

Aは、CH又はNであり；及び

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 C_{1-6} アルキルスルファニル、 C_{1-6} アルキルスルフィニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ及び $NHC(O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され、好ましくは、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、H、ハロゲン、CN、 C_{1-4} アルキル及び C_{1-4} アルコキシから独立して選択される)

30

の化合物。

【0156】

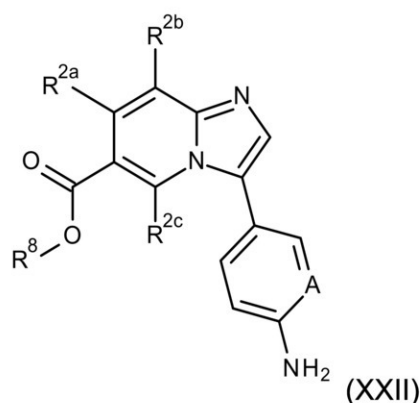
R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} についての好ましいものは、式(I)の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

【0157】

式(XXII)

【化27】

40



50

(式中、

A は、CH 又は N であり；

R⁸ は、C₁～C₆アルキルであり、好ましくは、R⁸ は、メチル及びエチルから選択され；及び

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシ、アミノ及びNH C(O) C₁₋₆アルキルから独立して選択され、好ましくは、R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ハロゲン、CN、C₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから独立して選択される)

の化合物。

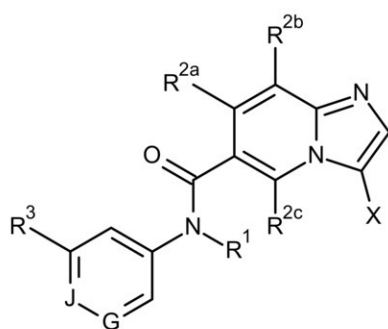
【0158】

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}についての好ましいものは、式(I)の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

【0159】

式(II)

【化28】



(II)

(式中、

R¹は、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₁₋₄アルコキシ及びCNから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル及びC₁₋₄アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシ、アミノ及びNH C(O) C₁₋₆アルキルから独立して選択され、好ましくは、R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ハロゲン、CN、C₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから独立して選択され；

Jは、CR⁴又はNであり；

Gは、CR⁵又はNであり；

JがNである場合、Gは、CR⁵であり；及びGがNである場合、Jは、CR⁴であり；

R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₆アルキ

ル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル及びC₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく、好ましくは、R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

10

Xは、Cl、Br又はIであり、より好ましくは、Xは、Cl又はIである）の化合物。

【0160】

特定の実施形態では、R³及びR⁵は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル及びC₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく、好ましくは、R³及びR⁵は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

20

30

R⁴は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル及びC₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく、好ましくは、R⁴は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ

40

50

1-4アルコキシ、ハロゲン、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい。

【0161】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R³、J、G、R³、R⁴及びR⁵についての好ましいものは、式(I)の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

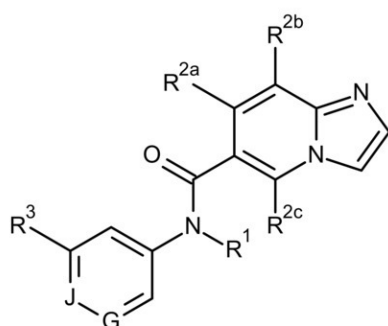
【0162】

式(II)の化合物に従うより好ましい実施形態では、R⁴は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び／又はXは、Cし若しくはIである。

【0163】

式(XVII)

【化29】



(XVII)

(式中、

R¹は、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₁₋₄アルコキシ及びCNから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル及びC₁₋₄アルコキシ基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；

R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ヒドロキシ、ハロゲン、CN、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシ、アミノ及びNH C(O) C₁₋₆アルキルから独立して選択され、好ましくは、R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、H、ハロゲン、CN、C₁₋₄アルキル及びC₁₋₄アルコキシから独立して選択され；

Jは、CR⁴又はNであり；

Gは、CR⁵又はNであり；

JがNである場合、Gは、CR⁵であり；及びGがNである場合、Jは、CR⁴であり；及び

R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋

6アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルカルボニル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ-C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルファニル、C₁₋₆アルキルスルフィニル、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルキルアミノカルボニル、ジC₁₋₆アルキルアミノカルボニル及びC₁₋₆アルキルカルボニル基のそれぞれは、ハロゲン及びCNから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく、好ましくは、R³、R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい)

の化合物。

【0164】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R³、J、G、R³、R⁴及びR⁵についての好ましいものは、式(I)の化合物の対応する置換基について示した好ましいものと同じである。

【0165】

式(XVII)の化合物に従うより好ましい実施形態では、R³、R⁴及びR⁵の少なくとも1つは、Hではなく、より具体的には、

— R³及びR⁴は、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

— R⁵は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよい。

【0166】

式(XVII)の化合物に従う別のより好ましい実施形態では、

— R³は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、F、Br、I、CN、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル及びヒドロキシから選択され、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄アルコキシ、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル及びC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₃アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1～3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

— R⁴及びR⁵は、H、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₄ア

ルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、 CN 、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい。前記別のより好ましい実施形態では、 R^3 及び R^4 は、より具体的には Cl ではない。

【0167】

式(XVII)の化合物に従う別のより好ましい実施形態では、

— R^3 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 F 、 Br 、 I 、 CN 、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよく；及び

— R^4 及び R^5 は、 H 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン、 CN 、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル及びヒドロキシから独立して選択され、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル基のそれぞれは、ハロゲンから独立して選択される1~3つの置換基で任意に置換されていてもよい。前記別のより好ましい実施形態では、 R^3 及び R^5 は、より具体的には Cl ではない。

【0168】

実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、農業部門及び関連する使用分野では、例えば植物有害生物又は非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物の防除に係る有効成分として用いられ得る。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性及び環境に対して安全であることにより際立って優れたものである。これらは、極めて有用な治療的特性、予防的特性及び浸透移行特性を有すると共に、多くの栽培植物の保護に用いられ得る。実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物又は植物の一部(果実、花、葉、莖、塊莖、根)に生じる有害生物を阻害又は駆除するために、他方では、同時に、後に成長する植物のこれらの部位も例えば植物病原性微生物から保護するために用いられ得る。

【0169】

実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書で用いられる場合、真菌の増殖を防除、変性又は防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物又はこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除又は変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリア又は他の防御形成を含む。

【0170】

土壤中で発生する真菌性感染症及び植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊莖若しくは穀粒などの種子又は植物挿穂(例えば、イネ)といった植物繁殖材料を処理する粉衣剤として、実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物を用いることも可能である。この繁殖材料は、植え付け前に、実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物を含む組成物で処理され得る。例えば、種子は、播種される前に粉衣され得る。実施形態1~43のいずれか1つに定義される式(I)の化合

10

20

30

40

50

物は、種子を液体配合物中に含浸させるか、又は種子を固体配合物でコーティングすることによっても穀粒に適用（コーティング）され得る。組成物は、繁殖材料が植え付けられる際に植え付け箇所にも適用され得、例えば播種中に蒔き溝に適用され得る。本発明は、このような植物繁殖材料の処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料にも関する。

【0171】

さらに、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、例えば、木材及び木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられ得る。

【0172】

加えて、本発明は、例えば、材木、壁板及び塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられ得る。

【0173】

これらを含む、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物及び殺菌・殺カビ組成物を用いて、広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。これらは、観賞用作物、芝生、野菜、農作物、穀類及び果実作物の葉病原体などの広範囲の植物病害の防除で効果的である。

【0174】

防除され得る、これらの病害に係る真菌及び真菌媒介物並びに植物病原性バクテリア及びウイルスは、例えば、以下のとおりである。

アブシジアコリムビフェラ (*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種 (*Alternaria* spp)、アフアノミセス属の一種 (*Aphanomyces* spp)、アスコキタ属の一種 (*Ascochyta* spp)、A. フラバス (*A. flavus*)、A. フミガーツス (*A. fumigatus*)、A. ニズランス (*A. nidulans*)、A. ニガー (*A. niger*)、A. テルス (*A. terrus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus* spp.)、A. プルランス (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、ブラストミセスデルマチチディス (*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、ブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、B. ドチデア (*B. dothidea*)、B. オブツサ (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、B. シネレア (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C. アルビカンス (*C. albicans*)、C. グラブラータ (*C. glabrata*)、C. クルセイ (*C. krusei*)、C. ルシタニエ (*C. lusitaniae*)、C. パラプシロシス (*C. parapsilosis*)、C. トロピカリス (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグランス (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp)、C. アラクジコラ (*C. arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリジウムベルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種 (*Cladosporium* spp)、クラビセプスブルブレア (*Claviceps purpurea*)、

コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、C. ムサエ (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、

クリプトコッカスネオフォルマンス (*Cryptococcus neoformans*)、ジアボルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、

エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニ

10

20

30

40

50

アアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E. シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、
 ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F. クルモルム* (*F. culmorum*)、
F. グラミネアルム (*F. graminearum*)、*F. ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F. モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F. オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F. プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F. スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F. ソラニ* (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、*ゲーウマノミセスグラミニス* (*Gaeumannomyces graminis*)、*ギベレラフジクロイ* (*Gibberella fujikuroi*)、*グロエオデスポミゲナ* (*Gloeodes pomigena*)、*グロエオスポリウムムサルム* (*Gloeosporium musarum*)、*グロメララシングレート* (*Glomerella cingulate*)、*ガイグナルディアビドウェリイ* (*Guignardia bidwellii*)、*ギムノスポランギウム ジュニペリーヴィルギニアネ* (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、*ヘルミントスポリウム属*の一種 (*Helminthosporium* spp)、*ヘミレイア属*の一種 (*Hemileia* spp)、*H. カプスラツム* (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、*ラエチサリアフシホルミス* (*Laetisaria fuciiformis*)、*レプトグラフィウムリンドベルギ* (*Leptographium lindbergi*)、*レベイルラタウリカ* (*Leveillula taurica*)、*ロフォデルミウムセディチオスム* (*Lophodermium seditiosum*)、*コムギ赤かび病菌* (*Microdochium nivale*)、*ミクロスポルム属*の一種 (*Microsporum* spp)、*モニリニア属*の一種 (*Monilinia* spp)、*ムコール属*の一種 (*Mucor* spp)、*コムギ葉枯病菌* (*M. graminicola*)、*M. ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、*オンコバシジウムテオブロマエオン* (*Oncobasidium theobromaeon*)、*オフィオストマピセエ* (*Ophiostoma piceae*)、*パラコジディオイデス属*の一種 (*Paracoccidioides* spp)、*P. デジタツム* (*P. digitatum*)、*P. イタリクム* (*P. italicum*) を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、*ペトリエリジウム属*の一種 (*Petriellidium* spp)、*P. メイディス* (*P. maydis*)、*P. フィリピネンシス* (*P. philippinensis*) 及び *P. ソルギ* (*P. sorghi*) を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (*Peronosclerospora* spp.)、*ペロノスポラ属*の一種 (*Peronospora* spp)、*コムギふ枯病菌* (*Phaeosphaeria nodorum*)、*ファコプソラパチリジ* (*Phakopsora pachyrhizi*)、*フェリヌスイグニアルス* (*Phellinus igniarius*)、*フィアロフォラ属*の一種 (*Phialophora* spp)、*フォーマ属*の一種 (*Phoma* spp)、*ホモブシスピティコーラ* (*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス* (*P. infestans*) を含むフィトフトラ属の一種 (*Phytophthora* spp.)、*P. ハルステジイ* (*P. halstedii*)、*P. ビチコラ* (*P. viticola*) を含むプラズモパラ属の一種 (*Plasmopara* spp.)、*プレオスポラ属*の一種 (*Pleospora* spp.)、*リンゴうどんこ病菌* (*P. leucotricha*) を含むポドスファエレラ属の一種 (*Podosphaera* spp.)、*ポリミキサグラミニス* (*Polymyxa graminis*)、*ポリミキサベタエ* (*Polymyxa betae*)、*シュードセルコスボレラヘルボトリコイド* (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、*シュードモナス属*の一種 (*Pseudomonas* spp)、*P. クベンシス* (*P. cubensis*)、*P. フムリ* (*P. humuli*) を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora* spp.)、*シュードベジザトラケイフィラ* (*Pseudo*

10

20

30

40

50

peziza tracheiphila)、P. ホルデイ (P. hordei)、P. レコンディタ (P. recondita)、P. ストリイホルミス (P. striiformis)、P. トリチシナ (P. trititina) を含むプッシニア属の一種 (Puccinia spp.)、ピレノペジザ属の一種 (Pyrenopeziza spp.)、ピレノフォラ属の一種 (Pyrenophora spp.)、イネいもち病菌 (P. oryzae) を含むピリクラリア属の一種 (Pyricularia spp.)、P. ウルチムム (P. ultimum) を含むピシウム属の一種 (Pythium spp.)、ラムラリア属の一種 (Ramularia spp.)、リゾクトニア属の一種 (Rhizoctonia spp.)、リゾムコールプシルス (Rhizomucor pusillus)、リゾプスアリズス (Rhizopus arrhizus)、リンコスポリウム属の一種 (Rhynchosporium spp.)、S. アピオスペルムム (S. apiospermum) 及び S. プロリフィカンス (S. proliferans) を含むセドスポリウム属の一種 (Scedosporium spp.)、スキゾチリウムポミ (Schizothyrium pomi)、

スクレロチニア属の一種 (Sclerotinia spp.)、スクレロチウム属の一種 (Sclerotium spp.)、S. ノドルム (S. nodorum)、S. トリティシ (S. tritici) を含むセプトリア属の一種 (Septoria spp.)、スファエロテカマクラリス (Sphaerotheca macularis)、スファエロテカフスカ (Sphaerotheca fusca) (スファエロテカフリギネア (Sphaerotheca fuliginea))、スポロトリクス属の一種 (Sporothrix spp.)、スタゴノスポラノドルム (Stagonospora nodorum)、ステムフィリウム属の一種 (Stemphylium spp.)、ステレウムヒルスツム (Stereum hirsutum)、タナテホルスククメリス (Thanatephorus cucumeris)、チエラビオプシスバシコラ (Thielaviopsis basicola)、チレチア属の一種 (Tilletia spp.)、T. ハルジアヌム (T. harzianum)、T. シュードコニンギイ (T. pseudokoningii)、T. ヴィリデ (T. viride) を含むトリコデルマ属の一種 (Trichoderma spp.)、

トリコフィトン属の一種 (Trichophyton spp.)、チフラ属の一種 (Typhula spp.)、ウンシヌラネカトル (Uncinula necator)、ウロシスチス (Urocystis spp.)、ウスチラゴ属の一種 (Ustilago spp.)、V. イナエクアリス (V. inaequalis) を含むベンチュリア属の一種 (Venturia spp.)、ベルチシリウム属の一種 (Verticillium spp.) 及びキサントモナス属の一種 (Xanthomonas spp.)。

【0175】

特に、実施形態 1～43 のいずれか 1 つに定義される式 (I) の化合物及びそれらを含む殺菌・殺カビ組成物は、担子菌綱 (Basidiomycete)、子囊菌綱 (Ascomycete)、卵菌綱 (Oomycete) 及び／又は不完全菌類 (Deuteromycete)、ブラソクラディオマイセート (Blasocladiomycete)、ツボカビ綱 (Chytridiomycete)、グロムス門 (Glomeromycete) 及び／又はケカビ綱 (Mucoromycete) における広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除するために使用することができる。より具体的には、実施形態 1～43 のいずれか 1 つに定義される式 (I) の化合物は、卵菌を防除するために使用することができる。

【0176】

これらの病原体としては、以下が挙げられ得る。

卵菌綱 (Oomycete) であって、以下を含む。フィトフトラカプシシ (Phytophthora capsici)、フィトフトラインフェスタンス (Phytophthora infestans)、フィトフトラソヤエ (Phytophthora sojae)、フィトフトラフラガリエ (Phytophthora fragaria

e)、フィトフトラニコチアナエ (*Phytophthora nicotianae*)、フィトフトラシンナモミ (*Phytophthora cinnamomi*)、フィトフトラシトリコラ (*Phytophthora citricola*)、フィトフトラシトロフトラ (*Phytophthora citrophthora*) 及びフィトフトラエリトロセブチカ (*Phytophthora erythroseptica*) によって引き起こされるものなどのフィトフトラ (*Phytophthora*) 病害; ピシウムアフアニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*)、ピシウムアレノマネス (*Pythium arrhenomanes*)、ピシウムグラミニコラ (*Pythium graminicola*)、ピシウムイレグラレ (*Pythium irregulare*)、ピシウムシルバティカム (*Pythium sylvaticum*) 及びピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) によって引き起こされるものなどのピシウム (*Pythium*) 病害; ペロノスポラデストルクトル (*Peronospora destructor*)、ペロノスポラパラシティカ (*Peronospora parasitica*)、プラズモパラビチコーラ (*Plasmopara viticola*)、プラズモパラハルステジイ (*Plasmopara halstedii*)、シュードペロノスポラクベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)、アルブゴカンジダ (*Albugo candida*)、スクレログトラマクロスポラ (*Sclerophthora macrospora*) 及びブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*) などのツユカビ目 (*Peronosporales*) によって引き起こされる病害; 並びにアフアノミセスコクリオイデス (*Aphanomyces cochlioides*)、ラビリンツラゾステラエ (*Labyrinthula zosterae*)、ペロノスクレロスポラソルギ (*Peronosclerospora sorghi*) 及びスクレロスポラグラミニコラ (*Sclerospora graminicola*) などの他のもの。

10

20

30

40

50

【0177】

子嚢菌綱 (*Ascomycetes*) であって、例えば、ステムフィリウムソラニ (*Stemphylium solani*)、スタゴノスポラタイナネンシス (*Stagonospora tainanensis*)、スピロカエアオレアギネア (*Spilocaea oleaginea*)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ (*Pyrenochaeta lycoperisici*)、プレオスポラヘルバルム (*Pleospora herbarum*)、フォマデストルクティバ (*Phoma destructiva*)、ファエオスファエリアヘルボトリコイデス (*Phaeosphaeria herpotrichoides*)、ファエオクリプトクスガエウマンニイ (*Phaeocryptococcus gaeumannii*)、オフィオスファエレラグラミニコラ (*Ophiosphaerella graminicola*)、オフィボルスグラミニス (*Ophiobolus graminis*)、レプトスファエリアマ克蘭ス (*Leptosphaeria maculans*)、ヘンデルソニアクレベリマ (*Hendersonia creberriima*)、ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス (*Helminthosporium tritici repentis*)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ドレックスレラグリシネス (*Drechslera glycines*)、ジディメラブリオニエ (*Didymella bryoniae*)、シクロコニウムオレアギネウム (*Cyloconium oleagineum*)、コリネスポラカッシイコラ (*Corynespora cassiicola*)、コクリオボルスサチブス (*Cochliobolus sativus*)、ビポラリスカクティボラ (*Bipolaris cactivora*)、リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*)、コムギ黄斑病菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*)、アルテルナリアアルテナタ (*Alternaria alternata*)、アルテルナリアブラッシシコラ (*Alternaria brassicicola*)、アルテルナリアソラニ

(*Alternaria solani*) 及びアルテルナリアトマトフィラ (*Alternaria tomato phil a*) などのプレオスポラ目 (*Pleosporales*) ; セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*)、セプトリアノドルム (*Septoria nodorum*)、セプトリアグリシネス (*Septoria glycines*)、セルコスボラアラキディコーラ (*Cercospora arachidicola*)、セルコスボラソジナ (*Cercospora soja na*)、セルコスボラセアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスボレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) 及びセルコスボレラヘルポトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカプノディウム目 (*Capnodiales*) ; クラドスポリウムカルポフィルム (*Cladosporium carpophilum*)、クラドスポリウムエフスム (*Cladosporium effusum*)、パッサロラフルバ (*Passalora fulva*)、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*)、ドチストロマッセプトスポルム (*Dothistroma septosporum*)、イサリオブシスクラビスポラ (*Isariopsis clavisp ora*)、マイコスファエレラフィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*)、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、マイコベロシエラコエプケイイ (*Mycovellosiella koepkeii*)、ファエオイサリオブシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、シュードセルコスボラビチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collo-cygni*)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、マグナポルテグリセア (*Magnaporthe grisea*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) などのマグナポルテ目 (*Magnaporthales*) ; アニソグラマアノマラ (*Anisogramma anomala*)、アピオグノモニアエラブンダ (*Apiognomon ia errabunda*)、サイトスポラプラタニ (*Cytospora platani*)、ジアポルテファセオロルム (*Diaporthe phaseolorum*)、ディスクラデストルクティバ (*Discula destructiva*)、グノモニアフルクティコーラ (*Gnomonia fructicola*)、グリネリアウビコーラ (*Greeneria uvicola*)、メランコニウムジュグランディヌム (*Melanconium juglandinum*)、ホモブシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、シロコッカスクラビギグネンティージュグランダセアラム (*Sirococcus clavigignenti-juglandacearum*)、ツバキアドリナ (*Tubakia dryina*)、ディカルペラ属の一種 (*Dicarpella spp.*)、バルサセラトスベルマ (*Valsa ceratosperma*) などのジアポルテ目 (*Diaporthales*) ; 並びにアクチノチリウムグラミニス (*Actinothyrium graminis*)、アスコキタピシ (*Ascochyta pisi*)、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*)、アスペルギルスフミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、アスペルギルスニズランス (*Aspergillus nidulans*)、アスペリスポリウムカリカエ (*Asperisporium caricae*)、ブルメリエラジャアピイ (*Blumeriella jaapii*)、カンジダ属の一種 (*Candida spp.*)、カプノジウムラモスム (*Capnodium ramosum*)、セファロアスクス属の一種 (*Cephaloascus spp.*)、セファロスポリウムグラミネウム (*Cephalosporium gramineum*)、セラトシスティスパラドクサ (*Ceratocystis paradoxa*)、キトミウム属の一種 (*Chaetomium spp.*)、ヒメノシフスシュードアルビズス (*Hymenoscyphus p*

seudoalbidus）、コッシディオイデス属の一種 (*Coccidioides* spp.)、シリンドロスポリウムパディ (*Cylindrosporium padi*)、ジブロカルボンマラエ (*Diplocarpon malae*)、ドレパノペジザカンペストリス (*Drepanopeziza campestris*)、エルシノエアンペリナ (*Elsinoe ampelina*)、エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、ゲオトリクムカンジズム (*Geotrichum candidum*)、ギベリナセラリス (*Gibellina cerealis*)、グロエオセルコスボラソルギ (*Gloeocercospora sorghi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムペレナンス (*Gloeosporium perennans*)
 などの他のものによって引き起こされるものといった汚斑病、斑点病、イモチ病若しくは胴枯れ病及び／又は腐敗病；グロエオチニアテムレンタ (*Gloeotinia temulenta*)、グリフォスパエリアコルチコラ (*Griphosphaeria corticola*)、カバチエラリニ (*KabatIELla lini*)、レプトグラフィウムミクロスポルム (*Leptographium microsporum*)、レプトスファエルリニアクラッサスカ (*Leptosphaerulina crassiasca*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、マルソニナグラミニコラ (*Marssonina graminicola*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、モニリニアフルクティコーラ (*Monilinia fructicola*)、モノグラフェラアルベセンス (*Monographella albescens*)、モノスポラスクスカノンバルス (*Monosporascus cannonballus*)、ナエマシクルス属の一種 (*Naemacyclus* spp.)、オフィオストマノボウルミ (*Ophios tomanovo-ulmi*)、パラコシジオイデスブラジリエンシス (*Paracoccidioides brasiliensis*)、ペニシリウムエクソパンスム (*Penicillium expansum*)、ペスタロチアロドデンドリ (*Pestalotia rhododendri*)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp.)、ペジクラ属の一種 (*Pezicula* spp.)、フィアロホラグレガタ (*Phialophora gregata*)、フィラコラポミゲナ (*Phyllachora pomigena*)、フィマトトリクムオムニボラ (*Phymatotrichum omnivora*)、フィサロスボラアブディタ (*Physalospora abditata*)、プレクトスポリウムタバシヌム (*Plectosporium tabacinum*)、ポリシタルムプスツランス (*Polyscytalum pustulans*)、シュードペジザメディカギニス (*Pseudopeziza medicaginis*)、ピレノペジザブラッシカエ (*Pyrenopeziza brassicae*)、ラムリスボラソルギ (*Ramulispora sorghi*)、ラブドクリンシュードツガエ (*Rhabdocline pseudotsugae*)、リンコスボリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*)、イネ葉しょう腐敗病菌 (*Sacrocladium oryzae*)、スケドスポリウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムポミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニアスクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*)、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*)；スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium* spp.)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、セイマトスポリウムマリエ (*Seimatosporium mariae*)、レプテウチパクプレッシ (*Lepteutypa cupressi*)、セプトシタルボルム (*Septocytia ruborum*)、スファセロマペルセー (*Sphaceloma perseae*)、スポロネマファシディオイデス (*Sporonema phacidioides*)、スティグミナパルミボラ (*Stigmina palmivora*)、タペシアヤルンデ (*Tapesia ya*

10

20

30

40

50

lundae)、タフリナブラタ(*Taphrina bullata*)、チエビオブシスバシコラ(*Thielviopsis basicola*)、トリコセプトリアグルクチゲナ(*Trichoseptoria fructigena*)、ジゴフィアラジャミセンシス(*Zygophiala jamaicensis*)；例えばブルメリアグラミニス(*Blumeria graminis*)、エリシフェポリゴニ(*Erysiphe polygoni*)、ウンシヌラネカトル(*Uncinula necator*)、スファエロテカフリゲナ(*Sphaerotheca fuligena*)、リンゴうどんこ病菌(*Podosphaera leucotricha*)、ポドスパエラマクラリス(*Podosphaera macularis*)、ゴロビノマイセスシコラセルム(*Olovinomyces cichoracearum*)、レベイルラタウリカ(*Leveillula taurica*)、ミクロスファエラディフッサ(*Microsphaera diffusa*)、オイディオブシスゴッシピイ(*Oidiopsis gossypii*)、フィラクチニアグッタタ(*Phyllactinia guttata*)及びオイジウムアラキディス(*Oidium arachidis*)などのウドンコカビ目(*Erysiphales*)によって引き起こされるものといったウドンコ病病害；例えばドチオレアラロマチカ(*Dothiorella aromatica*)、ジプロディアセリアタ(*Diplodia seriata*)、ガイグナルディアビドウェリイ(*Guignardia bidwellii*)、ボトリチスシネレア(*Botrytis cinerea*)、ボトリオチニアアリイ(*Botryotinia allii*)、ボトリオチニアファビ(*Botryotinia fabae*)、フシコクムアミグダリ(*Fusicoccum amygdali*)、ラシオジプロディアテオブロマエ(*Lasiodiplodia theobromae*)、マクロフォーマテイコラ(*Macrophoma theicola*)、マクロフォミナファセオリナ(*Macrophoma phaseolina*)、フィロスティクタククルビタセアルム(*Phyllosticta cucurbitacearum*)などのボトリオスフェリア目(*Botryosphaerales*)によって引き起こされるものといったかび類；例えばコレトトリカムグロエオスポリオイデス(*Colletotrichum gloeosporioides*)、コレトトリカムラゲナリウム(*Colletotrichum lagenarium*)、コレトトリカムゴッシピイ(*Colletotrichum gossypii*)、グロメララシングラタ(*Glomerella cingulata*)及びコレトトリカムグラミニコラ(*Colletotrichum graminicola*)などのグロメララレス属(*Glomerellales*)によって引き起こされるものといった炭疽病；並びに例えばアクレモニウムストリクツム(*Acremonium strictum*)、クラビセプスプルブレア(*Claviceps purpurea*)、フザリウムクルモルム(*Fusarium culmorum*)、フザリウムグラミネアルム(*Fusarium graminearum*)、フザリウムビルグリホルム(*Fusarium virguliforme*)、フザリウムオキシスポルム(*Fusarium oxysporum*)、フザリウムスブグルチナンス(*Fusarium subglutinans*)、フザリウムオキシスポルム(*Fusarium oxysporum* f. sp. cubense)、ゲルラキアニバレ(*Gerlachia nivale*)、ギベラフジクロイ(*Gibberella fujikuroi*)、ギベラゼアエ(*Gibberella zeae*)、グリオクラジウム属の一種(*Gliocladium* spp.)、ミロテシウムベルカリア(*Myrothecium verrucaria*)、ネクトリアラムライエ(*Nectria ramulariae*)、トリコデルマビリデ(*Trichoderma viride*)、トリコテシウムロセウム(*Trichothecium roseum*)及びベルチシリウムテオブロマエ(*Verticillium theobromae*)などの肉座菌目(*Hypocreales*)によって引き起こされるものといった萎凋病又は胴枯れ病。

【0178】

例えばウスチラギノイデアビレンス(*Ustilaginoida virens*)

、ウスチラゴヌダ (*Ustilago nuda*)、ウスチラゴトリティシ (*Ustilago tritici*)、ウスチラゴゼアエ (*Ustilago zeae*) などのクロボキン目 (*Ustilaginales*) によって引き起こされるものといった黒穂病菌を含む担子菌綱 (*Basidiomycete*)、例えばセロテリウムフィチ (*Cerotelium fici*)、クリソミクスアルクトスタフィリ (*Chrysomyxa arctostaphyli*)、コレオスポリウムイポモエアエ (*Coleosporium ipomoeae*)、ヘミレイアバスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)、プッシニアアラキディス (*Puccinia arachidis*)、プッシニアカカバタ (*Puccinia cacabata*)、プッシニアグラミニス (*Puccinia graminis*)、プッシニアレコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッシニアソルギ (*Puccinia sorghi*)、プッシニアホルデイ (*Puccinia hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis* f. sp. *Hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis* f. sp. *Secalis*)、プッシニアストルムコリリ (*Pucciniastrum coryli*) などのサビキン目 (*Pucciniales*) 又はクロナルチウムリビコラ (*Cronartium ribicola*)、ジムノスポランギウムジュニペリービジニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、メランプソラメデュサエ (*Melampsora medusae*)、ファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フラグミジウムムクロナツム (*Phragmidium mucronatum*)、フィソペラアンペロシディス (*Physopella ampeloidis*)、トランスケリアディスコロール (*Tranzschelia discolor*) 及びウロマイセスビシエーファビエ (*Uromyces viciae-fabae*) などのサビキン目 (*Uredinales*) によって引き起こされるものといったサビ病菌；並びにクリプトコックス属の一種 (*Cryptococcus* spp.)、エクソバシジウムベクスアン (*Exobasidium vexans*)、マラスミエルスイノデルマ (*Marasmiellus inoderma*)、マイセナ属の一種 (*Mycena* spp.)、スファセロテカレイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、ウロシスチスアグロピリ (*Urocystis agropyri*)、イテルソニアペルプレキサン (*Itersonilia perplexans*)、クルチシウムインビスム (*Corticium invisum*)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、ワイテアシルシナタ (*Waitea circinata*)、イネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、テンサイ根腐病菌 (*Thanetophorus cucurmeris*)、エンチロマダリアエ (*Entyloma dahliae*)、エンチロメラミクロスポラ (*Entylomella microspora*)、ネオボシアモリニアエ (*Neovossia molinia*) 及びチレチアカリエス (*Tilletia caries*) によって引き起こされるものなどの他の腐敗病及び病害。

【0179】

フィソデルママイディス (*Physoderma maydis*) などのコウマクノウキン目 (*Blastocladiomycetes*)。

【0180】

コアネフォラククリビタルム (*Choanephora cucurbitarum*)；ムコール属の一種 (*Mucor* spp.)；リゾプスアルヒズス (*Rhizopus arrhizus*) などのケカビ綱 (*Mucoromycetes*)。

並びに上記に列挙されているものと近縁の他の種及び属によって引き起こされる病害。

【0181】

その殺菌・殺カビ活性に加えて、実施形態 1～43 のいずれか 1 つに定義される式 (I) の化合物及びこれらを含む組成物は、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia am*

10

20

30

40

50

ylovora)、エルウィニアカラトボラ(Erwinia caratovora)、キサントモナスカムペストリス(Xanthomonas campestris)、シュードモナスシリングアエ(Pseudomonas syringae)、ストルプトマイセススカビイス(Strptomyces scabies)などのバクテリア及び他の関連する種並びに特定の原生動物に対する活性も有し得る。

【0182】

本発明の範囲内では、保護される標的作物及び／又は有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリー及びイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ(コーン)、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属(sorghum)ライコムギ及びコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュート及びサイザルといった繊維植物；例えば糖質及び飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ(カノーラ)、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャ及びタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシ及びセイヨウスモモといった果樹；例えばバミューダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバ及びノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージ及びタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ及びダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオ及びクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木及び高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブ及びゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウ及びトマトといった野菜；並びに例えばブドウといったつる植物などの多年生及び1年生作物を含む。

【0183】

本発明に係る有用な植物及び／又は標的作物は、例えば、昆虫抵抗性(例えば、Bt、及びVIP品種)並びに病害抵抗性、除草剤耐性(商品名Roundup Ready(登録商標)及びLiberty Link(登録商標)で市販されている例えばグリホサート及びグルホシネート耐性トウモロコシ品種)及び線虫抵抗性品種などの従来品種並びに遺伝子的に強化又は遺伝子操作された品種を含む。一例として、好適に遺伝子的に強化又は遺伝子操作された品種は、Stoneville 5599BR綿及びStoneville 4892BR綿品種を含む。

【0184】

「有用な植物」及び／又は「標的作物」という用語は、従来交配又は遺伝子操作方法により、プロモキシニルのような除草剤又はある分類の除草剤(例えば、HPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、EPSPS(5-エノール-ピロビル-シキメート-3-リン酸塩-シンターゼ)抑制剤、GS(グルタミンシンターゼ)抑制剤又はPPO(プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ)抑制剤など)に対する耐性がもたらされた有用な植物も含むと理解されるべきである。従来交配方法(突然変異誘発)によって例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield(登録商標)夏ナタネ(カノーラ)である。遺伝子操作方法によって除草剤又はあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready(登録商標)、Herculex I(登録商標)及びLiberty Link(登録商標)で市販されているグリホサート及びグルホシネート耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

【0185】

「有用な植物」及び／又は「標的作物」という用語は、自然発生的なもの又は有害な昆虫に対する抵抗性が与えられたものを含むと理解されるべきである。これは、トキシノー産生バクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの

合成能を例えば有するように、組換えDNA技術を用いて形質転換された植物を含む。発現され得るトキシンの例としては、 δ -エンドトキシン、栄養型殺虫性タンパク質（Vip）、線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質並びにサソリ、蛛形類、大型のハチ（wasp）及び真菌によって産生されるトキシンが挙げられる。バチルスチューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）トキシンを発現するよう変性された作物の一例は、BtトウモロコシKnockOut（登録商標）（Syngenta Seeds）である。殺虫性耐性をコードする2種以上の遺伝子を含み、従って、2種以上のトキシンを発現する作物の一例は、VipCot（登録商標）（Syngenta Seeds）である。作物又はその種子材料も複数の有害生物に対して耐性であり得る（いわゆる遺伝子修飾によって形成される場合の重畳的なトランスジェニックイベント）。例えば、植物は、例えば、Herculex I（登録商標）（Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International）のように除草剤耐性であると同時に、殺虫性タンパク質の発現能を有し得る。

10

【0186】

用語「有用な植物」及び／又は「標的作物」は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」（PRP、例えば欧州特許出願公開第0 392 225号明細書を参照されたい）などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるように、組換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物も含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成可能な形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0 392 225号明細書、国際公開第95／33818号及び欧州特許出願公開第0 353 191号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は、一般に、当業者に公知であると共に、例えば上記の公報に記載されている。

20

【0187】

形質転換植物によって発現され得るトキシンとしては、例えば、セレウス菌（*Bacillus cereus*）若しくはバチルスポピリエ（*Bacillus popilliae*）由来の殺虫性タンパク質；又は例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1若しくはCry9Cといった δ -エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来の殺虫性タンパク質又は例えばVip1、Vip2、Vip3若しくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質（Vip）；又はフォトラブダスルミネセンス（*Photobacterium luminescens*）、ゼノラブダスネマトフィルス（*Xenorhabdus nematophilus*）など、例えばフォトラブダス属の一種（*Photobacterium spp.*）若しくはゼノラブダス属の一種（*Xenorhabdus spp.*）といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質；サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ（wasp）トキシン及び他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン；ストレプトミセス（*Streptomyces*）トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチン又はマツユキソウレクチンなどの植物レクチン；アグルチニン；トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイニン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サボリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質（RIP）；3-ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウム又はカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

30

40

【0188】

さらに、本発明に関連して、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1若しくはCry9Cといった δ -

50

エンドトキシン又は例えばVip1、Vip2、Vip3若しくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質(Vip)とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシン及び修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される(例えば、国際公開第02/15701号を参照されたい)。例えば、切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えばCry3A055の場合、カテプシン-G認識配列がCry3Aトキシンに挿入される(国際公開第03/018810号を参照されたい)。

10

【0189】

このようなトキシン又はこのようなトキシンを合成可能な形質転換植物のさらなる例は、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書及び国際公開第03/052073号に開示されている。

【0190】

このような形質転換植物の調製プロセスは、一般に、当業者に公知であり、例えば上記の刊行物に記載されている。CryI-タイプデオキシリボ核酸及びその調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書及び国際公開第90/13651号から公知である。

20

【0191】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであり得るが、特に甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)及び蝶(鱗翅目)に通常見出される。

【0192】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含有する形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は、YieldGard(登録商標)(Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm(登録商標)(Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus(登録商標)(Cry1Ab及びCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink(登録商標)(Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I(登録商標)(Cry1Fa2トキシン及び酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種); NuCOTN 33B(登録商標)(Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard I(登録商標)(Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard II(登録商標)(Cry1Ac及びCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot(登録商標)(Vip3A及びCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf(登録商標)(Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard(登録商標)、Agrisure(登録商標)GT Advantage(GA21グリホサート耐性形質)、Agrisure(登録商標)CB Advantage(Bt11コーン穿孔性害虫(CB)形質)及びProtecta(登録商標)である。

30

40

【0193】

このような形質転換作物のさらなる例は、以下のとおりである。

【0194】

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France製Bt11トウモロコシ、

50

登録番号C／FR／96／05／10。切断型Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）及びセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（*Zea mays*）。Bt11トウモロコシは、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性も達成している。

【0195】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製Bt176トウモロコシ、登録番号C／FR／96／05／10。Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）及びセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（*Zea mays*）。Bt176トウモロコシは、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性も達成している。

10

【0196】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France製MIR604トウモロコシ、登録番号C／FR／96／05／10。修飾Cry3Aトキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン－G－タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾されたCry3A055である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第03／018810号に記載されている。

20

【0197】

4. Monsanto Europe S. A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製MON863トウモロコシ、登録番号C／DE／02／9。MON863は、Cry3Bb1トキシンを発現し、特定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

【0198】

5. Monsanto Europe S. A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製IPC531綿、登録番号C／ES／96／02。

30

【0199】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue T edesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium製1507トウモロコシ、登録番号C／NL／00／10。特定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質Cry1Fの発現及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するためのPATタンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

【0200】

7. Monsanto Europe S. A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製NK603×MON810トウモロコシ、登録番号C／GB／02／M3／03。遺伝子操作品種NK603及びMON810を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603×MON810トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種（*Agrobacterium* sp.）の菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPSをトランスジェニック発現し、これにより、除草剤Roundup（登録商標）（グリホサートを含む）に対する耐性が付与され、またバチルスチューリンゲンシス（*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*）から得られるCry1Abトキシンをトランスジェニック発現し、これによりアワノメイガを含む特定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

40

【0201】

50

本明細書で用いられる場合、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、又は栽培されている植物の種子が播種された圃場、又は種子が土壤に蒔かれることになる圃場を意味する。これは、土壤、種子及び実生並びに確立した植生を含む。

【0202】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉及び果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0203】

「植物繁殖材料」という用語は、その増殖に用いられ得る種子などの植物の生殖部及び挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば、種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壤から出芽した後に移植されることになる発芽した植物及び若芽も挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護され得る。好ましくは、「植物繁殖材料」は、種子を表すと理解される。

10

【0204】

慣用名を用いて本明細書で言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 19th Ed., British Crop Protection Council 2021から公知である。

【0205】

実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、そのままの形態において又は好ましくは配合技術分野で簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のために、これらは、公知の様式で乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能若しくは希釈可能な溶液又は懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物及び例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティング又は掛け流しなどの適用方法は、意図される目的及びその時点での状況に応じて選択される。組成物は、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダ又は粘着剤及び肥料、微量元素の供給源又は特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤も含有し得る。

20

【0206】

例えば、農業に用いられる好適なキャリア及び／又は補助剤は、固体又は液体であり得、配合技術で有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば、国際公開第97/33890号に記載されている。

30

【0207】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は、沈降防止剤及び分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤並びに消泡剤及び結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用では、これらの濃縮物は、水中で希釈され、通常、処理される領域にスプレーで適用される。有効成分の量は、濃縮物の0.5%～95%の範囲内であり得る。

【0208】

水和剤は、水又は他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された有効成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカ及び他の易湿性の有機若しくは無機固形分が挙げられる。水和剤は、通常、5%～95%の有効成分と、少量の湿潤剤、分散剤又は乳化剤とを含有する。

40

【0209】

乳化性濃縮物は、水又は他の液体中に分散性である均質な液体組成物であり、活性な化合物及び液体若しくは固体乳化剤からのみ構成され得るか、又はキシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロン及び他の不揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有し得る。使用では、これらの濃縮物は、水又は他の液体中に分散され、通常、処理される領域にスプレーで適用される。有効成分の量は、濃縮物の0.5%～95%の範囲内であり得る。

50

【0210】

粒状配合物は、押出物及び比較的粗大な粒子の両方を含み、通常、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、バーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウム及び他の有機若しくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は、通常、5%～25%の有効成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシン及び他の石油留分などの表面活性剤若しくは植物油；並びに／又はデキストリン、膠若しくは合成樹脂などの展着剤を含み得る。

10

【0211】

粉剤は、有効成分と、分散剤及びキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末並びに他の有機及び無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0212】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された有効成分の小滴又は顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に加えて溶剤を含み得る。カプセル化された顆粒は、一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部内に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押出し成形、凝塊若しくはプリルによって形成されるか又は天然のものである。このような材料の例は、バーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくず及び粒状炭素である。シェル又はメンブラン材料は、天然及び合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン及びデンブンザンデートを含む。

20

30

【0213】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレン及び他の有機溶剤など、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における有効成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って有効成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機も用いられ得る。

【0214】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤及び／又はキャリアは、当業者に周知である。

【0215】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、αピネン、d-リモネン、エチレング

40

50

リコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、*m*-キシレン、*n*-ヘキサン、*n*-オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、*o*-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール（PEG400）、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、*p*-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン及び*N*-メチル-2-ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

10

20

30

40

50

【0216】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉及びリグニンが挙げられる。

【0217】

幅広い範囲の表面活性剤は、特に適用前にキャリアで希釈されるように設計されたものなど、前記液体及び固体組成物の両方で有利に利用される。これらの表面活性剤は、通常、使用される際、0.1%~15重量%の配合物を含む。これらは、アニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子特性であり得、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として又は他の目的のために利用され得る。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリールスルホネート塩；ノニルフェノール-C₁₈エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C₁₆エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ（2-エチルヘキシル）スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノ及びジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

【0218】

農業用組成物で通常利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡剤、金属イオン封鎖剤、中和剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤及び固着剤が挙げられる。

【0219】

加えて、さらに、他の殺生物性有効成分又は組成物を本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法で使用し、且つ本発明の組成物と同時に又は順次適用し得る。同時に適用する場合、これらのさらなる有効成分は、本発明の組成物と一緒に配合され得るか、又は例えば噴霧タンク中で一緒に混合され得る。これらのさらなる殺生物性有効成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、植物成長調節剤及び／又は生物学的製剤であり得る。

【0220】

式Iの化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略記は、「表1．1～1．36で定義される化合物から選択される1つの化合物」又は「表Aで定義される化合物から選択される1つの化合物」を意味する）：

石油（代替名）（628）+TX；アバメクチン+TX、アセキノシル+TX、アセタミ
 プリド+TX、アセトプロール+TX、アクリナトリン+TX、アシノナピル+TX、ア
 フィドピロペン+TX、アフォキサネル+TX、アラニカルブ+TX、アレトリン+T
 X、 α -シペルメトリン+TX、アルファメトリン+TX、アミドフルメト+TX、アミ
 ノカルブ+TX、アゾシクロチン+TX、ベンスルタップ+TX、ベンゾキシメート+T
 X、ベンズピリモキササン+TX、ベータシフルトリン+TX、 β -シペルメトリン+TX
 、ピフェナゼート+TX、ピフェントリン+TX、ビナパクリル+TX、ビオアレトリン
 +TX、S-ビオアレトリン+TX、ビオレスメトリン+TX、ピストリフルロン+TX
 、プロフラニリド+TX、プロフルトリネート+TX、プロモホス-エチル+TX、ブ
 ロフェジン+TX、ブトカルボキシム+TX、カズサホス+TX、カルバリル+TX、カ
 ルボスルファン+TX、カルタップ+TX、CAS番号1632218-00-8+TX
 、CAS番号1808115-49-2+TX、CAS番号2032403-97-5+
 TX、CAS番号2044701-44-0+TX、CAS番号2128706-05-
 6+TX、CAS番号2095470-94-1+TX、CAS番号2377084-0
 9-6+TX、CAS番号1445683-71-5+TX、CAS番号2408220
 -94-8+TX、CAS番号2408220-91-5+TX、CAS番号13650
 70-72-9+TX、CAS番号2171099-09-3+TX、CAS番号239
 6747-83-2+TX、CAS番号2133042-31-4+TX、CAS番号2
 133042-44-9+TX、CAS番号1445684-82-1+TX、CAS番
 号1445684-82-1+TX、CAS番号1922957-45-6+TX、CA
 S番号1922957-46-7+TX、CAS番号1922957-47-8+TX、
 CAS番号1922957-48-9+TX、CAS番号2415706-16-8+T
 X、CAS番号1594624-87-9+TX、CAS番号1594637-65-6
 +TX、CAS番号1594626-19-3+TX、CAS番号1990457-52
 -7+TX、CAS番号1990457-55-0+TX、CAS番号1990457-
 57-2+TX、CAS番号1990457-77-6+TX、CAS番号199045
 7-66-3+TX、CAS番号1990457-85-6+TX、CAS番号2220
 132-55-6+TX、CAS番号1255091-74-7+TX、CAS番号RN
 A（コロラドハムシ（*Leptinotarsa decemlineata*）特異的組
 換え2本鎖干渉GS2）+TX、CAS番号2719848-60-7+TX、CAS番
 号1956329-03-5+TX、クロラントラニリプロール+TX、クロルダン+TX
 、クロルフェナビル+TX、クロロプラレトリン+TX、クロマフェノジド+TX、ク
 レンピリン+TX、クロエトカルブ+TX、クロチアニジン+TX、2-クロロフェニル
 N-メチルカルバメート（CPMC）+TX、シアノフェンホス+TX、シアントラニリ
 プロール+TX、シクロニリプロール+TX、シクロブトリフルラム+TX、シクロプロ
 トリン+TX、シクロキサプリド+TX、シエノピラフェン+TX、シエトピラフェン（
 又はエトピラフェン）+TX、シフルメトフェン+TX、シフルトリン+TX、シハロジ
 アミド+TX、シハロトリン+TX、シペルメトリン+TX、シフェノトリン+TX、シ
 プロフラニリド+TX、シロマジン+TX、デルタメトリン+TX、ジアフェンチウロン
 +TX、ジアリホス+TX、ジプロム+TX、ジクロロメゾチアズ+TX、ジフロビダジ
 ン+TX、ジフルベンズロン+TX、ジムプロピリダズ+TX、ダイナクチン+TX、ジ
 ノカップ+TX、ジノテフラン+TX、ジオキサベンゾホス+TX、エマメクチン（又は
 エマメクチン安息香酸塩）+TX、エンペントリン+TX、 ϵ -モンフルオロトリン+TX
 X、 ϵ -メトフルトリン+TX、エスフェンバレレート+TX、エチオン+TX、エチプ
 ロール+TX、エトフェンプロックス+TX、エトキサゾール+TX、ファンファー+TX
 X、フェナザキン+TX、フェンフルトリン+TX、フェンメゾジチアズ+TX、フェニ

10

20

30

40

50

トロチオン+TX、フェノブカルブ+TX、フェノチオカルブ+TX、フェノキシカルブ
 +TX、フェンプロパトリン+TX、フェンピロキシメート+TX、フェンスルホチオン
 +TX、フェンチオン+TX、フェンチンアセテート+TX、フェンバレレート+TX、
 フィプロニル+TX、フロメトキン+TX、フロニカミド+TX、フルアクリピリム+T
 X、フルアザインドリジン+TX、フルアズロン+TX、フルベンジアミド+TX、フル
 ベンジミン+TX、フルクロジニリプロール+TX、フルシトリネート+TX、フルシク
 ロクスロン+TX、フルシトリネート+TX、フルエンスルホン+TX、フルフェネリム
 +TX、フルフェンブロックス+TX、フルフィプロール+TX、フルヘキサフォン+T
 X、フルメトリン+TX、フルオピラム+TX、フルペンチオフェノックス+TX、フル
 ピラジフロン+TX、フルピリミン+TX、フルラナー+TX、フルバリネート+TX
 、フルキサメタミド+TX、ホスチアゼート+TX、γ-シハロトリン+TX、グアジピ
 ル+TX、ハロフェノジド+TX、ハルフェンブロックス+TX、ヘプタフルトリン+T
 X、ヘキシチアゾクス+TX、ヒドラメチルノン+TX、イミシアホス+TX、イミダク
 ロブリド+TX、イミプロトリン+TX、インダザピロキサメット+TX、インドキサカ
 ルブ+TX、ヨードメタン+TX、イブロジオン+TX、イソシクロセラム+TX、イソ
 チオエート+TX、イベルメクチン+TX、κ-ビフェントリン+TX、κ-テフルトリ
 ン+TX、λ-シハロトリン+TX、レピメクチン+TX、ロチラナー+TX、ルフェヌ
 ロン+TX、メタフルミゾン+TX、メタアルデヒド+TX、メタム+TX、メトミル+
 TX、メトキシフェノジド+TX、メトフルトリン+TX、メトルカルブ+TX、メキサ
 カルベート+TX、ミルベメクチン+TX、モンフルオロトリン+TX、ニクロサミド+
 TX、ニコフルプロール+TX；ニテンピラム+TX、ニチアジン+TX、オメトエート
 +TX、オキサミル+TX、オキサゾスルフィル+TX、パラチオン-エチル+TX、ペ
 ルメトリン+TX、フェノトリン+TX、ホスホカルブ+TX、ピペロニルブトキシド+
 TX、ピリミカルブ+TX、ピリミホス-エチル+TX、ピリミホス-メチル+TX、多
 角体病ウイルス+TX、プラレトリン+TX、プロフェノホス+TX、プロフルトリン+
 TX、プロパルギット+TX、プロペタンホス+TX、プロボクスル+TX、プロチオホ
 ス+TX、プロトリフェンブト+TX、ピフルブミド+TX、ピメトロジン+TX、ピラ
 クロホス+TX、ピラフルプロール+TX、ピリダベン+TX、ピリダリル+TX、ピリ
 フルキナゾン+TX、ピリミジフェン+TX、ピリミノストロピン+TX、ピリプロール
 +TX、ピリプロキシフェン+TX、レスメトリン+TX、サロラネル+TX、セラメク
 チン+TX、シラフルオフエン+TX、スピネトラム+TX、スピノサド+TX、スピロ
 ブジフェン+TX；スピロジクロフェン+TX、スピロメシフェン+TX、スピロピジオ
 ン+TX、スピロテトラマト+TX、スピドキサマト+TX、スルホキサフロル+TX、
 テブフェノジド+TX、テブフェンピラド+TX、テブピリミホス+TX、テフルトリ
 ン+TX、テメホス+TX、テトラクロラントラニリプロール+TX、テトラジフォン+T
 X、テトラメトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX、テトラナクチン+TX、テ
 トラニリプロール+TX、θ-シペルメトリン+TX、チアクロブリド+TX、チアメト
 キサム+TX、チオシクラム+TX、チオジカルブ+TX、チオフアノックス+TX、チ
 オメトン+TX、チオスルタップ+TX、チゴラネル+TX、チオラントラニリプロール
 +TX；チオキサザフェン+TX、トルフェンピラド+TX、トキサフェン+TX、トラ
 ロメトリン+TX、トランスフルトリン+TX、トリアザメート+TX、トリアゾホス+
 TX、トリクロルホン+TX、トリクロロネート+TX、トリクロルホン+TX、トリフ
 ルエンフロネート+TX、トリフルメゾピリム+TX、チクロピラゾフロル+TX、ζ-
 シペルメトリン+TX、海藻抽出物及びメラッセ由来発酵産物+TX、海藻抽出物及び尿
 素含有メラッセ由来発酵産物+TX、アミノ酸+TX、カリウム及びモリブデン及びED
 TA-キレートマンガン+TX、海藻抽出物及び植物発酵生成物+TX、海藻抽出物及び
 植物ホルモン含有植物発酵生成物+TX、ビタミン+TX、EDTAキレート銅+TX、
 亜鉛+TX、鉄+TX、アザジラクチン+TX、バチルスアイザワイ (*Bacillus*
aizawai) +TX、バチルスキチノスポラス (*Bacillus chitinospo*
rus) AQ746 (NRRL受託番号B-21618)+TX、バチルスフィル

10

20

30

40

50

ムス (*Bacillus firmus*) + TX、バチルスクルスタキ (*Bacillus kurstaki*) + TX、バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) AQ726 (NRRL 受託番号 B-21664) + TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) (NRRL 受託番号 B-30087) + TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) AQ717 (NRRL 受託番号 B-21662) + TX、バチルス属の種 (*Bacillus sp.*) AQ178 (ATCC 受託番号 53522) + TX、バチルス属の種 (*Bacillus sp.*) AQ175 (ATCC 受託番号 55608) + TX、バチルス属の種 (*Bacillus sp.*) AQ177 (ATCC 受託番号 55609) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 未特定 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ153 (ATCC 受託番号 55614) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ30002 (NRRL 受託番号 B-50421) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ30004 (NRRL 受託番号 B-50455) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ713 (NRRL 受託番号 B-21661) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ743 (NRRL 受託番号 B-21665) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) AQ52 (NRRL 受託番号 B-21619) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BD#32 (NRRL 受託番号 B-21530) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 亜種クルスタキ (*kurstaki*) BMP123 + TX、ボーベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) + TX、D-リモネン + TX、顆粒病ウイルス (*Granulovirus*) + TX、ハーピン + TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多面体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多面体ウイルス + TX、ヘリオチスヴィレセンス (*Heliothis virescens*) 核多面体ウイルス + TX、ヘリオチスパンクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多面体ウイルス + TX、メタリジウム属の種 (*Metarhizium spp.*) + TX、ムスコドルアルバス (*Muscodora albus*) 620 (NRRL 受託番号 30547) + TX、ムスコドルロセウス (*Muscodora roseus*) A3-5 (NRRL 受託番号 30548) + TX、ニームの木に基づく製品 + TX、パエシロミセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、パエシロミセスリラシナス (*Paecilomyces lilacinus*) + TX、パストリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、パストリアペネトランス (*Pasteuria penetrans*) + TX、パストリアラモサ (*Pasteuria ramosa*) + TX、パストリアトルネイ (*Pasteuria thornei*) + TX、パストリアウスガエ (*Pasteuria usgae*) + TX、P-シメン + TX、プルテラキシロステラ (*Plutella xylostella*) 顆粒症ウイルス + TX、プルテラキシロステラ (*Plutella xylostella*) ヌクレオ多角体ウイルス + TX、多角体病ウイルス + TX、ピレトラム + TX、QRD420 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD452 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD460 (テルペノイドブレンド) + TX、キラヤサボナリア (*Quillaja saponaria*) + TX、ロドコッカスグロベルラス (*Rhodococcus globerulus*) AQ719 (NRRL 受託番号 B-21663) + TX、スポドプテラフルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多面体ウイルス + TX、ストレプトマイセスガルバス (*Streptomyces galbus*) (NRRL 受託番号 30232) + TX、ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces sp.*) (NRRL 受託番号 B-30145) + TX、テルペノイドブレンド + TX 及びバーティシリウム属の種 (*Verticillium spp.*) + TX からなる物質群から選択される補助剤；

10

20

30

40

50

ベトキサジン [CCN] + TX、ニオクタノン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、硫酸銅 (172) + TX、シブトリン [CCN] + TX、ジクロン (1052) + TX、ジクロロフェン (232) + TX、エンドタール (295) + TX、フェンチン (347) + TX、消石灰 [CCN] + TX、ナーバム (566) + TX、キノクラミン (714) + TX、キノンアミド (1379) + TX、シマジン (730) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX から構成される物質群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) + TX、クルホメート (1011) + TX、シクロブトリフルラム + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ピペラジン [CCN] + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) 及びチオファネート (1435) + TX から構成される物質群から選択される駆虫薬、

クロラロース (127) + TX、エンドリン (1122) + TX、フェンチオン (346) + TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC名) (23) 及びストリキニン (745) + TX から構成される物質群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン (IUPAC名) (1222) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン (446) + TX、プロノポール (97) + TX、ニオクタノン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC名) (169) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピリチオン (1105) + TX、ドジチン (1112) + TX、フェナミノスルフ (1144) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン (代替名) [CCN] + TX、カスガマイシン (483) + TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物 (483) + TX、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC名) (1308) + TX、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキシリン酸 (606) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム (446) + TX、プロベナゾール (658) + TX、ストレプトマイシン (744) + TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート (744) + TX、テクロフタラム (766) + TX 及びチオメルサル (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV (代替名) (12) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (代替名) (13) + TX、アムブリセイウス属の一種 (*Amblyseius spp.*) (代替名) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anagrapa falcifera*) NPV (代替名) (28) + TX、アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オートグラファカリホルニカ (*Autographa californica* NPV) (代替名) (38) + TX、バシラスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、バシラススファエリクス (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringi*

10

20

30

40

50

ensis subsp. japonensis) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. kurstaki) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. tenebrionis) (学名) (51) + TX、ベアウベリアバッシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabdus bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopi*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*amestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer* NPV) 及び N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイナーネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマカルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマリオブラエb (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマリオブラビス (*Steinernema riobravis*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマスカプテリス (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマ属の一種 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX から構成される物質群から選択される生物剤、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX から構成される物質群から選択される土壌不毛剤、アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代

10

20

30

40

50

替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘムパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される不妊化剤、

(E) -デカ-5-エン-1-イルアセテートを伴う (E) -デカ-5-エン-1-オール (IUPAC名) (222) + TX、(E) -トリデカ-4-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (829) + TX、(E) -6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) -テトラデカ-4, 10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) -ドデカ-7-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エナル (IUPAC名) (436) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) -ヘキサデカ-13-エン-11-イン-1-イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) -イコス-13-エン-10-オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) -テトラデカ-7-エン-1-アル (IUPAC名) (782) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-オール (IUPAC名) (783) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (784) + TX、(7E, 9Z) -ドデカ-7, 9-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (283) + TX、(9Z, 11E) -テトラデカ-9, 11-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) -テトラデカ-9, 12-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14-メチルオクタデカ-1-エン (IUPAC名) (545) + TX、4-メチルノナン-5-オールを伴う 4-メチルノナン-5-オン (IUPAC名) (544) + TX、 α -ムルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルレ (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ジスパールア (277) + TX、ドデカ-8-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ-9-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (287) + TX、ドデカ-8 + TX、10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4-メチルオクタノエート (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、Gossypure (登録商標) (代替名; ヘキサデカ-7, 11-ジエン-1-イルアセテートの (Z, E) 及び (Z, Z) 異性体の 1:1 混合物) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジェノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャポニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ-2, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ-3, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₁ (代替名) (839) + TX、トリメド

10

20

30

40

50

ルアB₂（代替名）（839）+TX、トリメドルアC（代替名）（839）及びトラン
クコール（代替名）[CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫フェロモ
ン；

2-（オクチルチオ）-エタノール（IUPAC名）（591）+TX、ブトピロノキシ
ル（933）+TX、ブトキシ（ポリプロピレングリコール）（936）+TX、ジブチ
ルアジペート（IUPAC名）（1046）+TX、フタル酸ジブチル（1047）+T
X、ジブチルコハク酸塩（IUPAC名）（1048）+TX、ジエチルトルアミド [C
CN]+TX、ジメチルカルベート [CCN]+TX、ジメチルフタレート [CCN]+
TX、エチルヘキサジオール（1137）+TX、ヘキサミド [CCN]+TX、メト
キンブチル（1276）+TX、メチルネオデカンアミド [CCN]+TX、オキサメー
ト [CCN] 及びピカリジン [CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫
忌避剤；

ビス（トリブチルスズ）オキシド（IUPAC名）（913）+TX、ブromoアセタミド
[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム [CCN]+TX、クロエトカルブ（999）+TX
、アセト亜ヒ酸銅 [CCN]+TX、硫酸銅（172）+TX、フェンチン（347）+
TX、第二鉄リン酸（IUPAC名）（352）+TX、メタアルデヒド（518）+T
X、メチオカルブ（530）+TX、ニクロスアミド（576）+TX、ニクロスアミド
オラミン（576）+TX、ペンタクロロフェノール（623）+TX、ペンタクロロフ
ェノキシドナトリウム塩（623）+TX、チオナジン（1412）+TX、チオジカル
ブ（799）+TX、酸化トリブチルスズ（913）+TX、トリフェンモルフ（145
4）+TX、トリメタカルブ（840）+TX、酢酸トリフェニルスズ（IUPAC名）
（347）及び水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）+TX、ピリプロー
ル [394730-71-3]+TXから構成される物質群から選択される殺軟体動物剤
、

AKD-3088（化合物コード）+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン（I
UPAC/Chemical Abstracts名）（1045）+TX、1,2-ジ
クロロプロパン（IUPAC/Chemical Abstracts名）（1062）
+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン（IUPAC名）（
1063）+TX、1,3-ジクロロプロペン（233）+TX、3,4-ジクロロテト
ラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド（IUPAC/Chemical Abstracts名）（1065）+TX、3-（4-クロロフェニル）-5-メチルロダニン（I
UPAC名）（980）+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナ
ン-3-イル酢酸（IUPAC名）（1286）+TX、6-イソペンテニルアミノプリ
ン（代替名）（210）+TX、アバメクチン（1）+TX、アセトプロール [CCN]
+TX、アラニカルブ（15）+TX、アルジカルブ（16）+TX、アルドキシカルブ
（863）+TX、AZ60541（化合物コード）+TX、ベンクロチアズ [CCN]
+TX、ベノミル（62）+TX、ブチルピリダベン（代替名）+TX、カズサホス（1
09）+TX、カルボフラン（118）+TX、二硫化炭素（945）+TX、カルボス
ルファン（119）+TX、クロルピクリン（141）+TX、クロルピリホス（145
）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、シクロブトリフルラム+TX、サイトカイ
ニン（代替名）（210）+TX、ダゾメット（216）+TX、DBCP（1045）
+TX、DCIP（218）+TX、ジアミダホス（1044）+TX、ジクロロフェン
チオン（1051）+TX、ジクリホス（代替名）+TX、ジメトエート（262）+T
X、ドラメクチン（代替名）[CCN]+TX、エマメクチン（291）+TX、エマメ
クチン安息香酸塩（291）+TX、エピリノメクチン（代替名）[CCN]+TX、エ
トプロホス（312）+TX、エチレンジブロミド（316）+TX、フェナミホス（3
26）+TX、フェンピラド（代替名）+TX、フェンスルホチオン（1158）+TX
、ホスチアゼート（408）+TX、ホスチエタン（1196）+TX、ルフラール（代
替名）[CCN]+TX、GY-81（開発コード）（423）+TX、ヘテロホス [C
CN]+TX、ヨードメタン（IUPAC名）（542）+TX、イサミドホス（123

10

20

30

40

50

0) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、カイネチン (代替名) (210) + TX、メカルホン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタムカリウム (代替名) (519) + TX、メタムナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフエン (IUPAC/Chemical Abstracts 名) (1422) + TX、チアフェノクス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノルス [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX、フルオピラム + TX から構成される物質群から選択される殺線虫剤、
 エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX から構成される物質群から選択される硝化抑制剤；
 アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX から構成される物質群から選択される植物活性化剤；
 2-イソバレリルインダン-1, 3-ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748) + TX、 α -クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アンツ (880) + TX、三酸化ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、ブロジファクム (89) + TX、ブロマジオロン (α -ブロマジオロンを含む) + TX、ブロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロル (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナクム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセタミド (379) + TX、フルプロバジン (1183) + TX、フルプロバジンヒドロクロリド (1183) + TX、 γ -HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC 名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、ホスアセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC 名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、ストリキニン (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) 及び亜鉛ホスフィド (640) + TX から構成される物質群から選択される殺鼠剤、
 2-(2-ブトキシエトキシ)-エチルピペロニレート (IUPAC 名) (934) + TX、5-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン (IUPAC 名) (903) + TX、ファルネソールを伴うネロリドール (代替名) (324) + TX、MB-599 (開発コード) (498) + TX、MGK264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタール (1343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (72

4) + TX、セサメックス (1393) + TX、セサスモリン (1394) 及びスルホキシド (1406) + TX から構成される物質群から選択される共力剤；

アントラキノン (32) + TX、クロラコース (127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] + TX、オキシ塩化銅 (171) + TX、ダイアジノン (227) + TX、ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) + TX、グアザチン (422) + TX、グアザチン酢酸塩 (422) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC 名) (23) + TX、チラム (804) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] 及びジラム (856) + TX から構成される物質群から選択される動物忌避剤；

イマニン (代替名) [CCN] 及びリバビリン (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される抗ウイルス剤；

酸化水銀 (II) (512) + TX、オクチリノン (590) 及びチオファネートメチル (802) + TX から構成される物質群から選択される創傷保護剤；

1, 1-ビス (4-クロロフェニル) -2-エトキシエタノール + TX、2, 4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート + TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセトアミド + TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン + TX、アセトプロール + TX、アルドキシカルブ + TX、アミジチオン + TX、アミドチオエート + TX、アミトン + TX、シュウ酸水素アミトン + TX、アミトラズ + TX、アラマイト + TX、三酸化ヒ素 + TX、アゾベンゼン + TX、アゾトエート + TX、ベノミル + TX、ベノキサホス + TX、安息香酸ベンジル + TX、ビキサフェン + TX、プロフェンバレレート + TX、ブ
 20
 プロモシクレン + TX、プロモホス + TX、プロモプロピレート + TX、ブプロフェジン + TX、ブトカルボキシム + TX、ブトキシカルボキシム + TX、ブチルピリダベン + TX、多硫化カルシウム + TX、カンフェクロル + TX、カルバノレート + TX、カルボフェノチオン + TX、シミアゾール + TX、キノメチオナート + TX、クロルベンシド + TX、クロルジメホルム + TX、クロルジメホルム塩酸塩 + TX、クロルフェネトール + TX、クロルフェンソン + TX、クロロフェンスルフィド + TX、クロロベンジレート + TX、クロロメブホルム + TX、クロロメチウロン + TX、クロロプロピレート + TX、クロルチオホス + TX、シネリン I + TX、シネリン II + TX、シネリン S + TX、クロサンテル + TX、クマホス + TX、クロタミトン + TX、クロトキシホス + TX、クフラネブ + TX、シアントエート + TX、DCPM + TX、DDT + TX、デメフィオン + TX
 30
 、デメフィオン-O + TX、デメフィオン-S + TX、デメトン-メチル + TX、デメトン-O + TX、デメトン-O-メチル + TX、デメトン-S + TX、デメトン-S-メチル + TX、デメトン-S-メチルスルホン + TX、ジクロフルアニド + TX、ジクロルボス + TX、ジクリホス + TX、ジエノクロル + TX、ジメホクス + TX、ジネクス + TX、ジネクス-ジクレキシム + TX、ジノカップ-4 + TX、ジノカップ-6 + TX、ジノクトン + TX、ジノペントン + TX、ジノスルホン + TX、ジノテルボン + TX、ジオキサチオン + TX、ジフェニルスルホン + TX、ジスルフィラム + TX、DNOC + TX、ドフェナピン + TX、ドラメクチン + TX、エンドチオン + TX、エプリノメクチン + TX、エトエートメチル + TX、エトリムホス + TX、フェナザフロル + TX、フェンブタチンオキシド + TX、フェノチオカルブ + TX、フェンピラド + TX、フェンピロキシメ
 40
 ート + TX、フェンピラザミン + TX、フェンソン + TX、フェントリファニル + TX、フルベンジミン + TX、フルシクロクスロン + TX、フルエネチル + TX、フルオルベンシド + TX、FMC 1137 + TX、ホルメタネート + TX、ホルメタネート塩酸塩 + TX、ホルムパラネート + TX、 γ -HCH + TX、グリオジン + TX、ハルフェンプロクス + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート + TX、イソカルボホス + TX、ジャスモリン I + TX、ジャスモリン II + TX、ジョドフェンホス + TX、リンダン + TX、マロノベン + TX、メカルバム + TX、メホスフォラン + TX、メスルフェン + TX、メタクリホス + TX、臭化メチル + TX、メトルカルブ + TX、メキサカルベート + TX、ミルベマイシンオキシム + TX、ミパホクス + TX、モノクロトホス + TX、モルホチオン + TX、モキシデクチン + TX、ナレド + TX、4-クロロ-2-(2-クロ

10

20

30

40

50

ロー２－メチル－プロピル）－５－〔（６－ヨード－３－ピリジル）メトキシ〕ピリダジ
 ン－３－オン＋TX、ニフルリジド＋TX、ニッコマイシン＋TX、ニトリラカルブ＋T
 X、ニトリラカルブ１：１塩化亜鉛錯体＋TX、オメトエート＋TX、オキシデプロホス
 ＋TX、オキシジスルホトン＋TX、pp'－DDT＋TX、パラチオン＋TX、ペルメ
 トリン＋TX、フェンカプトン＋TX、ホサロン＋TX、ホスホラン＋TX、ホスファミ
 ドン＋TX、ポリクロロテルペン＋TX、ポリナクチン＋TX、プロクロノール＋TX、
 プロマシル＋TX、プロボクスル＋TX、プロチダチオン＋TX、プロトエート＋TX、
 ピレトリンⅠ＋TX、ピレトリンⅠⅠ＋TX、ピレトリン＋TX、ピリダフェンチオン＋
 TX、ピリミテート＋TX、キナルホス＋TX、キンチオホス＋TX、R－１４９２＋T
 X、ホスグリシン＋TX、ロテノン＋TX、シュラダン＋TX、セブホス＋TX、セラメ
 クチン＋TX、ソファミド＋TX、SSI－１２１＋TX、スルフィラム＋TX、スルフ
 ラミド＋TX、スルホテップ＋TX、硫黄＋TX、ジフロビダジン＋TX、τ－フルバリ
 ネート＋TX、TEPP＋TX、テルバム＋TX、テトラジホン＋TX、テトラスル＋T
 X、チアフエノクス＋TX、チオカルボキシム＋TX、チオフアノックス＋TX、チオメ
 トン＋TX、チオキノックス＋TX、ツリングエンシン＋TX、トリアミホス＋TX、ト
 リアラテン＋TX、トリアゾホス＋TX、トリアズロン＋TX、トリフェノホス＋TX、
 トリナクチン＋TX、バミドチオン＋TX、バニリプロール＋TX、ベトキサジン＋TX
 、ジオクタナ酸銅＋TX、硫酸銅＋TX、シブトリン＋TX、ジクロン＋TX、ジクロロ
 フェン＋TX、エンドタール＋TX、フェンチン＋TX、消石灰＋TX、ナバム＋TX、
 キノクラミン＋TX、キノンアミド＋TX、シマジン＋TX、酢酸トリフェニルスズ＋T
 X、水酸化トリフェニルスズ＋TX、クルホメート＋TX、ピペラジン＋TX、チオフア
 ネート＋TX、クロラロース＋TX、フェンチオン＋TX、ピリジン－４－アミン＋TX
 、ストリキニン＋TX、１－ヒドロキシ－１H－ピリジン－２－チオン＋TX、４－（キ
 ノキサリン－２－イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド＋TX、８－硫酸ヒドロキシキノ
 リン＋TX、プロノポール＋TX、水酸化銅＋TX、クレゾール＋TX、ジピリチオン＋
 TX、ドジチン＋TX、フェナミノスルフ＋TX、ホルムアルデヒド＋TX、ヒドラルガ
 フェン＋TX、カスガマイシン＋TX、カスガマイシン塩酸塩水和物＋TX、ニッケルピ
 ス（ジメチルジチオカルバメート）＋TX、ニトラピリン＋TX、オクチリノン＋TX、
 オキシリン酸＋TX、オキシテトラサイクリン＋TX、ヒドロキシキノリン硫酸カリウム
 ＋TX、プロベナゾール＋TX、ストレプトマイシン＋TX、ストレプトマイシンセスキ
 スルフェート＋TX、テクロフタラム＋TX、チオメルサール＋TX、リンゴコカクモン
 ハマキ（*Adoxophyes orana*）GV＋TX、アグロバクテリウムラジオバ
 クター（*Agrobacterium radiobacter*）＋TX、アムブリセイ
 ウス属の種（*Amblyseius spp.*）＋TX、アナグラファファルシフェラ（*Ana*
grapha falcifera）NPV＋TX、アングルスアトムス（*Ana*
grus atomus）＋TX、アブラコバチ（*Aphelinus abdomin*
alis）＋TX、コレマンアブラバチ（*Aphidius colemani*）＋TX
 、ショクガタマバエ（*Aphidoletes aphidimyza*）＋TX、オート
 グラファカリホルニカ（*Autographa californica*）NPV＋TX
 、バチルススファエリクスネイデ（*Bacillus sphaericus Neid*
e）＋TX、ボーベリアブロングニアルチイ（*Beauveria brongniar*
tii）＋TX、ヤマトクサカゲロウ（*Chrysoperla carnea*）＋TX
 、ツマアカオオヒメテントウ（*Cryptolaemus montrouzieri*）
 ＋TX、コドリング（*Cydia pomonella*）GV＋TX、ハモグリコマユバ
 チ（*Dacnusa sibirica*）＋TX、イサエアヒメコバチ（*Diglyph*
us isaea）＋TX、オンシツツヤコバチ（*Encarsia formosa*）
 ＋TX、サバクツヤコバチ（*Eretmocerus eremicus*）＋TX、ヘテ
 ロルハブジチスバクテリオホラ（*Heterorhabditis bacteriop*
hora）及びH．メギジス（*H. megidis*）＋TX、ヒポダミアコンベルゲンス
 （*Hippodamia convergens*）＋TX、フジコナヒゲナガトビコバチ

10

20

30

40

50

(*Leptomastix dactylopi*) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) + TX、メタリジウムアニソプリエ変種アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) + TX、メタリジウムアニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンテイ (*N. lecontei*) NPV + TX、オリウス属の種 (*Orius* spp.) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) + TX、ステイネルネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) + TX、ステイネルネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) + TX、ステイネルネマリオブラビス (*Steinernema riobravise*) + TX、ステイネルネマスカプテリス (*Steinernema scapterisci*) + TX、ステイネルネマ属の種 (*Steinernema* spp.) + TX、トリコグラマ属の種 (*Trichogramma* spp.) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) + TX、ベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) + TX、アホレート + TX、ピサジル + TX、ブスルファン + TX、ジマチフ + TX、ヘメル + TX、ヘムパ + TX、メテパ + TX、メチオテパ + TX、メチルアホレート + TX、モルジド + TX、ペンフルロン + TX、テパ + TX、チオヘムパ + TX、チオテパ + TX、トレタミン + TX、ウレデパ + TX、(E) - デク - 5 - エン - 1 - イルアセテートと (E) - デク - 5 - エン - 1 - オール + TX、(E) - トリデク - 4 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(E) - 6 - メチルヘプト - 2 - エン - 4 - オール + TX、(E, Z) - テトラデク - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ドデク - 7 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデク - 11 - エナル + TX、(Z) - ヘキサデク - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデク - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン + TX、(Z) - テトラデク - 7 - エン - 1 - アール + TX、(Z) - テトラデク - 9 - エン - 1 - オール + TX、(Z) - テトラデク - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、14 - メチルオクタデク - 1 - エン + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールと 4 - メチルノナン - 5 - オン + TX、 α - ムルチストリアチン + TX、ブレビコミン + TX、コドレルレ + TX、コドレモン + TX、クエルレ + TX、ディスパーリュア + TX、ドデク - 8 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデク - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、ドミニカルア + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート + TX、オイゲノール + TX、フロンタリン + TX、グランドルア + TX、グランドルア I + TX、グランドルア II + TX、グランドルア III + TX、グランドルア IV + TX、ヘキサルア + TX、イブスジエノール + TX、イブセノール + TX、ジャポニルア + TX、リネアチン + TX、リトルア + TX、ルーブルア + TX、メドルア + TX、メガトモ酸 + TX、メチルオイゲノール + TX、ムスカルア + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オルフルアルア + TX、オリクタールア + TX、オストラモン + TX、シグルア + TX、ソルジジン + TX、スルカトール + TX、テトラデク - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、トリメドルア + TX、トリメドルア A + TX、トリメドルア B₁ + TX、

10

20

30

40

50

トリメドルアB₂+TX、トリメドルアC+TX、トランクーコール+TX、2-（オク
 チルチオ）エタノール+TX、ブトピロノキシル+TX、ブトキシ（ポリプロピレングリ
 コール）+TX、ジブチルアジペート+TX、ジブチルフタレート+TX、ジブチルスク
 シネート+TX、ジエチルトルアミド+TX、ジメチルカルベート+TX、ジメチルフタ
 レート+TX、エチルヘキサジオール+TX、ヘキサミド+TX、メトキン-ブチル+
 TX、メチルネオデカンアミド+TX、オキサメート+TX、ピカリジン+TX、1-ジ
 クロロ-1-ニトロエタン+TX、1, 1-ジクロロ-2, 2-ビス（4-エチルフェニ
 ル）エタン+TX、1, 2-ジクロロプロパンと1, 3-ジクロロプロペン+TX、1-
 ブロモ-2-クロロエタン+TX、2, 2, 2-トリクロロ-1-（3, 4-ジクロロフ
 ェニル）エチルアセテート+TX、2, 2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチ
 ルメチルホスフェート+TX、2-（1, 3-ジチオラン-2-イル）フェニルジメチル
 カルバメート+TX、2-（2-ブトキシエトキシ）エチルチオシアネート+TX、2-
 （4, 5-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル）フェニルメチルカルバメート+
 TX、2-（4-クロロ-3, 5-キシリルオキシ）エタノール+TX、2-クロロビニ
 ルジエチルホスフェート+TX、2-イミダゾリドン+TX、2-イソバレリルインダン
 -1, 3-ジオン+TX、2-メチル（プロプ-2-イニル）アミノフェニルメチルカル
 バメート+TX、2-チオシアナトエチルラウレート+TX、3-ブロモ-1-クロロプ
 ロプ-1-エン+TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバ
 メート+TX、4-メチル（プロプ-2-イニル）アミノ-3, 5-キシリルメチルカル
 バメート+TX、5, 5-ジメチル-3-オキソシクロヘクス-1-エニルジメチルカル
 バメート+TX、アセチオン+TX、アクリロニトリル+TX、アルドリン+TX、アロ
 サミジン+TX、アリキシカルブ+TX、α-エクジソン+TX、リン化アルミニウム+
 TX、アミノカルブ+TX、アナバシン+TX、アチダチオン+TX、アザメチホス+T
 X、バチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）δ
 エンドトキシン+TX、バリウムヘキサフルオロシリケート+TX、バリウムポリスルフ
 イド+TX、バルトリン+TX、バイエル22/190+TX、バイエル22408+T
 X、β-シフルトリン+TX、β-シベルメトリン+TX、ビオエタノメトリン+TX、
 ビオペルメトリン+TX、ビス（2-クロロエチル）エーテル+TX、ホウ砂+TX、ブ
 ロムフェンビンホス+TX、ブロモ-DDT+TX、ブフェンカルブ+TX、ブタカルブ
 +TX、ブタチオホス+TX、ブトネート+TX、ヒ酸カルシウム+TX、シアン化カル
 シウム+TX、二硫化炭素+TX、四塩化炭素+TX、カルタップ塩酸塩+TX、セバジ
 ン+TX、クロルビシクレン+TX、クロルダン+TX、クロルデコン+TX、クロロホ
 ルム+TX、クロルピクリン+TX、クロルホキシム+TX、クロルプラゾホス+TX、
 シス-レスメスリン+TX、シスメトリン+TX、クロシトリン+TX、アセト亜ヒ酸銅
 +TX、ヒ酸銅+TX、オレイン酸銅+TX、クミトエート+TX、氷晶石+TX、CS
 708+TX、シアノフェンホス+TX、シアノホス+TX、シクレトリン+TX、シチ
 オエート+TX、d-テトラメトリン+TX、DAEP+TX、ダゾメット+TX、デカ
 ルボフラン+TX、ジアミダホス+TX、ジカプトン+TX、ジクロロフェンチオン+T
 X、ジクレシル+TX、ジシクラニル+TX、ディルドリン+TX、ジエチル5-メチル
 ピラゾール-3-イルホスフェート+TX、ジロール+TX、ジメフルトリン+TX、ジ
 メタン+TX、ジメトリン+TX、ジメチルビンホス+TX、ジメチラン+TX、ジノブ
 ロップ+TX、ジノサム+TX、ジノセブ+TX、ジオフェノラン+TX、ジオキサベン
 ゾホス+TX、ジチクロホス+TX、DSP+TX、エクジステロン+TX、EI164
 2+TX、EMPc+TX、EPBP+TX、エタホス+TX、エチオフエンカルブ+T
 X、ギ酸エチル+TX、エチレンジブロミド+TX、エチレンジクロリド+TX、エチレ
 ンオキシド+TX、EXD+TX、フェンクロルホス+TX、フェネタカルブ+TX、フ
 ェニトロチオン+TX、フェノキサクリム+TX、フェンピリトリン+TX、フェンスル
 ホチオン+TX、フェンチオン-エチル+TX、フルコフロン+TX、ホスメチラン+T
 X、ホスピレート+TX、ホスチエタン+TX、フラチオカルブ+TX、フレトリン+T
 X、グアザチン+TX、グアザチンアセテート+TX、ナトリウムテトラチオカーボネー

10

20

30

40

50

ト+TX、ハルフェンブロックス+TX、HCH+TX、HEOD+TX、ヘプタクロル
 +TX、ヘテロホス+TX、HHDN+TX、シアン化水素+TX、ヒキンカルブ+TX
 、IPSP+TX、イサゾホス+TX、イソベンザン+TX、イソドリン+TX、イソフ
 ェンホス+TX、イソラン+TX、イソプロチオラン+TX、イソキサチオン+TX、幼
 虫ホルモンI+TX、幼虫ホルモンII+TX、幼虫ホルモンIII+TX、ケレバン+
 TX、キノブレン+TX、砒酸鉛+TX、レプトホス+TX、リリムホス+TX、リチダ
 チオン+TX、m-クメニルメチルカルバメート+TX、リン化マグネシウム+TX、マ
 ジドクス+TX、メカルホン+TX、メナゾン+TX、塩化第一水銀+TX、メスルフェ
 ンホス+TX、メタム+TX、メタム-カリウム+TX、メタム-ナトリウム+TX、メ
 タンスルホニルフルオリド+TX、メトクロトホス+TX、メトブレン+TX、メトトリ
 ン+TX、メトキシクロル+TX、メチルイソチオシアネート+TX、メチルククロホル
 ム+TX、塩化メチレン+TX、メトキサジアゾン+TX、ミレックス+TX、ナフタロ
 ホス+TX、ナフタレン+TX、NC-170+TX、ニコチン+TX、ニコチンスルフ
 ェート+TX、ニチアジン+TX、ノルニコチン+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨード
 フェニルO-エチルエチルホスホノチオエート+TX、O, O-ジエチルO-4-メチル
 -2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオネート+TX、O, O-ジエチル
 O-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオネート+TX、O, O
 , O', O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート+TX、オレイン酸+TX、パラ
 ジクロロベンゼン+TX、パラチオン-メチル+TX、ペンタクロロフェノール+TX、
 ペンタクロロフェニルラウレート+TX、PH 60-38+TX、フェンカプトン+TX
 X、ホスニクロル+TX、ホスフィン+TX、ホキシム-メチル+TX、ピリメタホス+
 TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体+TX、亜ヒ酸カリウム+TX、カリウム
 チオシアネート+TX、プレコセンI+TX、プレコセンII+TX、プレコセンIII
 +TX、ピリミドホス+TX、プロフルトリン+TX、プロメカルブ+TX、プロチオホ
 ス+TX、ピラゾホス+TX、ピレスメトリン+TX、カッシア+TX、キナルホス-メ
 チル+TX、キノチオン+TX、ラホキサニド+TX、レスメトリン+TX、ロテノン+
 TX、カデトリン+TX、リアニア+TX、リアノジン+TX、サバジラ+TX、シュラ
 ダン+TX、セブホス+TX、SI-0009+TX、チアプロニル+TX、亜ヒ酸ナト
 リウム+TX、シアン化ナトリウム+TX、フッ化ナトリウム+TX、ヘキサフルオロケ
 イ酸ナトリウム+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド+TX、セレン酸ナトリウ
 ム+TX、チオシアン酸ナトリウム+TX、スルコフロン+TX、スルコフロン-ナトリ
 ユム+TX、スルフリルフルオリド+TX、スルプロホス+TX、タール油+TX、タジ
 ムカルブ+TX、TDE+TX、テブピリムホス+TX、テメホス+TX、テラレトリン
 +TX、テトラクロロエタン+TX、チクロホス+TX、チオシクラム+TX、チオシク
 ラムシュウ酸塩+TX、チオナジン+TX、チオスルタップ+TX、チオスルタップ-ナ
 トリウム+TX、トラロメトリン+TX、トランスベルメトリン+TX、トリアザメート
 +TX、トリクロルメタホス-3+TX、トリクロロナト+TX、トリメタカルブ+TX
 、トルプロカルブ+TX、トリクロピリカルブ+TX、トリブレン+TX、ベラトリジン
 +TX、ベラトリン+TX、XMC+TX、ゼータメトリン+TX、亜鉛ホスフィド+TX
 X、ゾラプロホス+TX、メベルフルトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX、
 ビス(トリブチルスズ)オキシド+TX、プロモアセタミド+TX、リン酸第二鉄+TX
 、ニクロサミド-オラミン+TX、酸化トリブチルスズ+TX、ピリモルフ+TX、トリ
 フェンモルフ+TX、1, 2-ジプロモ-3-クロロプロパン+TX、1, 3-ジクロロ
 プロペン+TX、3, 4-ジクロロテトラヒドロチオフエン1, 1-ジオキシド+TX、
 3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン+TX、5-メチル-6-チオキソ
 -1, 3, 5-チアジアジナン-3-イル酢酸+TX、6-イソペンテニルアミノプリン
 +TX、アニシフルプリン+TX、ベンクロチアズ+TX、サイトカイニン+TX、DC
 EP+TX、フルフラール+TX、イサミドホス+TX、カイネチン+TX、ミロテシウ
 ムベルカリア(Myrothecium verrucaria)組成物+TX、テトラ
 クロロチオフエン+TX、キシレノルス+TX、ゼアチン+TX、エチルキサントゲン酸

10

20

30

40

50

カリウム+TX、アシベンゾラル+TX、アシベンゾラル-S-メチル+TX、オオイタ
 ドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物+TX、 α -クロロ
 ヒドリン+TX、アンツ+TX、炭酸バリウム+TX、ビスチオセミ+TX、プロディフ
 アコウム+TX、プロマジオロン+TX、プロメタリン+TX、クロロファシノン+TX
 、コレカルシフェロール+TX、クマクロル+TX、クマフリル+TX、クマテトラリル
 +TX、クリミジン+TX、ジフェナコウム+TX、ジフェチアロン+TX、ジファシノ
 ン+TX、エルゴカルシフェロール+TX、フロクマフェン+TX、フルオロアセタミド
 +TX、フルプロバジン+TX、フルプロバジン塩酸塩+TX、ノルボルミド+TX、ホ
 スアセチム+TX、リン+TX、ピンドン+TX、ピリヌロン+TX、シリロシド+TX
 、フルオロ酢酸ナトリウム+TX、硫酸タリウム+TX、ワルファリン+TX、2-(2
 -ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール
 -5-イル)-3-ヘキシルシクロヘクス-2-エノン+TX、ファルネソールとネロリ
 ドール+TX、ベルブチン+TX、MGK 264+TX、ピペロニルブトキシド+TX
 、ピプロタル+TX、プロピル異性体+TX、S421+TX、セサメックス+TX、
 セサスモリン+TX、スルホキシド+TX、アントラキノン+TX、ナフテン酸銅+TX
 、オキシ塩化銅+TX、ジシクロペンタジエン+TX、チラム+TX、ナフテン酸亜鉛+
 TX、ジラム+TX、イマニン+TX、リバビリン+TX、クロロインコナジド+TX、
 酸化水銀(II)+TX、チオファネート-メチル+TX、アザコナゾール+TX、ビテ
 ルタノール+TX、ブロムコナゾール+TX、シプロコナゾール+TX、ジフェノコナゾ
 ール+TX、ジニコナゾール+TX、エポキシコナゾール+TX、フェンブコナゾール+
 TX、フルキンコナゾール+TX、フルシラゾール+TX、フルトリアホール+TX、フ
 ラメトビル+TX、ヘキサコナゾール+TX、イマザリル+TX、イミベンコナゾール+
 TX、イブコナゾール+TX、メトコナゾール+TX、ミクロブタニル+TX、パクロブ
 トラゾール+TX、ペフラゾエート+TX、ペンコナゾール+TX、プロチオコナゾール
 +TX、ピリフェノックス+TX、プロクロラズ+TX、プロピコナゾール+TX、ピリ
 ソキサゾール+TX、シメコナゾール+TX、テブコナゾール+TX、テトラコナゾール
 +TX、トリアジメホン+TX、トリアジメノール+TX、トリフルミゾール+TX、ト
 リチコナゾール+TX、アンシミドール+TX、フェナリモール+TX、ヌアリモール+
 TX、ブピリメート+TX、ジメチリモール+TX、エチリモール+TX、ドデモルフ+
 TX、フェンブロピジン+TX、フェンブロピモルフ+TX、スピロキサミン+TX、ト
 リデモルフ+TX、シブロジニル+TX、メパニピリム+TX、ピリメタニル+TX、フ
 ェンピクロニル+TX、フルジオキシソニル+TX、ベナラキシル+TX、フララキシル+
 TX、メタラキシル+TX、R-メタラキシル+TX、オフレース+TX、オキサジキシ
 ル+TX、カルベンダジム+TX、デバカルブ+TX、フベリダゾール+TX、チアベン
 ダゾール+TX、クロゾリネート+TX、ジクロゾリン+TX、ミクロゾリン+TX、プ
 ロシミドン+TX、ピンクロゾリン+TX、ボスカリド+TX、カルボキシン+TX、フ
 ェンフラム+TX、フルトラニル+TX、メプロニル+TX、オキシカルボキシン+TX
 、ペンチオピラド+TX、チフルザミド+TX、ドジン+TX、イミノクタジン+TX、
 アゾキシストロビン+TX、ジモキシストロビン+TX、エネストロブリン+TX、フェ
 ナミンストロビン+TX、フルフェノキシストロビン+TX、フルオキサストロビン+TX
 、クレソキシム-メチル+TX、メトミノストロビン+TX、トリフロキシストロビン
 +TX、オリザストロビン+TX、ピコキシストロビン+TX、ピラクロストロビン+TX
 、ピラメトストロビン+TX、ピラオキシストロビン+TX、フェルバム+TX、マン
 コゼブ+TX、マネブ+TX、メチラム+TX、プロピネブ+TX、ジネブ+TX、カブ
 タホール+TX、キャプタン+TX、フルオロイミド+TX、ホルベット+TX、トリル
 フルアニド+TX、ボルドー液+TX、酸化銅+TX、マンカップー+TX、オキシニー
 銅+TX、ニトロタルーイソプロピル+TX、エディフェンホス+TX、イプロベンホ
 ス+TX、ホスジフェン+TX、トルコホス-メチル+TX、アニラジン+TX、ベンチ
 アバリカルブ+TX、ブラストサイジン-S+TX、クロロネブ+TX、クロロタロニル
 +TX、シフルフェナミド+TX、シモキサニル+TX、シクロブトリフルラム+TX、

10

20

30

40

50

ジクロシメット+TX、ジクロメジン+TX、ジクロラン+TX、ジエトフェンカルブ+TX、ジメトモルフ+TX、フルモルフ+TX、ジチアノン+TX、エタボキサム+TX、エトリジアゾール+TX、ファモキサドン+TX、フェナミドン+TX、フェノキサニル+TX、フェリムゾン+TX、フルアジナム+TX、フルメチルスルホリム+TX、フルオピコリド+TX、フルオキシチオコナゾール+TX、フルスルファミド+TX、フルキサピロキサド+TX、フェンヘキサミド+TX、ホセチル-アルミニウム+TX、ヒメキサゾール+TX、イプロバリカルブ+TX、シアゾファミド+TX、メタスルホカルブ+TX、メトラフェノン+TX、ペンシクロン+TX、フタリド+TX、ポリオキシシン+TX、プロパモカルブ+TX、ピリベンカルブ+TX、プロキナジド+TX、ピロキロン+TX、ピリオフェノン+TX、キノキシフェン+TX、キントゼン+TX、チアジニル+TX、トリアゾキシド+TX、トリシクラゾール+TX、トリホリン+TX、バリダマイシン+TX、バリフェナレート+TX、ゾキサミド+TX、マンジプロパミド+TX、フルベネテラム+TX、イソピラザム+TX、セダキサン+TX、ベンゾビンジフルピル+TX、ピジフルメトフェン+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(3', 4', 5'-トリフルオロ-ビフェニル-2-イル)-アミド+TX、イソフルシブラム+TX、イソチアニル+TX、ジピメチトロン+TX、6-エチル-5, 7-ジオキソ-ピロロ[4, 5][1, 4]ジチノ[1, 2-c]イソチアゾール-3-カルボニトリル+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニル-ピリダジン-3-カルボニトリル+TX、(R)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル]ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、4-(2-ブromo-4-フルオロ-フェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニル)-2, 5-ジメチル-ピラゾール-3-アミン+TX、4-(2-ブromo-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+TX、フルインダピル+TX、クメトキシストロビン(ジアキシヤンジュンジ(j i a x i a n g j u n z h i))+TX、ルブベンミキシアナン(l v b e n m i x i a n a n)+TX、ジクロベンチアゾクス+TX、マンデストロビン+TX、3-(4, 4-ジフルオロ-3, 4-ジヒドロ-3, 3-ジメチルイソキノリン-1-イル)キノロン+TX、2-[2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]フェニル]プロパン-2-オール+TX、オキサチアピプロリン+TX、tert-ブチルN-[6-[[[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート+TX、ピラジフルミド+TX、インビルフルキサム+TX、トルプロカルブ+TX、メフェントリフルコナゾール+TX、イプフェントリフルコナゾール+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、N'-(2, 5-ジメチル-4-フェノキシーフェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[4-(4, 5-ジクロロチアゾール-2-イル)オキシ-2, 5-ジメチル-フェニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]チアゾール-4-イル]-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-5-イル]-3-クロロ-フェニル]メタンスルホネート+TX、ブト-3-イニルN-[6-[[[(Z)-[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート+TX、メチルN-[5-[4-(2, 4-ジメチルフェニル)トリアゾール-2-イル]-2-メチル-フェニル]メチル]カルバメート+TX、3-クロロ-6-メチル-5-フェニル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリダジン+TX、ピリダクロメチル+TX、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル]ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、1-[2-[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチ

ルーテトラゾール-5-オン+TX、1-メチル-4-[3-メチル-2-[2-メチル-4-(3, 4, 5-トリメチルピラゾール-1-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]テトラゾール-5-オン+TX、アミノピリフェン+TX、アメトクトラジン+TX、アミスプロム+TX、ペンフルフェン+TX、(Z, 2E)-5-[1-(4-クロロフェニル)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-ペント-3-エンアミド+TX、フロリルピコキサミド+TX、フェンピコキサミド+TX、メタリルピコキサミド+TX、テブフロキン+TX、イブフルフェノキン+TX、キノフメリン+TX、イソフェタミド+TX、エチル1-[4-[2-(トリフルオロメチル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル]メトキシ]フェニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート+TX (国際公開第2020/056090号に記載の方法で調製され得る)、エチル1-[4-[2-(トリフルオロメチル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル]メトキシ]フェニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート+TX (国際公開第2020/056090号に記載の方法で調製され得る)、メチルN-[4-[1-(4-シクロプロピル-2, 6-ジフルオロ-フェニル)ピラゾール-4-イル]-2-メチル-フェニル]メチル]カルバメート+TX (国際公開第2020/097012号に記載の方法で調製され得る)、メチルN-[4-[1-(2, 6-ジフルオロ-4-イソプロピル-フェニル)ピラゾール-4-イル]-2-メチル-フェニル]メチル]カルバメート+TX (国際公開第2020/097012号に記載の方法で調製され得る)、6-クロロ-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロ-フェノキシ)-N-[2-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロ-エチル]-5-メチル-ピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法で調製され得る)、6-クロロ-N-[2-(2-クロロ-4-メチル-フェニル)-2, 2-ジフルオロ-エチル]-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロ-フェノキシ)-5-メチル-ピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法で調製され得る)、6-クロロ-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロ-フェノキシ)-N-[2-(3, 4-ジメチルフェニル)-2, 2-ジフルオロ-エチル]-5-メチル-ピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法で調製され得る)、N-[2-[2, 4-ジクロロ-フェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、N-[2-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド+TX、ベンゾチオストロビン+TX、フェナマクリル+TX、5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール亜鉛塩(2:1)+TX、フルオピラム+TX、フルフェノキサジアザム+TX、フルチアニル+TX、フルオピモミド+TX、ピラプロポイン+TX、ピカルブトラゾクス+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3R)-1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、4-[6-[2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル+TX、メチルテトラプロール+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3R)-1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、 α -(1, 1-ジメチルエチル)- α -[4'-(トリフルオロメトキシ)[1, 1'-ビフェニル]-4-イル]-5-ピリジンメタノール+TX、フルオキサピプロリン+TX、エノキサストロビン+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-[4-(トリフルオロメチル)トリアゾール-2-イル]フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-(4-プロピルトリアゾール-2-イル)フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-2-[5-(3-イソプロピルピラゾール-1-イル)-2-メチル-フェノキシ]-3-メトキシプロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-(3-プロピルピラゾール

-1-イル) フェノキシ] プロブ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ
 -2-[2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] フェノ
 キシ] プロブ-2-エノエート+TX (これらの化合物は、国際公開第2020/079
 111号に記載の方法で調製され得る)、メチル(Z)-2-(5-シクロヘキシル-2
 -メチル-フェノキシ)-3-メトキシ-プロブ-2-エノエート+TX、メチル(Z)
 -2-(5-シクロペンチル-2-メチル-フェノキシ)-3-メトキシ-プロブ-2-
 エノエート+TX (これらの化合物は、国際公開第2020/193387号に記載の方
 法で調製され得る)、4-[6-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,1-ジ
 フルオロ-2-ヒドロキシ-3-(1,2,4-トリアゾール-1-イル) プロピル]-3-ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル+TX、4-[6-[2-(2,4-ジフルオ
 10
 ロフェニル)-1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(5-スルファニル-1,2
 ,4-トリアゾール-1-イル) プロピル]-3-ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル+
 TX、4-[6-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,1-ジフルオロ-2-
 ヒドロキシ-3-(5-チオキソ-4H-1,2,4-トリアゾール-1-イル) プロピル]
 -3-ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル+TX、トリネキサパック+TX、クモキ
 シストロピン+TX、チョンシェンマイシン(zhongshengmycin)+TX
 、チオジアゾール銅+TX、チアゾール亜鉛+TX、アメクトラクチン+TX、イプロ
 ジオン+TX、セボクチルアミン+TX; N'-[5-プロモ-2-メチル-6-[(1S)-1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ]-3-ピリジル]-N-エチル-N-メ
 20
 チル-ホルムアミジン+TX、N'-[5-プロモ-2-メチル-6-[(1R)-1-
 メチル-2-プロポキシ-エトキシ]-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホル
 ムアミジン+TX、N'-[5-プロモ-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ
 -エトキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N
 ' -[5-クロロ-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ)-3-
 ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[5-プロモ-2
 -メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ)-3-ピリジル]-N-イソ
 プロピル-N-メチル-ホルムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公開第2015
 /155075号に記載の方法で調製され得る); N'-[5-プロモ-2-メチル-6
 - (2-プロポキシプロポキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホルムア
 30
 ミジン+TX (この化合物は、IPC000249876Dに記載の方法により調製
 され得る); N-イソプロピル-N'-[5-メトキシ-2-メチル-4-(2,2,2
 -トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-フェニル-エチル) フェニル]-N-メチル-ホル
 ムアミジン+TX、N'-[4-(1-シクロプロピル-2,2,2-トリフルオロ-
 1-ヒドロキシ-エチル)-5-メトキシ-2-メチル-フェニル]-N-イソプロピル
 -N-メチル-ホルムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公開第2018/228
 896号に記載の方法で調製され得る); N-エチル-N'-[5-メトキシ-2-メチ
 ル-4-[(2-トリフルオロメチル) オキセタン-2-イル] フェニル]-N-メチル
 -ホルムアミジン+TX、N-エチル-N'-[5-メトキシ-2-メチル-4-[(2
 -トリフルオロメチル) テトラヒドロフラン-2-イル] フェニル]-N-メチル-ホル
 ムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公開第2019/110427号に記載の方
 法で調製され得る); N-[(1R)-1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブト-
 3-エニル]-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1S)-
 1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブト-3-エニル]-8-フルオロ-キノリン
 -3-カルボキサミド+TX、N-[(1R)-1-ベンジル-3,3,3-トリフルオ
 40
 ロ-1-メチル-プロピル]-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、
 N-[(1S)-1-ベンジル-3,3,3-トリフルオロ-1-メチル-プロピル]-
 8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1R)-1-ベンジル-
 1,3-ジメチル-ブチル]-7,8-ジフルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+T
 X、N-[(1S)-1-ベンジル-1,3-ジメチル-ブチル]-7,8-ジフルオロ
 -キノリン-3-カルボキサミド+TX、8-フルオロ-N-[(1R)-1-[(3-

10

20

30

40

50

フルオロフェニル) メチル] - 1, 3-ジメチル-ブチル] キノリン-3-カルボキサミド+TX、8-フルオロ-N-[(1S) -1-[(3-フルオロフェニル) メチル] -1, 3-ジメチル-ブチル] キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1R) -1-ベンジル-1, 3-ジメチル-ブチル] -8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1S) -1-ベンジル-1, 3-ジメチル-ブチル] -8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-((1R) -1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブト-3-エニル) -8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-((1S) -1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブト-3-エニル) -8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX (これらの化合物は、国際公開第2017/153380号に記載の方法で調製され得る) ; 1-(6, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) -4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、1-(6, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) -4, 4, 6-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-1-(6-メチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) イソキノリン+TX、4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-1-(7-メチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) イソキノリン+TX、1-(6-クロロ-7-メチル-ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) -4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX (これらの化合物は、国際公開第2017/025510号に記載の方法で調製され得る) ; 1-(4, 5-ジメチルベンズイミダゾール-1-イル) -4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、1-(4, 5-ジメチルベンズイミダゾール-1-イル) -4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、6-クロロ-4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-1-(4-メチルベンズイミダゾール-1-イル) イソキノリン+TX、4, 4-ジフルオロ-1-(5-フルオロ-4-メチル-ベンズイミダゾール-1-イル) -3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、3-(4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-1-イソキノリル) -7, 8-ジヒドロ-6H-シクロペンタ [e] ベンズイミダゾール+TX (これらの化合物は、国際公開第2016/156085号に記載の方法で調製され得る) ; N-メトキシ-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] シクロプロパンカルボキサミド+TX、N, 2-ジメトキシ-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] プロパンアミド+TX、N-エチル-2-メチル-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] プロパンアミド+TX、1-メトキシ-3-メチル-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] 尿素+TX、1, 3-ジメトキシ-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] 尿素+TX、3-エチル-1-メトキシ-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] 尿素+TX、N-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] プロパンアミド+TX、4, 4-ジメチル-2-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン-3-オン+TX、5, 5-ジメチル-2-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] イソキサゾリジン-3-オン+TX、エチル 1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] ピラゾール-4-カルボキシレート+TX、N, N-ジメチル-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) -1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] -1, 2, 4-トリアゾール-3-アミン+TX (この段落中の化合物は、国際公開第2017/055473号、国際公開第2017/055469号、国際公開第2017/093348号及び国際公開第2017/118689号に記載の方法により調製され得る) ; 2-[6-(4-クロロフェノキシ) -2-(トリフルオロメチル)

- 3 - ピリジル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - [6 - (4 - ブロモフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載の方法により調製され得る) ; 3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + TX (この化合物は、国際公開第 2016/156290 号に記載の方法により調製され得る) ; 3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + TX (この化合物は、国際公開第 2016/156290 号に記載の方法により調製され得る) ; (4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + TX (この化合物は、国際公開第 2014/006945 号に記載の方法により調製され得る) ; 2, 6 - ジメチル - 1 H, 5 H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c'] ジピロール - 1, 3, 5, 7 (2 H, 6 H) - テトロノ + TX (この化合物は、国際公開第 2011/138281 号に記載の方法により調製され得る) ; N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゼンカルボチオアミド + TX ; N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX ; (Z, 2 E) - 5 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) 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 - ペント - 3 - エンアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/153707 号に記載の方法により調製され得る) ; N' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX ; N' - [2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロフェノキシ) - 5 - メチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX (この化合物は、国際公開第 2016/202742 号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 3 - エチル - 1, 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (この化合物は、国際公開第 2014/095675 号に記載の方法により調製され得る) ; (5 - メチル - 2 - ピリジル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX、(3 - メチルイソキサゾール - 5 - イル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2017/220485 号に記載の方法により調製され得る) ; 2 - オキソ - N - プロピル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2018/065414 号に記載の方法により調製され得る) ; エチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + TX (この化合物は、国際公開第 2018/158365 号に記載の方法により調製され得る) ; 2, 2 - ジフルオロ - N - メチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + TX、N - [(E) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX、N - [(Z) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX、N - [N - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + TX (これらの化合物は、国際公開第 2018/202428 号に記載の方法により調製され得る) から選択される生物学的に有効な物質 ;

以下のものを含む微生物 : アシネトバクテールオフィイ (*Acinetobacter lwoffii*) + TX、アクレモニウムアルタナツム (*Acremonium alternatum*) + TX + TX、アクレモニウムセファロスポリウム (*Acremoni*

10

20

30

40

50

um cephalosporium) + TX + TX、アクレモニウムディオスピリ (Acremonium diospyri) + TX、アクレモニウムオブクラバタム (Acremonium obclavatum) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス (Adoxophyes orana granulovirus) (Adox GV) (Capex (登録商標)) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (Agrobacterium radiobacter) 菌株 K84 (Galltrol-A (登録商標)) + TX、アルテルナリアアルテルナーテ (Alternaria alternate) + TX、アルテルナリアカシヤ (Alternaria cassia) + TX、アルテルナリアデストルエンス (Alternaria destruens) (Smolder (登録商標)) + TX、アンペロマイセススキカリス (Ampelomyces quisqualis) (AQ10 (登録商標)) + TX、アスペルギルスフラバス (Aspergillus flavus) AF36 (AF36 (登録商標)) + TX、アスペルギルスフラバス (Aspergillus flavus) NRRL21882 (Aflaguard (登録商標)) + TX、アスペルギルス属の種 (Aspergillus spp.) + TX、アウレオバシジウムプルランス (Aureobasidium pullulans) + TX、アゾスピリルム (Azospirillum) + TX、(MicroAZ (登録商標)) + TX、TAZO B (登録商標)) + TX、アゾトバクター (Azotobacter) + TX、アゾトバクタークロオコッカム (Azotobacter chroococcum) (Azotomeal (登録商標)) + TX、アゾトバクターシスト (Azotobacter cyst) (Bionatural Blooming Blossoms (登録商標)) + TX、バチルスアミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) + TX、バチルスセレウス (Bacillus cereus) + TX、バチルスキチノスポラス (Bacillus chitinosporus) 菌株 CM-1 + TX、バチルスキチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株 AQ746 + TX、バチルスリケニフォルミス (Bacillus licheniformis) 菌株 HB-2 (Biostart (商標) Rhizoboost (登録商標)) + TX、バチルスリケニフォルミス (Bacillus licheniformis) 菌株 3086 (EcoGuard (登録商標)) + TX、Green Releaf (登録商標)) + TX、バチルスサーキュランス (Bacillus circulans) + TX、バチルスフィルムス (Bacillus firmus) (BioSafe (登録商標)) + TX、BioNem-WP (登録商標) + TX、VOTIVO (登録商標) + TX、バチルスフィルムス (Bacillus firmus) 菌株 I-1582 + TX、バチルスマセランス (Bacillus macerans) + TX、バチルスマリスマルトウイ (Bacillus marismortui) + TX、バチルスメガテリウム (Bacillus megaterium) + TX、バチルスマイコイデス (Bacillus mycoides) 菌株 AQ726 + TX、バチルスポピリエ (Bacillus papillae) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、バチルスプミルス属の種 (Bacillus pumilus spp.) + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 GB34 (Yield Shield (登録商標)) + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 AQ717 + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 QST2808 (Sonata (登録商標)) + TX、Ballad Plus (登録商標)) + TX、バチルスパヘリカス (Bacillus spahericus) (VectoLex (登録商標)) + TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) + TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株 AQ175 + TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株 AQ177 + TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株 AQ178 + TX、バチルスサブチリス (Bacillus subtilis) 菌株 QST713 (CEASE (登録商標)) + TX、Serenade (登録商標) + TX、Rhapsody (登録商標)) + TX、バチルスサブチリス (Bacillus subt

10

20

30

40

50

i l i s) 菌株 Q S T 7 1 4 (J A Z Z (登録商標)) + T X、バチルスサブチリス (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 A Q 1 5 3 + T X、バチルスサブチリス (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 A Q 7 4 3 + T X、バチルスサブチリス (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 3 0 0 2 + T X、バチルスサブチリス (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 3 0 0 4 + T X、バチルスサブチリス変種アミロリケファシエンス (B a c i l l u s s u b t i l i s v a r . a m y l o l i q u e f a c i e n s) 菌株 F Z B 2 4 (T a e g r o (登録商標)) + T X、R h i z o p r o (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) C r y 2 A e + T X、バチルスチューリングエンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) C r y 1 A b + T X、バチルスチューリングエンシスアイザワイ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s a i z a w a i) G C 9 1 (A g r e e (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシスイスラエレンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s i s r a e l e n s i s) (B M P 1 2 3 (登録商標)) + T X、A q u a b a c (登録商標)) + T X、V e c t o B a c (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシスクルスタキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) (J a v e l i n (登録商標)) + T X、D e l i v e r (登録商標)) + T X、C r y M a x (登録商標)) + T X、B o n i d e (登録商標)) + T X、S c u t e l l a W P (登録商標)) + T X、T u r i l a v W P (登録商標)) + T X、A s t u t o (登録商標)) + T X、D i p e l W P (登録商標)) + T X、B i o b i t (登録商標)) + T X、F o r a y (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシスクルスタキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) B M P 1 2 3 (B a r i t o n e (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシスクルスタキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) H D - 1 (B i o p r o t e c - C A F / 3 P (登録商標)) + T X、バチルスチューリングエンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 菌株 B D # 3 2 + T X、バチルスチューリングエンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 菌株 A Q 5 2 + T X、バチルスチューリングエンシス変種アイザワイ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s v a r . a i z a w a i) (X e n T a r i (登録商標)) + T X、D i P e l (登録商標)) + T X、細菌種 (b a c t e r i a s p p .) (G R O W M E N D (登録商標)) + T X、G R O W S W E E T (登録商標)) + T X、S h o o t u p (登録商標)) + T X、クラビバクターミシガネンシス (C l a v i p a c t e r m i c h i g a n e n s i s) のバクテリオファージ (A g r i P h a g e (登録商標)) + T X、B a k f l o r (登録商標)) + T X、白きよう病菌 (B e a u v e r i a b a s s i a n a) (B e a u g e n i c (登録商標)) + T X、B r o c a r i l W P (登録商標)) + T X、白きよう病菌 (B e a u v e r i a b a s s i a n a) G H A (M y c o t r o l E S (登録商標)) + T X、M y c o t r o l O (登録商標)) + T X、B o t a n i G u a r d (登録商標)) + T X、ボーベリアブロングニアルティ (B e a u v e r i a b r o n g n i a r t i i) (E n g e r l i n g s p i l z (登録商標)) + T X、S c h w e i z e r B e a u v e r i a (登録商標)) + T X、M e l o c o n t (登録商標)) + T X、ボーベリア属の種 (B e a u v e r i a s p p .) + T X、灰色かび病菌 (B o t r y t i s c i n e r i a) + T X、ブラディリゾビウムジャポニカム (B r a d y r h i z o b i u m j a p o n i c u m) (T e r r a M a x (登録商標)) + T X、ブレビバチルスブレビス (B r e v i b a c i l l u s b r e v i s) + T X、バチルスチューリングエンシステネブリオニス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s t e n e b r i o n i s) (N o v o d o r (登録商標)) + T X、B t B o o s t e r + T X、バークホルデリアセパシア (B u r k h o l d e r i a c e p a c i a) (D e n y (登録商標)) + T X、I n t e r c e p t (登録商標)) + T X、B l u e C i r c l e (登録商標)) + T X、バークホルデリアグラディ (B u r k h o l d e r i a g l a d i i) + T X、バークホルデリアグラディオリ (B u r k h o l d e r i a g l a d i o l i) + T X、バークホルデリア属の

10

20

30

40

50

種 (*Burkholderia* spp.) +TX、セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標)) +TX、カンジダブチリ (*Candida butyri*) +TX、カンジダファマタ (*Candida famata*) +TX、カンジダフルクタス (*Candida fructus*) +TX、カンジダグラブラタ (*Candida glabrata*) +TX、カンジダグイリエルモンディ (*Candida guilliermondii*) +TX、カンジダメリビオシカ (*Candida melibiosica*) +TX、カンジダオレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株 O+TX、カンジダパラプシロシス (*Candida parapsilosis*) +TX、カンジダペリキュローザ (*Candida pelliculosa*) +TX、カンジダプルケリマ (*Candida pulcherrima*) +TX、カンジダレウカウフィ (*Candida reukaufii*) +TX、カンジダサイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標)) +TX、Biocure (登録商標)) +TX、カンジダサケ (*Candida sake*) +TX、カンジダ属の種 (*Candida* spp.) +TX、カンジダテニウス (*Candida tenuis*) +TX、セデセアドラビスエ (*Cedecia dravisae*) +TX、セルロモナスフラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) +TX、カエトミウムコクリオイデス (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide (登録商標)) +TX、カエトミウムグロボサム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標)) +TX、クロモバクテリウムサブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株 PRAA4-1T (Grandevo (登録商標)) +TX、クラドスポリウムクラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) +TX、クラドスポリウムオキシスポラム (*Cladosporium oxysporum*) +TX、クラドスポリウムクロロセファラム (*Cladosporium chlorocephalum*) +TX、クラドスポリウム属の種 (*Cladosporium* spp.) +TX、クラドスポリウムテヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) +TX、クロノスタキスロゼア (*Clonostachys rosea*) (EndoFine (登録商標)) +TX、コレトトリクムアクタータム (*Colletotrichum acutatum*) +TX、コニオチリウムミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標)) +TX、コニオチリウム属の種 (*Coniothyrium* spp.) +TX、クリプトコッカスアルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標)) +TX、クリプトコッカスフミコラ (*Cryptococcus humicola*) +TX、クリプトコッカスインフィルモーミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatum*) +TX、クリプトコッカスラウレンティイ (*Cryptococcus laurentii*) +TX、クリプトフレビアロイコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標)) +TX、カプリアビダスカンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) +TX、コドリングア顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) +TX、コドリングア顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標)) +TX、Madex Plus (登録商標) +TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標)) +TX、エビコウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (Stumpout (登録商標)) +TX、シリンドロクラジウム (*Cylindroccladium*) +TX、デバリオマイセスハンセニイ (*Debaryomyces hansenii*) +TX、ドレクスレハワイエンシス (*Drechslera hawaiiensis*) +TX、エンテロバクタークロアカ (*Enterobacter cloacae*) +TX、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) +TX、エントモフトラビルレンタ (*Entomophth*

10

20

30

40

50

ora virulenta) (Vektor (登録商標)) +TX、エピコッカムニグ
 ラム (Epicoccum nigrum) +TX、エピコッカムブルプラセンス (Ep
 icoccum purpurascens) +TX、エピコッカム属の種 (Epico
 ccum spp.) +TX、フィロバシジウムフロリフォルメ (Filobasidi
 um floriforme) +TX、フザリウムアクミナタム (Fusarium a
 cuminatum) +TX、フザリウムクラミドスポラム (Fusarium chl
 amydosporum) +TX、フザリウムオキシスポラム (Fusarium ox
 ysporum) (Fusaclean (登録商標) / Biofox C (登録商標))
 +TX、フザリウムプロリフェラタム (Fusarium proliferatum)
 +TX、フザリウム属の種 (Fusarium spp.) +TX、ガラクトマイセスゲ
 オトリウム (Galactomyces geotrichum) +TX、グリオクラジ
 ウムカテナラタム (Gliocladium catenulatum) (Primas
 top (登録商標) +TX、Prestop (登録商標)) +TX、グリオクラジウムロ
 セウム (Gliocladium roseum) +TX、グリオクラジウム属の種 (G
 liocladium spp.) (SoilGard (登録商標)) +TX、グリオク
 ラジウムビレンス (Gliocladium virens) (Soilgard (登録
 商標)) +TX、顆粒病ウイルス (Granulovirus) (Granupom (登
 録商標)) +TX、ハロバチルスハロフィラス (Halobacillus halop
 hilus) +TX、ハロバチルスリトラリス (Halobacillus litor
 alis) +TX、ハロバチルストルウエペリ (Halobacillus truep
 eri) +TX、ハロモナス属の種 (Halomonas spp.) +TX、ハロモナ
 スサブグラシエスコラ (Halomonas subglaciescola) +TX、
 ハロビブリオバリアビリス (Halovibrio variabilis) +TX、ハ
 ンセンiaspora uvarum) +TX、オオタ
 バコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa armigera nucleo
 polyhedrovirus) (Helicovex (登録商標)) +TX、アメリカ
 タバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa zea nuclear po
 lyhedrosis virus) (Gemstar (登録商標)) +TX、イソフラ
 ボン-ホルモノネチン (Myconate (登録商標)) +TX、クロエケラアピキュラ
 タ (Kloeckera apiculata) +TX、クロエケラ属の種 (Kloec
 kera spp.) +TX、ラゲニジウムギガンテウム (Lagenidium gi
 ganteum) (Laginex (登録商標)) +TX、レカニシリウムロンギスポラ
 ム (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast (登
 録商標)) +TX、レカニシリウムムスカリウム (Lecanicillium mu
 scarium) (Vertikil (登録商標)) +TX、マイマイガ核多角体病ウイ
 ルス (Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis v
 irus) (Disparvirus (登録商標)) +TX、マリノコッカスハロフィル
 ス (Marinococcus halophilus) +TX、メイラゲウラコニギイ
 (Meira geulakonigii) +TX、メタリジウムアニソプリエ (Met
 arhizium anisopliae) (Met52 (登録商標)) +TX、メタリ
 ジウムアニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Destru
 xin WP (登録商標)) +TX、メチニコビアフルチコラ (Metschnikow
 ia fruticola) (Shemer (登録商標)) +TX、メチニコビアプルケ
 リマ (Metschnikowia pulcherrima) +TX、ミクロドチウム
 ジメラム (Microdochium dimerum) (Antibot (登録商標)
) +TX、ミクロモノスポラコエルレア (Micromonospora coerule
 a) +TX、ミクロスファエロプシスオクラセア (Microsphaeropsis
 ochracea) +TX、ムスコドルアルバス (Muscodor albus) 62
 0 (Muscudor (登録商標)) +TX、ムスコドルロセウス (Muscodor
 roseus) 菌株 A3-5 +TX、ミコリザエ属の種 (Mycorrhizae sp

10

20

30

40

50

p.) (AMykor (登録商標) + TX、Root Maximizer (登録商標) + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC-0255 (DiTera (登録商標) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマピリフェルム (*Ophiostoma piliiferum*) 菌株 D97 (Sylvanex (登録商標) + TX、パエシロマイセスファリノサス (*Paecilomyces farinosus*) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR-97 (登録商標) + TX、PreFeRal (登録商標) + TX、パエシロマイセスリラシナス (*Paecilomyces linacinus*) (Biostat WP (登録商標) + TX、パエシロマイセスリラシナス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標) + TX、パエニバチルスポリミキサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエアアグロメランス (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1 (登録商標) + TX、パントエア属の種 (*Pantoea* spp.) + TX、パストリア属の種 (*Pasteuria* spp.) (Econem (登録商標) + TX、パストリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウムオーランチオグリスウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウムビライ (*Penicillium billai*) (Jumpstart (登録商標) + TX、TagTeam (登録商標) + TX、ペニシリウムブレビコンパクトム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウムフレクエンタンス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウムグリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウムブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属の種 (*Penicillium* spp.) + TX、ペニシリウムビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオプシスギガンテアン (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標) + TX、リン酸塩溶解細菌 (*Phosphomeal* (登録商標) + TX、フィトフトラクリプトゲア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトフトラパルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標) + TX、ピキアアノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピキアグイレルモンディ (*Pichia guilhermondii*) + TX、ピキアメンブラナエファシエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピキアオニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピキアスティピテス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナスアウレオファシエンス (*Pseudomonas aureofaciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標) + TX、シュードモナスセパシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、シュードモナスクロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) (AtEze (登録商標) + TX、シュードモナスコルゲート (*Pseudomonas corrugate*) + TX、シュードモナスフルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標) + TX、シュードモナスプチダ (*Pseudomonas putida*) + TX、シュードモナスリアクタンス (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX、シュードモナスシリंगाエ (*Pseudomonas syringae*) (Bio-Save (登録商標) + TX、シュードモナスビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、シュードモナスフルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標) + TX、シュードジマフロクロサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標) + TX、プッシニアカナリクラタ (*Puccinia*

10

20

30

40

50

canaliculata) +TX、プッシニアトラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) +TX、ピシウムパロエカ
 ンドラム (*Pythium paroecandrum*) +TX、ピシウムオリガンドラ
 ム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) +
 TX、Polyversum (登録商標)) +TX、ピシウムペリプロカム (*Pythi
 um periplocum*) +TX、ラーネラアクアティリス (*Rhanelle a
 quatilis*) +TX、ラーネラ属の種 (*Rhanelle spp.*) +TX、
 リゾビア (*Rhizobia*) (Dormal (登録商標)) +TX、Vault (登録商
 標)) +TX、リゾクトニア (*Rhizoctonia*) +TX、ロドコッカスグロベル
 ラス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株AQ719 +TX、ロドス
 ポリジウムディオボバタム (*Rhodospiridium diobovatum*) +
 TX、ロドスポリジウムトルロイデス (*Rhodospiridium toruloi
 des*) +TX、ロドトルラ属の種 (*Rhodotorula spp.*) +TX、ロド
 トルラグルチニス (*Rhodotorula glutinis*) +TX、ロドトルラグ
 ラミニス (*Rhodotorula graminis*) +TX、ロドトルラムシラギノ
 ーサ (*Rhodotorula mucilagnosa*) +TX、ロドトルラルブラ (*Rhodo
 torula rubra*) +TX、サッカロマイセスセレビシエ (*Sacc
 haromyces cerevisiae*) +TX、サリノコッカスロセウス (*Sal
 inococcus roseus*) +TX、スクレロチニアミノル (*Scleroti
 nia minor*) +TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia min
 or*) (SARRITOR (登録商標)) +TX、スキタリジウム属の種 (*Scytal
 idium spp.*) +TX、スキタリジウムウレジニコラ (*Scytalidium
 uredinicola*) +TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodo
 ptera exigua nuclear polyhedrosis virus*)
 (Spod-X (登録商標)) +TX、Spexit (登録商標)) +TX、セラチアマル
 セッセン (*Serratia marcescens*) +TX、セラチアプリムチカ (*Serr
 atia plymuthica*) +TX、セラチア属の種 (*Serratia
 spp.*) +TX、ソルダリアフィミコラ (*Sordaria fimicola*) +T
 X、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis
 nucleopolyhedrovirus*) (Littovir (登録商標)) +TX
 、スポロボロマイセスロセウス (*Sporobolomyces roseus*) +TX
 、ステノトロホモナスマルトフィリア (*Stenotrophomonas malto
 philia*) +TX、ストレプトマイセスヒグロスコピカス (*Streptomyce
 s ahhygroscopicus*) +TX、ストレプトマイセスアルバドゥンカス (*S
 treptomyces albaduncus*) +TX、ストレプトマイセスエクسف
 オリエーテス (*Streptomyces exfoliates*) +TX、ストレプト
 マイセスガルバス (*Streptomyces galbus*) +TX、ストレプトマイ
 セスグリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*) +TX
 、ストレプトマイセスグリセオビリディス (*Streptomyces griseov
 iridis*) (Mycostop (登録商標)) +TX、ストレプトマイセスリディカ
 ス (*Streptomyces lydicus*) (Actinovate (登録商標)
) +TX、ストレプトマイセスリディカス (*Streptomyces lydicus
) WYEC-108 (ActinoGrow (登録商標)) +TX、ストレプトマイセス
 ビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) +TX、チレチオブシ
 スミノル (*Tilletiopsis minor*) +TX、チレチオブシス属の種 (*T
 illetiopsis spp.*) +TX、トリコデルマアスペレルム (*Tricho
 derma asperellum*) (T34 Biocontrol (登録商標)) +
 TX、トリコデルマガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (Tenet (登
 録商標)) +TX、トリコデルマアトリビリデ (*Trichoderma atrov
 iride*) (Plantmate (登録商標)) +TX、トリコデルマハマタム (*Tr**

10

20

30

40

50

ichoderma hamatum) TH382+TX、トリコデルマハルジアナムリ
 ファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) (Mycosta
 r (登録商標))+TX、トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma har
 zianum*) T-22 (*Trianium-P* (登録商標))+TX、PlantShield
 HC (登録商標)+TX、RootShield (登録商標)+TX、Trian
 um-G (登録商標))+TX、トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma
 harzianum*) T-39 (*Trichodex* (登録商標))+TX、トリコデル
 マインハマタム (*Trichoderma inhamatum*) +TX、トリコデルマ
 コニングイ (*Trichoderma koningii*) +TX、トリコデルマ属の種
 (*Trichoderma spp.*) LC52 (*Sentinel* (登録商標))+T 10
 X、トリコデルマリグノラム (*Trichoderma lignorum*) +TX、ト
 リコデルマロンギブラキアタム (*Trichoderma longibrachiat
 um*) +TX、トリコデルマポリスポラム (*Trichoderma polyspor
 um*) (Binab T (登録商標))+TX、トリコデルマタキシ (*Trichode
 rma taxi*) +TX、トリコデルマビレンス (*Trichoderma vire
 ns*) +TX、トリコデルマビレンス (*Trichoderma virens*) (旧グ
 リオクラジウムビレンス (*Gliocladium virens*) GL-21) (So
 ilGuard (登録商標))+TX、トリコデルマビリデ (*Trichoderma
 viride*) +TX、トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)
 菌株 ICC080 (*Remedier* (登録商標))+TX、トリコスポロンブルランス 20
 (*Trichosporon pullulans*) +TX、トリコスポロン属の種 (*T
 richosporon spp.*) +TX、トリコテシウム属の種 (*Trichoth
 ecium spp.*) +TX、トリコテシウムロセウム (*Trichothecium
 roseum*) +TX、ティフラファコリーザ (*Typhula phacorrhiz
 a*) 菌株 94670+TX、ティフラファコリーザ (*Typhula phacorrh
 iza*) 菌株 94671+TX、ウロクラジウムアトラム (*Ulocladium at
 rum*) +TX、ウロクラジウムオウデマンシイ (*Ulocladium oudema
 nsii*) (Botry-Zen (登録商標))+TX、ウスチラゴマイディス (*Ust
 ilago maydis*) +TX、様々な細菌及び補助微量栄養素 (Natural
 II (登録商標))+TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登 30
 録商標))+TX、バーチシリウムクラミドスポリウム (*Verticillium c
 hlamydosporium*) +TX、バーチシリウムレカニイ (*Verticill
 ium lecanii*) (Mycotal (登録商標))+TX、Vertalec (登
 録商標))+TX、Vip3Aa20 (VIPTera (登録商標))+TX、ビルジバ
 チルスマリスマルツイ (*Virgibacillus marismortui*) +T
 X、キサントモナスカムベストリス pv. ポアエ (*Xanthomonas campe
 stris pv. Poae*) (Camperico (登録商標))+TX、ゼノラブダ
 スボヴィエニイ (*Xenorhabdus bovienii*) +TX、ゼノラブダスネ
 マトフィラス (*Xenorhabdus nematophilus*);
 以下のものを含む植物抽出物: 松油 (*Retenol* (登録商標))+TX、アザジラク 40
 チン (*Plasma Neem Oil* (登録商標))+TX、AzaGuard (登録商
 標)+TX、MeemAzaL (登録商標)+TX、Molt-X (登録商標)+TX、
 植物性 IGR (*Neemazad* (登録商標))+TX、Neemix (登録商標))+T
 X、ナタネ油 (*Lilly Miller Vegol* (登録商標))+TX、アメリカ
 アリタソウ (*Chenopodium ambrosioides near ambr
 osioides*) (Requiem (登録商標))+TX、キク (*Chrysanth
 emum*) 抽出物 (*Crisant* (登録商標))+TX、ニーム油の抽出物 (*Tril
 ogy* (登録商標))+TX、シソ科植物 (*Labiatae*) の精油 (*Botania
 (登録商標)*))+TX、クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物 (*Ga
 rden insect killer* (登録商標))+TX、グリシンベタイン (*Gr 50*

eenstim (登録商標) +TX、ニンニク+TX、レモングラス油 (Green Match (登録商標) +TX、ニーム油+TX、イヌハッカ (Nepeta cataria) (キャットニップ油) +TX、イヌハッカ (Nepeta catarina) +TX、ニコチン+TX、オレガノ油 (MossBuster (登録商標) +TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標) +TX、ジョチュウギク+TX、シャボンノキ (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標) +TX、オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) (Regalia (登録商標) +TX、Sakalia (登録商標) +TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標) +TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標) +TX、大豆油 (Ortho ecosense (登録商標) +TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標) +TX、タイム油+TX、AGNIQUE (登録商標) MMF+TX、BugOil (登録商標) +TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF300 (登録商標) +TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF400 (登録商標) +TX、クローブペパーミントニンニク油及びミントの混合物 (Soil Shot (登録商標) +TX、カオリン (Screen (登録商標) +TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) ;

10

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロヒメハマキ (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標) +TX、コドリング (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus (登録商標) +TX、グレープベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標) +TX、ハマキガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標) +TX、ムスカモン (Snip7 Fly Bait (登録商標) +TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標) +TX、ナシヒメシンクイ (Oriental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標) +TX、スカシバガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate-P (登録商標) +TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標) +TX、エントスタット粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標) +TX、(E+TX、Z+TX、Z) -3 +TX、8+TX、11テトラデカトリエニルアセテート+TX、(Z+TX、Z+TX、E) -7+TX、11+TX、13-ヘキサデカトリエナール+TX、(E+TX、Z) -7+TX、9-ドデカジエン-1-イルアセテート+TX、2-メチル-1-ブタノール+TX、酢酸カルシウム+TX、Scenturion (登録商標) +TX、Bio lure (登録商標) +TX、Check-Mate (登録商標) +TX、セネシオン酸ラバンズリル ;

20

30

以下のものを含むマクロバイアル (Macrobials) : アフェリヌスアブドミナリス (Aphelinus abdominalis) +TX、アフィジウスエルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus-System (登録商標) +TX、アセロファガスパパイア (Acerophagus papaya) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia-System (登録商標) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標) +TX、アゲニアスピスシトリコラ (Ageniaspis citricola) +TX、アゲニアスピスフシコリス (Ageniaspis fuscicollis) +TX、アンブリセイウスアンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標) +TX、Ander

40

50

soni-System (登録商標)) + TX、アンブリセイウスカリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標) + TX、Spical (登録商標)) + TX、アンブリセイウスククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標) + TX、Bugline cucumeris (登録商標)) + TX、アンブリセイウスファラシス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標)) + TX、アンブリセイウスウィルスキイ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標) + TX、Swirskii-Mite (登録商標)) + TX、アンブリセイウスウォマースレイ (Amblyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標)) + TX、アミタスヘスペリダム (Amitus hesperidum) + TX、アナグラスアトマス (Anagrus atomus) + TX、アナギラスフスシベントリス (Anagyrus fusciventris) + TX、アナギラスカマリ (Anagyrus kamali) + TX、Anagyrus loeckii (アナギラスロエキ) + TX、アナギラスシュードコッキ (Anagyrus pseudococci) (Citripair (登録商標)) + TX、アニセタスベネフィセス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリスネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris-System (登録商標)) + TX、アフエリヌスアブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標) + TX、Aphiline (登録商標)) + TX、アフエリヌスアシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフジウスコレマニ (Aphidius colemani) (Aphipar (登録商標)) + TX、アフジウスエルビ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標)) + TX、アフジウスギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフジウスマトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Aphipar-M (登録商標)) + TX、アフイドレテスアフイディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) + TX、アフイドレテスアフイディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) + TX、アフイチスリングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフイチスメリナス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツスハゲノウイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタコリアリア (Atheta coriaria) (Staphyline (登録商標)) + TX、マルハナバチ属の種 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標) + TX、Tripol (登録商標)) + TX、セファロノミアステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、キロコラスニグリタス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysopa (登録商標)) + TX、クリソベルラルフィラブリス (Chrysoperla rufilabris) + TX、シロスビルスイングヌウス (Cirrospilus ingenuus) + TX、シロスビルスクアドリストリアタス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスチクスフィロクニストイデス (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロセルスカマエレオン (Closterocerus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属の種 (Closterocerus spp.) + TX、コシドキシノイデスベルミヌタス (Coccidoxenoides perminutus) (Planopar (登録商標)) + TX、コッコファガスコウペリ (Coccophagus cowperi) + TX、コッコファガスリシムニア (

10

20

30

40

50

Coccophagus lycimnia) +TX、キアシサムライコマユバチ (*Cotesia flavipes*) +TX、コナガサムライコマユバチ (*Cotesia plutellae*) +TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (*Cryptobug* (登録商標) +TX、*Cryptoline* (登録商標)) +TX、キムネタマキスイ (*Cybocephalus nipponicus*) +TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) +TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*Minusa* (登録商標)) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Dimine x* (登録商標)) +TX、デルファスタスカタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) +TX、デルファスタスプシルス (*Delphastus pusillus*) +TX、ジアカスミモルファクラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) +TX、ジアカスミモルファロンギカウダタ (*Diachasmimorpha longicaudata*) +TX、ジアパルスジユクンダ (*Diaparsis jucunda*) +TX、ジアホレンシルタスアリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標) +TX、*Digline* (登録商標)) +TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標) +TX、*Minex* (登録商標)) +TX、ディベルシネルプス属の種 (*Diversinervus* spp.) +TX、エンカルシアシトリナ (*Encarsia citrina*) +TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標) +TX、*Encarline* (登録商標) +TX、*En-Strip* (登録商標)) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) +TX、エンカルシアグアデロウパエ (*Encarsia guadeloupe*) +TX、エンカルシアハイチエンシス (*Encarsia haitiensis*) +TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) +TX、エルトモセリスシフォニニ (*Eretmoceris siphonini*) +TX、エルトモセルスカリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Ercal* (登録商標) +TX、*Eretline e* (登録商標)) +TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) +TX、エルトモセルスハヤチ (*Eretmocerus hayati*) +TX、エルトモセルスムンドス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標) +TX、*Eretline m* (登録商標)) +TX、エルトモセルスシフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) +TX、エキソコムスクアドリプスツラタス (*Exochomus quadripustulatus*) +TX、フェルチエラアカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Spidend* (登録商標)) +TX、フェルチエラアカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) +TX、フォピウスアリサナス (*Fopius arisanus*) +TX、フォピウスセラチチボラス (*Fopius ceratitivorius*) +TX、ホルモノネチン (*Wirless Beehome* (登録商標)) +TX、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*) (*Vespop* (登録商標)) +TX、ガレンドロムスオシデンタリス (*Galendromus occidentalis*) +TX、ゴニオズスレグネリ (*Goniozus legneri*) +TX、シマメイガコマユバチ (*Habrobracon hebetor*) +TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmoBeetle* (登録商標)) +TX、ヘテロラブディティス属の種 (*Heterorhabditis* spp.) (*Lawn Patrol* (登録商標)) +TX、ヘテロラブディティスバクテリオフォラ (*Heterorhabditis*

bacteriophora) (*NemaShield* HB (登録商標) +TX、*Nemaseek* (登録商標) +TX、*Terranem-Nam* (登録商標) +TX、*Terranem* (登録商標) +TX、*Larvanem* (登録商標) +TX、*B-Green* (登録商標) +TX、*NemAttack* (登録商標) +TX、*Nematop* (登録商標) +TX、ヘテロラブディティスメジディス (*Heterorhabditiis megidis*) (*Nemasys* H (登録商標) +TX、*BioNem* H (登録商標) +TX、*Exhibitline* hm (登録商標) +TX、*Larvanem-M* (登録商標) +TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) +TX、ヒポアスピスアクレイファー (*Hypoaspis aculeifer*) (*Aculeifer-System* (登録商標) +TX、*Entomite-A* (登録商標) +TX、ヒポアスピスミルス (*Hypoaspis miles*) (*Hypoline* m (登録商標) +TX、*Entomite-M* (登録商標) +TX、ルバリアロイコスポイデス (*Lbalia leucospoides*) +TX、レカノイデウスフロシムス (*Lecanoides floccissimus*) +TX、レモファガスエラブンドス (*Lemophagus errabundus*) +TX、レプトマスチデアアブノルミス (*Leptomastidea abnormis*) +TX、レプトマスチクスダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (*Leptopar* (登録商標) +TX、レプトマスチクスエポナ (*Leptomastix epona*) +TX、リンドラスロファンタエ (*Lindorus lophanthae*) +TX、リボレクシスオレグマエ (*Lipolexis oregmae*) +TX、ルシリアカエサル (*Lucilia caesar*) (*Natufly* (登録商標) +TX、リシフレバステスタセイペス (*Lysiphlebus testaceipes*) +TX、マクロロフスカリギノサス (*Macrolophus caliginosus*) (*Mirical-N* (登録商標) +TX、*Macroline* c (登録商標) +TX、*Mirical* (登録商標) +TX、メソセイウラスロンギペス (*Mesoseiulus longipes*) +TX、メタフィカスフラバス (*Metaphycus flavus*) +TX、メタフィカスロウンスブリイ (*Metaphycus lounsburyi*) +TX、ミクロマスアングラタス (*Micromus angulatus*) (*Milacewing* (登録商標) +TX、ミクロテリスフラバス (*Microterys flavus*) +TX、ムシディフラクスラボトレラス (*Muscidi furax raptorellus*) 及びスパランギアカメロニ (*Spalangia cameroni*) (*Biopar* (登録商標) +TX、ネオドリイナスチフロシバエ (*Neodryinus typhlocybae*) +TX、ミヤコカブリダニ (*Neoseiulus californicus*) +TX、ネオセイウラスククメリス (*Neoseiulus cucumeris*) (*THRYPEX* (登録商標) +TX、ネオセイウラスファラシス (*Neoseiulus fallacis*) +TX、ネシディオコリステムイス (*Nesideocoris tenuis*) (*NesidioBug* (登録商標) +TX、*Nesibug* (登録商標) +TX、オフィラアエネセンス (*Ophyra aenescens*) (*Biofly* (登録商標) +TX、シノビハナカメムシ (*Orius insidiosus*) (*Thripor-I* (登録商標) +TX、*Oriline* i (登録商標) +TX、エルヒメハナカメムシ (*Orius laevigatus*) (*Thripor-L* (登録商標) +TX、*Oriline* l (登録商標) +TX、オリウスマジユスクラス (*Orius majusculus*) (*Oriline* m (登録商標) +TX、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (*Thripor-S* (登録商標) +TX、パウエシアジュネペロラム (*Pauesia juniperorum*) +TX、ペディオビウスホベオラタス (*Pediobius foveolatus*) +TX、ファスマルハブディティスヘルマフロディタ (*Phasmarhabditiis hermaphrodita*) (*Nemaslug* (登録商標) +TX、フィマスティカスコフェア (*Phymastichus coffea*) +TX、フィトセイウラスマクロピルス (*Phytoseiul*

10

20

30

40

50

us macropilus) +TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Spidex (登録商標) +TX、Phytoline p (登録商標)) +TX、ポディサスマクリベントリス (Podisus maculiventris) (Podisus (登録商標)) +TX、シューダクテオンカルバタス (Pseudacteon curvatus) +TX、シューダクテオンオブツサス (Pseudacteon obtusus) +TX、シューダクテオントリクスピス (Pseudacteon tricuspis) +TX、シューダフィカスマクリペンニス (Pseudaphycus maculipennis) +TX、シュードレプトマスティクスメキシカーナ (Pseudleptomastix mexicana) +TX、サイラエファガスピロサス (Psyllaephagus pilosus) +TX、サイタ
 リアコンコロール (Psytalia concolor) (複合体) +TX、クアドラ
 スティカス属の種 (Quadrastichus spp.) +TX、リゾビウスロファ
 ンタエ (Rhyzobius lophanthae) +TX、ベダリアテントウ (Rodolia cardinalis) +TX、オオクビキレガイ (Rumina decollate) +TX、セミエラケアベティオラタス (Semielacher petiolatus) +TX、シトビオンアベナエ (Sitobion avenae) (Ervibank (登録商標)) +TX、ステイネルネマカルポカプサエ (Steinernema carpocapsae) (Nematac C (登録商標) +TX、Mil
 lenium (登録商標) +TX、BioNem C (登録商標) +TX、NemAttack (登録商標) +TX、Nemastar (登録商標) +TX、Capsanem (登録商標)) +TX、ステイネルネマフェルティアエ (Steinernema feltiae) (NemaShield (登録商標) +TX、Nemasys F (登録商標)) +TX、BioNem F (登録商標) +TX、Steinernema-System (登録商標) +TX、NemAttack (登録商標) +TX、Nemaplus (登録商標) +TX、Exhibitline sf (登録商標) +TX、Scia-rid (登録商標) +TX、Entonem (登録商標)) +TX、ステイネルネマクラウセイ (Steinernema kraussei) (Nemasys L (登録商標) +TX、BioNem L (登録商標) +TX、Exhibitline srb (登録商標)) +TX、ステイネルネマリオブラベ (Steinernema riobrave) (BioVector (登録商標) +TX、BioVektor (登録商標)) +TX、
 ステイネルネマスカプテリシ (Steinernema scapterisci) (Nematac S (登録商標)) +TX、ステイネルネマ属の種 (Steinernema spp.) +TX、ステイネルネマチド属の種 (Steinernematids spp.) (Guardian Nematodes (登録商標)) +TX、ステトラスパンクチラム (Stethorus punctillum) (Stethorus (登録商標)) +TX、タマリキシアラジアテ (Tamarixia radiate) +TX、
 テトラスティカスセティフェル (Tetrastichus setifer) +TX、トリポビウスセミルテウス (Thripobius semiluteus) +TX、トリムスシネンシス (Torymus sinensis) +TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tricholine b (登録商標)) +TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tricho-Strip (登録商標)) +TX、ヨトウタマゴバチ (Trichogramma evanescens) +TX、トリコグラムマミヌタム (Trichogramma minutum) +TX、アウノメイガタマゴバチ (Trichogramma ostriniae) +TX、トリコグラムマプラトネリ (Trichogramma platneri) +TX、トリコグラムマプレチオサム (Trichogramma pretiosum) +TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (Xanthopimpla stemmator) ;
 以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 +TX、bioSea (登録商標) +TX、コンドロステレウムプルプレウム (Chondrostereum purpur

10

20

30

40

50

eum) (Chontrol Paste (登録商標)) + TX、コレトリカムグレオ
 スポリオイデス (Colletotrichum gloeosporioides) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX
 、デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニアアミロボ
 ラ (Erwinia amylovora) (ハーピン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、エクストラバージン
 オリーブ油の天然副生成物由来の脂肪酸 (FLIPPER (登録商標)) + TX、リン酸
 第二鉄 (Ferri-phosphate) (Ferramol (登録商標)) + TX、
 ファネルトラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商
 標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (10
 Homo-brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller
 Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録
 商標)) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標)) + T
 X、ミクロクトナスヒペロダエ (Microctonus hyperodae) + TX
 、ミコレプトディスカステレストリス (Mycoleptodiscus terres
 tris) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、A
 minomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラ
 ップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (Mils
 top (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX
 、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + 20
 チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登
 録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマロクスタエ (Nosema locustae)
 (Semaspore Organic Grasshopper Control (登
 録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Reb
 ell Amarillo (登録商標)) + TX及びびトラップ (Takitrapple
 y + b (登録商標)) + TX;

(1) 以下の群から選択される抗細菌剤:

(1.1) 細菌、その例は、以下のとおりである: Certis USA LLC (三井
 物産株式会社の子会社) からのバチルスモジャベンシス (Bacillus mojave
 nsis) 菌株 R3B (受託番号 NCAIM (P) B001389) (国際公開第 20
 13/034938号) + TX; バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 30
)、特に NRRL 受託番号 50185 を有する菌株 BU F-33 (BASF の CART
 ISSA (登録商標) 製品の一部として入手可能、EPA 登録番号 71840-19) +
 TX; バチルスサブチリス (Bacillus subtilis)、特に菌株 QST7
 13/AQ713 (Bayer CropScience LP, US から SERENADE OPTI 又は SERENADE ASO として入手可能、NRRL 受託番号 B21
 661、米国特許第 6,060,051 号明細書) + TX; バチルスサブチリス (Bac
 illus subtilis) 菌株 BU1814 (BASF SE の VELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX 及び VELONDIS (40
 登録商標) EXTRA として入手可能) + TX; 受託番号 DSM10271 を有するバチ
 ルスサブチリス変種 アミロリクエファシエンス (Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Novozymes から
 TAEGRO (登録商標) 又は TAEGRO (登録商標) ECO (EPA 登録番号 701
 27-5) として入手可能) + TX; Certis USA LLC (三井物産株式会社
 の子会社) のバチルスサブチリス (Bacillus subtilis) CX-906
 0 + TX; バチルス属の種 (Bacillus sp.)、特に菌株 D747 (クミアイ
 化学工業株式会社の DOUBLE NICKEL (登録商標) として入手可能)、受託番
 号 FERM BP-8234、米国特許第 7,094,592 号明細書 + TX; 受託番号
 NRRL B-50972 又は受託番号 NRRL B-67129 を有するパエニバシラ
 ス属の種 (Paenibacillus sp.) の菌株、国際公開第 2016/154 50

297号+TX; パエニバチルスポリミキサ (*Paenibacillus polymyxa*)、特に菌株AC-1 (例えば、Green Biotech Company Ltd. のTOPSEED (登録商標)) +TX; パントエアアグロメランス (*Pantoea agglomerans*)、特に菌株E325 (受託番号NRRL B-21856) (Northwest Agri ProductsからBLOOMTIME BIOLOGICAL (商標) FD BIOPESTICIDEとして入手可能) +TX; シュードモナスプロラディクス (*Pseudomonas proradix*) (例えば、Sourcon PadenaのPRORADIX (登録商標)) +TX; 並びに

(1.2) 真菌、その例は、以下のとおりである: アウレオバシジウムプルランス (*Aureobasidium pullulans*)、特に菌株DSM14940の分芽孢子、菌株DSM14941の分芽孢子又は菌株DSM14940とDSM14941の分芽孢子的混合物 (例えば、bio-ferm, CHのBOTECTOR (登録商標) 及びBLOSSOM PROTECT (登録商標)) +TX; シュードザイマアフィディス (*Pseudozyma aphidis*) (Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalemによる国際公開第2011/151819号に開示) +TX; Lesaffre et Compagnie, FRのサッカロマイセスセレビスエ (*Saccharomyces cerevisiae*)、特に菌株CNCM番号1-3936、CNCM番号1-3937、CNCM番号1-3938又はCNCM番号1-3939 (国際公開第2010/086790号);

(2) 以下の群から選択される生物学的殺菌・殺カビ剤:

(2.1) 細菌、その例は、以下のとおりである: アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) 菌株K84 (例えば、AgBioChem, CAのGALLTROL-A (登録商標)) +TX; アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) 菌株K1026 (例えば、BASF SEのNOGALL (商標)) +TX; 受託番号DSM10271を有するバチルスサブチリス変種アミロリケファシエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株FZB24 (NovozymesからTAEGRO (登録商標) 又はTAEGRO (登録商標) ECO (EPA登録番号70127-5) として入手可能) +TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株D747 (クミアイ化学工業株式会社からDouble Nickel (商標) として入手可能、受託番号FERM BP-8234、米国特許第7,094,592号明細書) +TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 菌株F727 (菌株MBI110としても知られている) (NRRL受託番号B-50768、国際公開第2014/028521号) (Marrone Bio InnovationsのSTARGUS (登録商標)) +TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 菌株FZB42、受託番号DSM23117 (ABiTEP, DEからRHI ZOVITAL (登録商標) として入手可能) +TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) アイソレートB246 (例えば、University of PretoriaのAVOGREEN (商標)) +TX; バチルスリケニホルミス (*Bacillus licheniformis*)、特に受託番号ATCC55406を有する菌株SB3086、国際公開第2003/000051号 (NovozymesからECOGUARD (登録商標) Biofungicide及びGREEN RELEAF (商標) として入手可能) +TX+TX; バチルスリケニホルミス (*Bacillus licheniformis*) FMCH001及びバチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) FMCH002 (FMC CorporationのQUARTZO (登録商標) (WG) 及びPRESENCE (登録商標) (WP)) +TX; バチルスメトロトロフィカス (*Bacillus methylophilus*) 菌株BAC-

10

20

30

40

50

9912 (Chinese Academy of Sciences' Institute of Applied Ecologyより) +TX; Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) のバチルスモジャベンシス (*Bacillus mojavensis*) 菌株R3B (受託番号NCAIM (P) B001389) (国際公開第2013/034938号) +TX; 受託番号B-30890を有するバチルスマイコイデス (*Bacillus mycooides*)、アイソレート、(Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) からBMJ TGA I (登録商標) 又はWG及びLifeGard (商標) として入手可能) +TX; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株QST2808 (Bayer CropScience LP, USからSONATA (登録商標) として入手可能、受託番号NRRL B-30087、米国特許第6,245,551号明細書に記載) +TX; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株GB34 (Bayer AG, DEからYield Shield (登録商標) として入手可能) +TX; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特にNRRL受託番号50185を有する菌株BU F-33 (BASFからCARTISSA製品の一部として入手可能、EPA登録番号71840-19) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株QST713/AQ713 (Bayer CropScience LP, USからSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL受託番号B21661、米国特許第6,060,051号明細書に記載) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) Y1336 (Bion-Tech, TaiwanからBIOBAC (登録商標) WPとして入手可能、台湾で生物学的殺菌・殺カビ剤として登録番号4764、5454、5096及び5277で登録) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株MBI600 (BASF SEからSUBTILEXとして入手可能)、受託番号NRRL B-50595、米国特許第5,061,495号明細書+TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株GB03 (Bayer AG, DEからKodiak (登録商標) として入手可能) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株BU1814 (BASF SEからVELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX及びVELONDIS (登録商標) EXTRAとして入手可能) +TX; Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) からのバチルスサブチリスCX-9060 (*Bacillus subtilis* CX-9060) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) KTSB菌株 (DonaghysからのFOLI ACTIVE (登録商標)) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) IAB/BS03 (STK Bio-Ag TechnologiesからのAVIV (商標)、Idai NatureのPORTENTO (登録商標)) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株Y1336 (Bion-Tech, TaiwanからBIOBAC (登録商標) WPとして入手可能、台湾で生物学的殺菌・殺カビ剤として登録番号4764、5454、5096及び5277で登録) +TX; BASF SEからのパエニバチルスエピフィチカス (*Paenibacillus epiphyticus*) (国際公開第2016/020371号) +TX; BASF SEからのパエニバチルスポリミキサ属プランタルム (*Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum*) (国際公開第2016/020371号) +TX; 受託番号NRRL B-50972又は受託番号NRRL B-67129を有するパエニバチルス属の種 (*Paenibacillus* sp.) の菌株、国際公開第2016/154297号+TX; シュードモナスクロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) 菌株AFS009、受託番号NRRL B-50897、国際公開第2017/019448号 (例えば、AgBiome Innovations, USのHOWLER (商標) 及びZIO (登録商標)) +TX; シュードモナスクロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*)、特に菌株MA342 (例えば、Bioagr

10

20

30

40

50

i and KoppertによるCEDOMON（登録商標）、CERALL（登録商標）及びCEDRESS（登録商標））+TX；シュードモナスフルオレッセンス（*Pseudomonas fluorescens*）菌株A506（例えば、NuFarmによるBLIGHTBAN（登録商標）A506）+TX；シュードモナスプロラディクス（*Pseudomonas proradix*）（例えば、Sourcon PadenaからのPRORADIX（登録商標））+TX；ストレプトマイセスグリセオビリディス（*Streptomyces griseoviridis*）菌株K61（ストレプトマイセスガルバス（*Streptomyces galbus*）菌株K61としても知られている）（受託番号DSM7206）（VerderaからのMYCOSTOP（登録商標）、BioWorksからのPREFENCE（登録商標）、Crop Protection 2006, 25, 468-475を参照されたい）+TX；ストレプトマイセスリディカス（*Streptomyces lydicus*）菌株WYEC108（ストレプトマイセスリディカス（*Streptomyces lydicus*）菌株WYCD108USとしても知られている）（NovozymesからのACTINO-IRON（登録商標）及びACTINOVATE（登録商標））+TX；並びに

（2.2）真菌、その例は、以下のとおりである：アムペロマイセススキスクアリス（*Ampelomyces quisqualis*）、特に菌株AQ10（例えば、IntrachemBio ItaliaによるAQ10（登録商標））+TX；受託番号CNCM1-807を有するアムペロマイセススキスクアリス（*Ampelomyces quisqualis*）菌株AQ10（例えば、IntrachemBio ItaliaによるAQ10（登録商標））+TX；アスペルギルスフラバス（*Aspergillus flavus*）菌株NRRL21882（Syngenta／ChemChinaのAFLA-GUARD（登録商標）として知られる製品）+TX；アウレオバシジウムプルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM14940の分芽胞子+TX；アウレオバシジウムプルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM14941の分芽胞子+TX；アウレオバシジウムプルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM14940とDSM14941の分芽胞子の混合物（例えば、bio-ferm, CHによるBotector（登録商標））+TX；カエトミウムクプレウム（*Chaetomium cupreum*）（受託番号CABI353812）（例えば、AgriLifeによるBIOKUPRUM（商標））+TX；カエトミウムグロボサム（*Chaetomium globosum*）（RivaleによるRIVADIOM（登録商標）として入手可能）+TX；クラドスポリウムクラドスポリオイデス（*Cladosporium cladosporioides*）、菌株H39、受託番号CBS122244、米国特許出願公開第2010／0291039号明細書（Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek）+TX；コニオチリウムミニタンス（*Coniothyrium minitans*）、特に菌株CON／M／91-8（受託番号DSM9660、例えばBayer CropScience Biologics GmbHのContans（登録商標））+TX；クリプトコッカスフラベセンス（*Cryptococcus flavescens*）、菌株3C（NRRL Y-50378）（B2.2.99）+TX；ダクチラリアカンジダ（*Dactylaria Candida*）+TX；ジロホスホラアロペクリ（*Dilophosphora alopecuri*）（TWIST FUNGUS（登録商標）として入手可能）+TX；フザリウムオキシスポラム（*Fusarium oxysporum*）、菌株Fo47（Natural Plant ProtectionによるFUSACLEAN（登録商標）として入手可能）+TX；グリオクラジウムカテヌラタム（*Gliocladium catenulatum*）（同義語：クロノスタキスロゼアf. カテヌラータ（*Clonostachys rosea* f. *catenulate*））菌株J1446（例えば、LallemandによるPrestop（登録商標））+TX；グリオクラジウムロセウム（*Gliocladium roseum*）（クロノスタキスロゼアf.ロゼア（*Clon*

10

20

30

40

50

ostachys rosea f. rosea) としても知られている)、特に Adj
 uvants Plus の菌株 321U、Xue (Efficacy of Clono
 stachys rosea strain ACM941 and fungicid
 e seed treatments for controlling the ro
 ot rot complex of field pea, Can Jour Plan
 t Sci 83 (3): 519-524) に開示されている菌株 ACM941 又は菌株
 IK726 (Jensen DF, et al. Development of a b
 iocontrol agent for plant disease contro
 l with special emphasis on the near comme
 rcial fungal antagonist Clonostachys ros
 ea strain 'IK726', Australas Plant Pathol.
 2007, 36: 95-101) +TX; 菌株 KV01 のレカニシリウムレカニイ (Le
 canicillium lecanii) (過去にはベルチシリウムレカニイ (Ver
 ticillium lecanii) として知られていた) 分生子 (例えば、Kopp
 ert / Arysta による Vertalec (登録商標)) +TX; メツシュニコウイ
 アフルクチコラ (Metschnikowia fructicola)、特に菌株 NR
 RLY-30752、(B2.2.3) +TX; ミクロスファエロプシスオクラセア (M
 icrosphaeropsis ochracea) +TX; ムスコドルロセウス (M
 uscodor roseus)、特に菌株 A3-5 (受託番号 NRRL 30548)
 +TX; BASF SE のペニシリウムステッキイ (Penicillium stec
 kii) (DSM27859、国際公開第 2015/067800 号) +TX; ペニシリ
 ウムベルミクラタム (Penicillium vermiculatum) +TX; カ
 ミカワタケ (Phlebiopsis gigantea) 菌株 VRA1992 (Dan
 star Ferment の ROTSTOP (登録商標) C) +TX; ピキアアノマラ (P
 ichia anomala)、菌株 WRL-076 (NRRL Y-30842)、
 米国特許第 7,579,183 号明細書 +TX; シュードジマフロクロッサ (Pseu
 dzyma flocculosa)、菌株 PF-A22 UL (Plant Prod
 ucts Co., CA による SPORODEX (登録商標) L として入手可能) +TX
 ; サッカロマイセスセレビスエ (Saccharomyces cerevisiae)
 、特に菌株 LASO2 (Agro-Levures et Derives より)、菌株
 LAS117 細胞壁 (Lesaffre の CEREVISANE (登録商標)、
 BASF SE の ROMEO (登録商標))、Lesaffre et Compagn
 ie, FR の菌株 CNCM 番号 1-3936、CNCM 番号 1-3937、CNCM 番号
 1-3938、CNCM 番号 1-3939 (国際公開第 2010/086790 号) +T
 X; シンプリシリウムラノソニヴェウム (Simplicillium lanoson
 iveum) +TX; タラロマイセスフラバス (Talaromyces flavus
)、菌株 V117b +TX; トリコデルマアスペレロイデス (Trichoderma
 asperelloides) JM41R (受託番号 NRRL B-50759) (BA
 SF SE の TRICHO PLUS (登録商標)) +TX; トリコデルマアスペレルム
 (Trichoderma asperellum)、特に菌株 kd (例えば、Ande
 rmatt Biocontrol の T-Gro) +TX; トリコデルマアスペレルム (T
 richoderma asperellum)、特に菌株 SKT-1、受託番号 FE
 RM P-16510 (例えば、クミアイ化学工業株式会社の ECO-HOPE (登録商
 標))、菌株 T34 (例えば、Biocontrol Technologies S.
 L., ES による T34 Biocontrol) 又は Isagro の菌株 ICC012
 +TX; トリコデルマアトロビリデ (Trichoderma atroviride)
 、特に菌株 SC1 (受託番号 CBS 122089、国際公開第 2009/116106
 号及び米国特許第 8,431,120 号明細書 (Bi-PA より))、菌株 77B (An
 dermatt Biocontrol の T77) 又は菌株 LU132 (例えば、Agr
 imm Technologies Limited の Sentinel) +TX; トリ

10

20

30

40

50

コデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株 CNC
 M1-1237 (例えば、Agrauxine, FRのEsquive (登録商標) WP)
) + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、
 菌株番号 V08/002387 + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichod*
erma atroviride)、菌株 NMI 番号 V08/002388 + TX; トリ
 コデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株 NMI
 番号 V08/002389 + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma*
atroviride)、菌株 NMI 番号 V08/002390 + TX; トリコデルマア
 トロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株 LC52 (例えば
 、Agrimm Technologies LimitedによるTenet) + TX
 ; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株
 ATCC 20476 (IMI 206040) + TX; トリコデルマアトロビリデ (T
richoderma atroviride)、菌株 T11 (IMI352941/C
 ECT20498) + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma at*
roviride)、菌株 SKT-1 (FERM P-16510)、特開平11-25
 3151号公報 + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atro*
viride)、菌株 SKT-2 (FERM P-16511)、特開平11-2531
 51号公報 + TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atrovir*
ide)、菌株 SKT-3 (FERM P-17021)、特開平11-253151
 号公報 + TX; トリコデルマファータイル (*Trichoderma fertile*)
 (例えば、BASFの製品TrichoPlus) + TX; トリコデルマガムシイ (T
richoderma gamsii) (旧名T. ビリデ (*T. viride*))、菌株 I
 CC080 (IMI CC 392151 CABI、例えばAGROBIOSOL D
 E MEXICO, S. A. DE C. V. によるBioDerma) + TX; トリコデ
 ルマガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (旧名T. ビリデ (*T. vir*
ide))、菌株 ICC080 (IMI CC 392151 CABI) (AGROB
 IOSOL DE MEXICO, S. A. DE C. V. によるBIODERMA (登
 録商標)として入手可能) + TX; トリコデルマハルマタム (*Trichoderma*
harMATum) + TX; 受託番号ATCC28012を有するトリコデルマハルマタ
 ム (*Trichoderma harMATum*) + TX; トリコデルマハルジアナム (T
richoderma harzianum) 菌株T-22 (例えば、Anderma
 tt Biocontrol又はKoppertからのTrianium-P) 又は菌株C
 epa SimbT5 (Simbiose Agroより) + TX; トリコデルマハルジ
 アナム (*Trichoderma harzianum*) + TX; トリコデルマハルジ
 アナムリファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) T39 (例
 えば、Makhteshim, USのTrichodex (登録商標)) + TX; トリコ
 デルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*)、菌株ITEM9
 08 (例えば、KoppertからのTrianium-P) + TX; トリコデルマハルジ
 アナム (*Trichoderma harzianum*)、菌株TH35 (例えば、My
 controlによるRoot-Pro) + TX; トリコデルマハルジアナム (T
richoderma harzianum)、菌株DB103 (Dagut Biola
 bによるT-GRO (登録商標) 7456として入手可能) + TX; トリコデルマポリス
 ポラム (*Trichoderma polysporum*)、菌株IMI206039 (例
 えば、BINAB Bio-Innovation AB, SwedenによるBin
 ab TF WP) + TX; 受託番号Ts3550を有するトリコデルマストロマチカム
 (*Trichoderma stromaticum*)、(例えば、CEPLAC, Br
 azilによるTricovab) + TX; トリコデルマビレンス (*Trichoder*
ma virens) (グリオクラジウムビレンス (*Gliocladium vire*
ns)としても知られている)、特に菌株GL-21 (例えば、Certis, USによ
 るSoilGard) + TX; トリコデルマビレンス (*Trichoderma vir*

10

20

30

40

50

ens) 菌株 G-41、過去にはグリオクラジウムビレンス (*Gliocladium virens*) として知られていた (受託番号 ATCC 20906) (例えば、BioWorks, US の ROOTSHIELD (登録商標) PLUS WP 及び TURF SHIELD (登録商標) PLUS WP) + TX; トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、菌株 TV1 (例えば、Koppert による Trianum-P) + TX; トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、特に菌株 B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w S z c z e c i n i e 161:125-137) + TX; 受託番号 CABI CC IMI 392716 を有するトリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 ICC012 (トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*) ICC012 としても知られている) と、受託番号 IMI 392151 を有するトリコデルマガムシ (*Trichoderma gamsii*) (旧名 T. ビリデ (*T. viride*)) 菌株 ICC080 (例えば、Isagro USA, Inc. の BIO-TAM (商標) 及び Agrobiosol de Mexico, S. A. de C. V. による BIODERMA (登録商標)) との混合物 + TX; 受託番号 NM 99/06216 を有するウロクラジウムオウデマンシ (*Ulocladium oudemansii*) 菌株 U3 (例えば、Botry-Zen Ltd, New Zealand による BOTRY-ZEN (登録商標) 及び BioWorks, Inc. の BOTRYSTOP (登録商標)) + TX; パーティシリウムアルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 V. ダーリエ (*V. dahliae*))、受託番号 WCS850 を有する菌株 WCS850、Central Bureau for Fungi Cultures に寄託 (例えば、Tree Care Innovations による DUTCH TRIG (登録商標)) + TX; ベルチシリウムクラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) + TX;

(3) 以下の群から選択される植物の成長及び／又は植物の健康を改善する効果を有する生物学的防除剤:

(3.1) 細菌、その例は、以下のとおりである: アゾスピリルムブラシレンセ (*Azospirillum brasiliense*) (例えば、KALO, Inc. の VIGOR (登録商標)) + TX; アゾスピリルムリポフェラム (*Azospirillum lipoferum*) (例えば、TerraMax, Inc. の VERTEX-IF (商標)) + TX; アゾリゾビウムカウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、特に菌株 ZB-SK-5 + TX; アゾトバクタークロオコッカム (*Azotobacter chroococcum*)、特に菌株 H23 + TX; アゾトバクタービネランジイ (*Azotobacter vinelandii*)、特に菌株 ATCC 12837 + TX; アゾトバクタービネランジイ (*Azotobacter vinelandii*) とクロストリジウムパステウリアナム (*Clostridium pasteurianum*) との混合物 (Agrinos から INVIGORATE (登録商標) として入手可能) + TX; バチルスアミロリケファシエンス pm414 (*Bacillus amyloliquefaciens* pm414) (Biofilm Crop Protection の LOLI-PEPTA (登録商標)) + TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) SB3281 (ATCC # PTA-7542、国際公開第 2017/205258 号) + TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) TJ1000 (Novozymes から QUIKROOTS (登録商標) として入手可能) + TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株 IN937a + TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株 FZB42 (例えば、ABITEP, DE の RHI ZOVITAL (登録商標)) + TX; バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) BS27 (受託番号 NRRL B-5015) + TX; バチルスセレウス (*Bacillus*

10

20

30

40

50

cereus) 科の EE128 (NRRL 番号 B-50917) +TX; バチルスセレウス (*Bacillus cereus*) 科の EE349 (NRRL 番号 B-50928) +TX; バチルスセレウス (*Bacillus cereus*)、特に菌株 BP01 (ATCC 55675、例えば Arysta Lifescience, US の MEPICHLOR (登録商標)) +TX; バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*)、特に菌株 CNMC1-1582 (例えば、BASF SE の VOTIVO (登録商標)) +TX; バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) BT155 (NRRL 番号 B-50921) +TX; バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) EE118 (NRRL 番号 B-50918) +TX; バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) EE141 (NRRL 番号 B-50916) +TX; バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) BT46-3 (NRRL 番号 B-50922) +TX; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 QST2808 (受託番号 NRRL 番号 B-30087) +TX; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 GB34 (例えば、Bayer Crop Science, DE の YIELD SHIELD (登録商標)) +TX; バチルスシアメンシス (*Bacillus siamensis*)、特に菌株 KCTC13613T +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 QST713 / AQ713 (NRRL 受託番号 B-21661、米国特許第 6,060,051 号明細書に記載、Bayer Crop Science LP, US から SERENADE (登録商標) OPTI 又は SERENADE (登録商標) ASO として入手可能) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 AQ30002 (受託番号 NRRL B-50421、米国特許出願公開第 13/330,576 号明細書に記載) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 AQ30004 (並びに NRRL B-50455、米国特許出願公開第 13/330,576 号明細書に記載) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 BU1814、(BASF SE から TEQUALIS (登録商標) として入手可能)、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) rm303 (Biofilm Crop Protection の RHI ZOMAX (登録商標)) +TX; バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BT013A (NRRL 番号 B-50924) (バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 4Q7 としても知られている) +TX; バチルスリケニホルミス (*Bacillus licheniformis*) FMCH001 とバチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) FMCH002 との混合物 (FMC Corporation から QUARTZO (登録商標) (WG)、PRESENCE (登録商標) (WP) として入手可能) +TX; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 MBI600 (例えば、BASF SE の SUBTILEX (登録商標)) +TX; バチルステキレンシス (*Bacillus tequilensis*)、特に菌株 NII-0943 +TX; ブラディリゾビウムジャポニカム (*Bradyrhizobium japonicum*) (例えば、Novozymes の OPTIMIZE (登録商標)) +TX; デルフチアアシドボランス (*Delftia acidovorans*)、特に菌株 RAY209 (例えば、Brett Young Seeds の BIOBOOST (登録商標)) +TX; メソリゾビウムシセリ (*Mesorhizobium cicer*) (例えば、BASF SE の NODULATOR) +TX; ラクトバチルス属の種 (*Lactobacillus* sp.) (例えば、LactopaFi の LACTOPLANT (登録商標)) +TX; リゾビウムレグミノサリウム生物型ビセアエ (*Rhizobium leguminosarium biovar viceae*) (例えば、BASF SE の NODULATOR) +TX; シュードモナスプロラディクス (*Pseudomonas proradix*) (例えば、Sourcon Padena の PRORADIX (登録商標)) +TX; 緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、特に菌株 PN1 +

10

20

30

40

50

TX; リゾビウムレグミノサルム (*Rhizobium leguminosarum*)、特に生物型ビセアエ (*bv. viceae*) 菌株 Z25 (受託番号 CECT 4585) + TX; パエニバチルスポリミキサ (*Paenibacillus polymyxa*)、特に菌株 AC-1 (例えば、Green Biotech Company Ltd. の TOPSEED (登録商標)) + TX; セラチアマルセセンス (*Serratia marcescens*)、特に菌株 SRM (受託番号 MTCC 8708) + TX; シノリゾビウムメリロティ (*Sinorhizobium meliloti*) 菌株 NRG-185-1 (Bayer Crop Science の NITRAGIN (登録商標) GOLD) + TX; チオバチルス属の種 (*Bacillus* sp.) (例えば、Cropaid Ltd UK の CROPAID (登録商標)) + TX; 並びに

(3.2) 真菌、その例は、以下のとおりである: プルプレオシリウムリラシナム (*Purpureocillium lilacinum*) (以前はパエシロマイセスリラシナス (*Paecilomyces lilacinus*) として知られていた) 菌株 251 (AGAL89/030550、例えば Bayer Crop Science Biologics GmbH の BioAct) + TX; ペニシリウムビライイ (*Penicillium bilaii*)、菌株 ATCC 22348 (例えば、Acceleron BioAg の JumpStart (登録商標))、タラロマイセスフラバス (*Talaromyces flavus*)、菌株 V117b + TX; トリコデルマトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 CNCM1-1237 (例えば、Agrauxine, FR の Esquive (登録商標) WP)、トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、例えば菌株 B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie 161:125-137) + TX; トリコデルマトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 LC52 (トリコデルマトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 LU132 としても知られている、例えば Agrimm Technologies Limited の Sentinel) + TX; 国際特許出願第 PCT/IT2008/000196 号に記載のトリコデルマトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 SC1 + TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 kd (例えば、Andermatt Biocontrol の T-Gro) + TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 Eco-T (Plant Health Products, ZA)、トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 T-22 (例えば、Andermatt Biocontrol 又は Koppert の Trianium-P) + TX; ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC-0255 (例えば、Valent Biosciences の DiTera (商標)) + TX; ペニシリウムビライイ (*Penicillium bilaii*) 菌株 ATCC ATCC20851 + TX; ピシウムオリガンドラム (*Pythium oligandrum*) 菌株 M1 (ATCC38472、例えば Bioprepraty, CZ の Polyversum) + TX; トリコデルマビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株 GL-21 (例えば、Certs, USA の SoilGard (登録商標)) + TX; バーティシリウムアルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 V. ダーリエ (*V. dahliae*)) 菌株 WCS850 (CBS276.92、例えば Tree Care Innovations の Dutch Trig) + TX; トリコデルマトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に菌株番号 V08/002387、菌株番号 NMI 番号 V08/002388、菌株番号 NMI 番号 V08/002389、菌株番号 NMI 番号 V08/002390 + TX; トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 ITEM908、トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*)、菌株 TSTh20 + TX; トリコデルマハルジアナム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 1295-22 +

10

20

30

40

50

TX；ピシウムオリガンドラム (*Pythium oligandrum*) 菌株DV74 + TX；リゾポゴンアミロポゴン (*Rhizopogon amylopogon*) (例えば、Helena Chemical CompanyのMyco-Solに含まれているもの) + TX；リゾポゴンフルビグレバ (*Rhizopogon fulvigleba*) (例えば、Helena Chemical CompanyのMyco-Solに含まれているもの) + TX；トリコデルマビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株GI-3 + TX；

(4) 以下から選択される殺虫に有効な生物学的防除剤

(4.1) 細菌、その例は、以下のとおりである：アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) 菌株K84 (例えば、AgBioChem Inc. のGalltrol) + TX；バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株PTS-4838 (例えば、Valent Biosciences, USのAVEO) + TX；バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*)、特に菌株CNMC1-1582 (例えば、BASF SEのVOTIVO (登録商標)) + TX；バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*)、アイソレートJ. (例えば、Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) のBmJ) + TX；バチルススファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、特に血清型H5a5b菌株2362 (菌株ABTS-1743) (例えば、Valent Biosciences, USのVECTOLEX (登録商標)) + TX；バチルスチューリングエンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、特に菌株ABTS-1857 (SD-1372、例えばValent BiosciencesのXENTARI (登録商標)) + TX；バチルスチューリングエンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、特に血清型H-7 (例えば、Valent Biosciences, USのFLORBAC (登録商標) WG) + TX；バチルスチューリングエンシスイスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) 菌株BMP144 (例えば、Becker Microbial Products, ILによるAQUABAC (登録商標)) + TX；バチルスチューリングエンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (血清型H-14) 菌株AM65-52 (受託番号ATCC1276) (例えば、Valent Biosciences, USによるVECTOBAC (登録商標)) + TX；バチルスチューリングエンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) 菌株GC-91 + TX；バチルスチューリングエンシス変種コルメリ (*Bacillus thuringiensis* var. *Colmeri*) (例えば、Changzhou Jianghai Chemical FactoryによるTIANBAOBTC) + TX；バチルスチューリングエンシス変種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis* var. *japonensis*) 菌株Bui bui + TX；Becker Microbial Products, ILのバチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) 菌株BMP123 + TX；Becker Microbial Products, ILによるバチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) 菌株BMP123、例えばBayer CropScienceのBARITONE + TX；バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) 菌株HD-1 (例えば、Valent Biosciences, USのDIPEL (登録商標) ES) + TX；バチルスチューリングエンシス変種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* var. *kurstaki*) 菌株EVB-113-19 (例えば、AEF GlobalのBIOPROTEC (登録商標)) + TX；バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)

10

20

30

40

50

llus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株ABTS
 351+TX; バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株PB54+TX; バチルス
 チューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株SA11、(Certis, USのJAVELIN
)+TX; バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株SA12 (Certis, US
 のTHURICIDE)+TX; バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株EG23
 48 (Certis, USのLEPINOX)+TX; バチルスチューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株EG7841 (Certis, USのCRYMAX)+TX; バチルスチュー
 リンゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) 菌株NB176 (SD-5428、例えばBio
 Fa DEのNOVODOR (登録商標) FC)+TX; プレビバチルスラテロスポラス
 (*Brevibacillus laterosporus*) (Ecolibrium
 BiologicalsのLATERAL)+TX; バークホルデリア属の種 (*Burkholderia spp.*)、特にバークホルデリアリノジェンシス (*Burkhol
 deria rinojensis*) 菌株A396 (バークホルデリアリノジェンシス (*Burkholderia rinojensis*) 菌株MBI305としても知られて
 いる) (受託番号NRRL B-50319+TX; 国際公開第2011/106491
 号及び国際公開第2013/032693号+TX; 例えばMarrone Bio I
 nnovationsのMBI206 TGA I及びZELTO (登録商標))+TX;
 クロモバクテリウムサブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*)
)、特に菌株PRAA4-1T (MBI-203+TX; 例えばMarrone Bio
 InnovationsのGRANDEVO (登録商標))+TX; レカニシリウムムス
 カリウム (*Lecanicillium muscarium*) Ve6 (Koppert
 のMYCOTAL)+TX; パエニバチルスポピリエ (*Paenibacillus p
 opilliae*) (旧名バチルスポピリエ (*Bacillus popilliae*)
)+TX; 例えばSt. Gabriel LaboratoriesのMILKY SPO
 RE POWDER (商標) 及びMILKY SPORE GRANULAR (商標)+
 TX; パスツリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) 菌株Pn1
 (Syngenta/ChemChinaのCLARIVA)+TX; セラチアエントモ
 フィラ (*Serratia entomophila*) (例えば、Wrightson
 SeedsによるINVADE (登録商標))+TX; セラチアマルセセンス (*Serr
 atia marcescens*)、特に菌株SRM (受託番号MTCC 8708)+
 TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) (
 NovozymesのTRICHODERMAX)+TX; ボルバキアピピエンティス (*Wolbachia pipientis*) ZAP 菌株 (例えば、MosquitoMa
 teのZAP MALES (登録商標))+TX; 並びに

10

20

30

40

(4.2) 真菌、その例は、以下のとおりである：ボーベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株ATCC74040 (例えば、Intrachem Bi
 o ItaliaのNATURALIS (登録商標))+TX; ボーベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株GHA (受託番号ATCC74250、例え
 ばLaverlam International CorporationのBOTA
 NIGUARD (登録商標) ES及びMYCONTROL-O (登録商標))+TX; ボー
 ベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株ATP02 (受託番号
 DSM24665)+TX; SePROのイサリアフモソロゼア (*Isaria fum
 osorosea*) (以前はパエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyce
 s fumosoroseus*) として知られていた) 菌株Apopka97 PREF

50

ERAL+TX;メタリジウムアニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*) 3213-1 (NRRL受託番号67074として寄託) (国際公開第2017/066094号+TX; Pioneer Hi-Bred International)+TX;メタリジウムロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 15013-1 (NRRL受託番号67073として寄託)+TX;メタリジウムロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 23013-3 (NRRL受託番号67075として寄託)+TX;パエシロマイセスリラシナス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株251 (Certis, USのMELOCON)+TX;ズーフトララジカンス (*Zoophthora radicans*)+TX;

(5) 以下からなる群から選択されるウイルス: アドキシフィエスオラナ (*Adoxophyes orana*) (リンゴコカクモンハマキ) 顆粒病ウイルス (GV)+TX; シディアポモネラ (*Cydia pomonella*) (コドリングア) 顆粒病ウイルス (GV)+TX; ヘリコベルパアルミゲラ (*Helicoverpa armigera*) (オオタバコガ) 核多角体病ウイルス (NPV)+TX; スポドプテラエキシグア (*Spodoptera exigua*) (シロイチモジヨトウ) mNPV+TX; スポドプテラフルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) (ツマジロクサヨトウ) mNPV+TX; スポドプテラリットラリス (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) NPV+TX;

(6) 以下から選択される、植物又は植物部位又は植物組織に「接種株」として添加することが可能であり、その特定の特性のため、植物の成長及び植物の健康を促進させる細菌及び真菌: アグロバクテリウム属の種 (*Agrobacterium* spp.)+TX; アゾリゾビウムカウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)+TX; アゾスピリルム属の種 (*Azospirillum* spp.)+TX; アゾトバクテリウム属の種 (*Azotobacter* spp.)+TX; ブラジリゾビウム属の種 (*Bradyrhizobium* spp.)+TX; バークホルデリア属の種 (*Burkholderia* spp.)、特にバークホルデリアセパシア (*Burkholderia cepacia*) (過去にはシュードモナスセパシア (*Pseudomonas cepacia*) としても知られている)+TX; ギガスポラ属の種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラモノスポラム (*Gigaspora monosporum*)+TX; グロムス属の種 (*Glomus* spp.)+TX; キツネタケ属の種 (*Laccaria* spp.)+TX; ラクトバチルスブクネリ (*Lactobacillus buchneri*)+TX; パラグロムス属の種 (*Paraglomus* spp.)+TX; コツブタケ (*Pisolithus tinctorius*)+TX; シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.)+TX; リゾビウム属の種 (*Rhizobium* spp.)、特にリゾビウムトリフォリイ (*Rhizobium trifolii*)+TX; リゾポゴン属の種 (*Rhizopogon* spp.)+TX; スクレロデルマ属の種 (*Scleroderma* spp.)+TX; スイルス属の種 (*Suillus* spp.)+TX; ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces* spp.)+TX;

(7) 以下から選択される、生物学的防除剤として使用可能な、タンパク質及び二次代謝産物を含む微生物により形成された植物抽出物及び生成物: ニンニク (*Allium sativum*) (Eco-SprayのNEMGUARD+TX; ADAMAのBRALIC)+TX; Armour-Zen+TX; ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)+TX; アザジラクチン (例えば、Certis, USのAZATINXL)+TX; Biokeeper WP+TX; アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特にアブラナ粉末又はマスタード粉末+TX; カシニアニグリカンス (*Cassia nigricans*)+TX; ケラストラスアングラタス (*Celastrus angulatus*)+TX; ケノポジウムアンテルミンティカム (*Chenopodium anthelminticum*)+TX; キチン+TX; セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)+TX; スギナ (*Equisetum ar*

10

20

30

40

50

vense) + TX; Fortune Aza + TX; Fungastop + TX; Heads Up (キヌア (Chenopodium quinoa) サポニン抽出物) + TX; PROBLAD (ルピナス種子由来の天然のBladポリペプチド)、Certis EU + TX; FRACTURE (ルピナス種子由来の天然のBladポリペプチド)、FMC + TX; ジョチュウギク／ピレトリン + TX; カシアアマラ (Quassia amara) + TX; コナラ属 (Quercus) + TX; キラヤ属 (Quillaja) 抽出物 (BASFのQL AGR I 35) + TX; オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) 抽出物 (Marrone BioのREGALLIA / REGALLIA MAXX) + TX; 「Requiem (商標) Insecticide」 + TX; ロテノン + TX; リアニア／リアノジン + TX; ヒレハリソウ (Symphytum officinale) + TX; タンジー (Tanacetum vulgare) + TX; チモール + TX; ゲラニオールと混合したチモール (Eden ResearchのCEDROZ) + TX; ゲラニオール及びオイゲノールと混合したチモール (Eden ResearchのMEVALONE) + TX; Triact 70 + TX; Tri Con + TX; キンレンカ (Tropaeolum majus) + TX; ティーツリー (Melaleuca alternifolia) 抽出物 (STKのTIMOREX GOLD) + TX; セイヨウイラクサ (Urtica dioica) + TX; ベラトリン + TX; 及びセイヨウヤドリギ (Viscum album) + TX; 並びに
毒性緩和剤、例えばベノキサコール + TX、クロキントセット (クロキントセット－メキシルを含む) + TX、シブロスルファミド + TX、ジクロロミド + TX、フェンクロラゾール (フェンクロラゾール－エチルを含む) + TX、フェンクロリム + TX、フルキソフェニム + TX、フリラゾール + TX、イソキサジフェン (イソキサジフェン－エチルを含む) + TX、メフェンピル (メフェンピル－ジエチルを含む) + TX、メトカミフェン + TX 及びオキサベトリニル + TX。

【0221】

さらに、本発明の組成物は、1種以上の全身獲得抵抗性誘導剤 (「SAR」誘導剤) と共に適用することもできる。SAR誘導剤は公知であり、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えばサリチル酸塩及び市販のSAR誘導剤であるアシベンゾラール－S－メチルが挙げられる。

【0222】

実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、通常組成物の形態で用いられ、処理される作物領域又は植物にさらなる化合物と同時に又は連続して適用され得る。これらのさらなる化合物は、例えば、肥料若しくは微量元素供与物又は植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であり得る。これらは、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤並びに殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺細菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であり得るか、又は必要に応じて配合物の分野で慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を含む、これらの調製物の数種の混合物であり得る。

【0223】

実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、有効成分として実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の少なくとも1種の化合物又は遊離形態若しくは農芸化学的に使用可能な塩形態の上で定義された少なくとも1種の好ましい個々の化合物と、上記補助剤の少なくとも1種とを含む、植物病原性微生物に対する防除若しくは保護のための (殺菌・殺カビ) 組成物の形態で使用することができる。

【0224】

従って、本発明は、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の少なくとも1種の化合物と、農学的に許容可能なキャリアとを含み、任意に補助剤も含み得る、組成物、好ましくは殺菌・殺カビ組成物を提供する。農学的に許容可能なキャリアは、例えば、農業用途に好適なキャリアである。農業用キャリアは、当技術分野で周知である。好ましくは、前記組成物は、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物に加えて、有害生物の防除に有効な少なくとも1種以上の化合物、例えば追加の殺菌・

殺カビに有効な成分を含み得る。

【0225】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖材料、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物などの植物又は非生体材料に対する、特に真菌性生物などの植物病原性又はヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物又は生物による外寄生を防除若しくは予防する方法に関し、この方法は、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物若しくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を有効成分として植物、植物の一部若しくはその生息地、その繁殖材料又は非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

【0226】

防除若しくは予防とは、昆虫又は特に真菌性生物といった植物病原性若しくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0227】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物による作物植物の外寄生を防除若しくは予防する好ましい方法であって、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物又は前記化合物の少なくとも1種を含有する農薬組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度及び適用量は、対応する病原体又は昆虫による外寄生のリスクに応じることになる。しかしながら、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、植物の生息地に液体配合物を灌注するか、又は例えば粒状形態(土壤施用)の固体形態で化合物を土壤に適用することにより、土壤(浸透移行作用)を介して根から植物に浸透させることもできる。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物は、種子又は塊茎を殺菌・殺カビ剤の液体配合物に含浸させるか、又はこれらを固体配合物でコーティングすることによっても種子に適用(コーティング)され得る。

【0228】

例えば、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物と、必要に応じて、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物をカプセル化する固体又は液体補助剤又はモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式において、典型的には化合物を例えば溶剤、固体キャリア及び任意に表面活性化合物(界面活性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、且つ／又は粉碎することによって調製され得る。

【0229】

流行している状況における意図される目的及び上述の種類の有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散又は流しかけなどの上述の種類の有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1～1000 ppm、好ましくは0.1～500 ppmの有効成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは、1g～2000gの有効成分／ヘクタール、より好ましくは10～1000g／ha、最も好ましくは10～600g／haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg～1gの活性物質である。

【0230】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001～50gの式(I)の化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01～10gの量が一般に十分とされる。

【0231】

好適には、本発明に係る実施形態1～43のいずれか1つに定義される式(I)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に又は病害の発生後を意味する治療的に適用される。

【0232】

10

20

30

40

50

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末（D S）、種子処理用エマルジョン（E S）、種子処理用流動性濃縮物（F S）、種子処理用溶液（L S）、種子処理用水分散性粉末（W S）、種子処理用カプセル懸濁液（C F）、種子処理用ゲル（G F）、エマルジョン濃縮物（E C）、懸濁液濃縮物（S C）、サスポエマルジョン（S E）、カプセル懸濁液（C S）、水分散性顆粒（W G）、乳化性顆粒（E G）、エマルジョン、油中水型（E O）、エマルジョン、水中油型（E W）、マイクロエマルジョン（M E）、油分散体（O D）、油混和性の流動体（O F）、混油性液体（O L）、可溶性濃縮物（S L）、超低体積懸濁液（S U）、超低体積液体（U L）、工業用濃縮物（T K）、分散性濃縮物（D C）、水和剤（W P）又は農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

10

【0233】

このような組成物は、従来の様式で例えば有効成分を適切な不活性配合物（希釈剤、溶剤、充填材並びに界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤及びアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意に他の配合成分）と混合することによって生成され得る。従来の緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合にも採用され得る。特に、水分散性濃縮物（例えば、E C、S C、D C、O D、S E、E W、E O等）、水和剤及び顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えば、ホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート及びエトキシ化アルキルフェノール並びにエトキシ化脂肪族アルコールといった湿潤剤及び分散剤並びにアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有し得る。

20

【0234】

種子粉衣配合物は、種子にそれ自体公知の様式で適用され、例えば水性懸濁液又は種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で本発明の組み合わせ及び希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は、当技術分野で公知である。種子粉衣配合物は、単一種の有効成分を含有し得るか、又は例えば緩効性カプセル若しくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で有効成分の組み合わせを含有し得る。

【0235】

一般的に、配合物は、0.01～90重量%の活性薬剤、0～20%の農学的に許容可能な界面活性剤並びに10～99.99%の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも、実施形態1～43のいずれか1つに定義される式（I）の化合物から、コンポーネント（B）及び（C）並びに任意に他の活性薬剤、特に殺菌剤又は防腐剤等を一緒に伴って構成される。組成物の濃縮形態は、一般に、約2～80%、好ましくは約5～70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば、0.01～20重量%、好ましくは0.01～5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは、通常、希釈した配合物を利用することになる。

30

【0236】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは、通常、配合物を希釈して使用するであろう。

40

【実施例】

【0237】

以下の実施例は、本発明を例示するものである。本発明の特定の化合物は、低施用量でのより高い効力によって公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例に概説される実験手法を用いて当業者によって検証され得る。

【0238】

本記載全体を通して、温度は、摂氏度（℃）で示され、「m p .」は、融点を意味する。L C / M S は、液体クロマトグラフィー質量分析を意味し、装置及び方法の説明は、以下のとおりである。

【0239】

50

LC/MS装置及び方法は、以下のとおりである：

－ 方法A：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150℃、脱溶媒温度：350℃、コーンガス流：50 l/h、脱溶媒ガス流：650 l/h、質量範囲：100～900 Da）及びWaters製Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオードアレイ検出器及びELSD検出器を備えるWaters製の質量分光計（SQD、SQD II シングル四重極型質量分析計）で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60℃、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶媒勾配：A＝水＋5 % MeOH＋0.05 % HCOOH、B＝アセトニトリル＋0.05 % HCOOH、勾配：1.2分間で10～100 %のB；流量（ml/分）0.85。

－ 方法B：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリー：3.0 kV、コーン：30 V、抽出器：3.00 V、ソース温度：150℃、脱溶媒温度：400℃、コーンガス流：60 L/hr、脱溶媒ガス流：700 L/hr、質量範囲：140～800 Da）及びWaters Corporations製Acquity UPLC（溶媒脱気装置、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオードアレイ検出器を備える）を備えるWaters Corporations製のACQUITY質量分析計（SQD又はSQD II シングル四重極型質量分析計）で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60℃、DAD波長範囲（nm）：210～400、溶媒勾配：A＝水／メタノール9：1＋0.1 % ギ酸、B＝アセトニトリル＋0.1 % ギ酸、勾配：2.5分間で0～100 %のB；流量（ml/分）0.75。

【0240】

－ 方法1及び方法2：スペクトルは、以下に記載の装置の1つでそれに続く方法1又は2を使用して記録した：

－ DAD/ELSD Alltech 2000 ES及びAgilent LC/MSD VL (G1956B)、SL (G1956B) 質量分析計を備えたAgilent 1100シリーズのLC/MSDシステム。

－ DAD/ELSD Alltech 3300及びAgilent LC/MSD G6130A、G6120B質量分析計を備えたAgilent 1200シリーズのLC/MSDシステム。

－ DAD/ELSD Alltech 3300及びAgilent LC/MSD G6120B質量分析計を備えたAgilent Technologies 1260 Infinity LC/MSDシステム。

－ DAD/ELSD G7102A 1290 Infinity II及びAgilent LC/MSD G6120B質量分析計を備えたAgilent Technologies 1260 Infinity II LC/MSDシステム。

－ DAD/ELSD及びAgilent LC/MSD (G6120B) 質量分析計を備えたAgilent 1260シリーズのLC/MSDシステム。

－ DAD/ELSD及びAgilent LC/MSD (G6125B) 質量分析計を備えたUPLC Agilent 1290シリーズのLC/MSDシステム。

【0241】

方法1の詳細：

－ カラム：Agilent Poroshell 120 SB-C18 4.6×30 mm 2.7 µm

－ カラム温度：60℃

－ 移動相：A－水（0.1 % ギ酸）、B－アセトニトリル（0.1 % ギ酸）

－ 流量：3 ml/分

- － 勾配：0.01分－1%のB、1.5分－100%のB、1.73分－100%のB
- － MSイオン化モード：エレクトロスプレーイオン化（ESI）
- － MSスキャン範囲：83～600m/z
- － UV検出：215nm、254nm、280nm

【0242】

方法2の詳細：

- － カラム：Agilent Poroshell 120 SB-C18 4.6×30mm 2.7μm
- － 温度：60℃
- － 移動相：A－水（0.1%ギ酸）、B－アセトニトリル（0.1%ギ酸）
- － 流量：3mL/分
- － 勾配：0.01分－1%のB、1.5分－100%のB、2.2分－100%のB
- － MSイオン化モード：エレクトロスプレーイオン化（ESI）
- － MSスキャン範囲：83～1000m/z
- － UV検出：215nm、254nm、280nm

10

【0243】

¹H NMRスペクトルは、溶媒としてCDCl₃又はDMSO-d₆を、内部標準としてテトラメチルシランを使用して、Bruker 400MHz又はVarian Unity 400分光計で400MHzで記録した。化学シフトは標準（テトラメチルシラン＝0.00ppm）からの低磁場シフトがppmで報告され、結合定数はHzである。

20

【0244】

以下の表Aは、式（I）の化合物についてまとめたものである：

- － LC/MSデータ、例えば保持時間（RT）、[M+H]⁺及び方法の種類（方法A、方法B、方法1又は方法2）、及び／又は
- － 融点（mp）。

【0245】

30

40

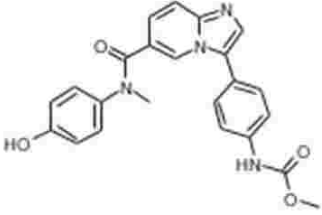
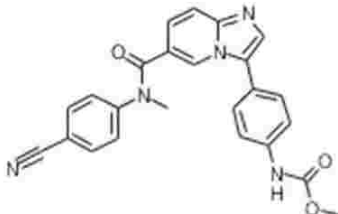
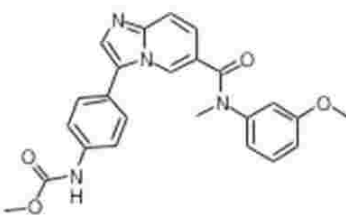
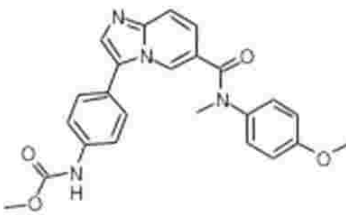
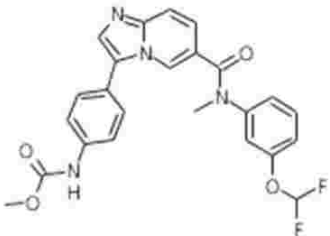
50

【表 2 - 1】

表 A:

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
1	3-(4-アセトアミドフェニル)- N-(4-クロロフェニル)-N-メ チル-イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-6-カルボキサミド		0.72	419	A	
2	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]フェニル]カルバ メート		0.76	435	A	
3	3-(6-アセトアミド-3-ピリジ ル)-N-(4-クロロフェニル)- N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-6-カルボキサミド		0.70	420	A	70 - 75
4	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート		0.75	436	A	85 - 90

【表 2 - 2】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
5	メチル N-[4-[6-[(4-ヒドロキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート		0.62	417	A	
6	メチル N-[4-[6-[(4-シアノフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート		0.69	426	A	95 - 98
7	メチル N-[4-[6-[(3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート		0.99	431.5	B	
8	メチル N-[4-[6-[(4-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート		0.95	431.5	B	
9	メチル N-[4-[6-[(3-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート		1.03	467.5	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 3】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] ⁺ (測定 値)	方法	mp (°C)
10	メチル N-[4-[6-[(3-エチル フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]フェニル]カルバ メート		1.12	429.6	B	
11	メチル N-[4-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]フェニル]カル バメート		0.95	419.5	B	
12	メチル N-[4-[6-[メチル-(2- メチル-4-ピリジル)カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]フェニル]カル バメート		0.63	416.2	B	
13	メチル N-[4-[6-[(3,4-ジメ チルフェニル)-メチル-カル バモイル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]フェニル]カ ルバメート		1.10	429.6	B	
14	メチル N-[4-[6-[(4-イソプ ロピルフェニル)-メチル-カ ルバモイル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]フェニル] カルバメート		1.22	443.6	B	

10

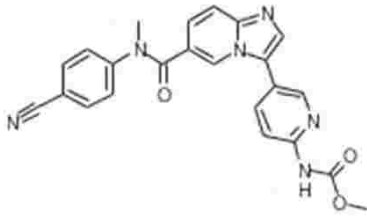
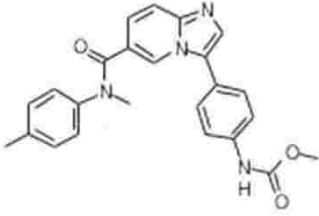
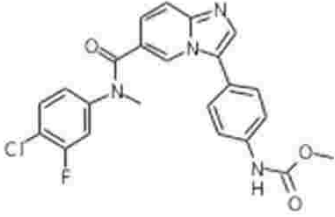
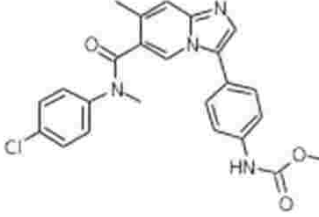
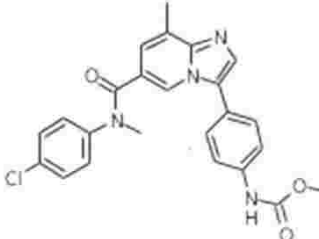
20

30

40

50

【表 2 - 4】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
15	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート		0.67	427	A	
16	メチル N-[4-[6-[メチル(p- トリル)カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フ ェニル]カルバメート		0.73	415	A	
17	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ 3-フルオロ-フェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		0.82	453	A	
18	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-7-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.02	449.1	B	103 - 108
19	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-8-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.07	449.1	B	105 - 110

10

20

30

40

50

【表 2 - 5】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
20	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-5-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.01	469.0	B	110 - 115
21	メチル N-[4-[5-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		1.27	469.0	B	125 - 130
22	メチル N-[4-[8-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		1.42	469.0	B	135 - 140
23	メチル N-[4-[7-クロロ-6- [(4-クロロフェニル)-メチル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		1.26	449.1	B	125 - 130
24	メチル N-[4-[6-[メチル(4- ピリジル)カルバモイル]イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]フェニル]カルバメート		0.52	402	A	

10

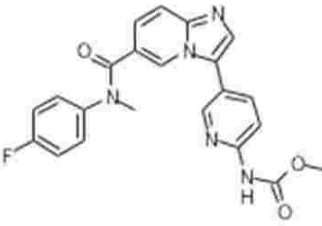
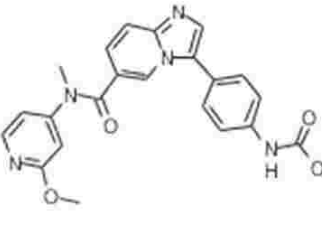
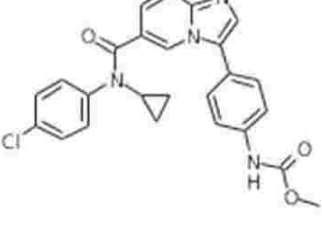
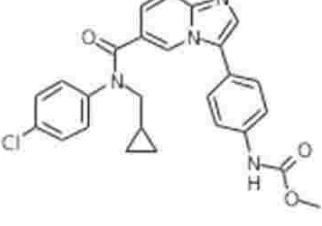
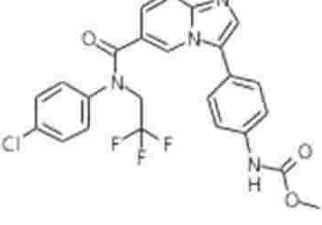
20

30

40

50

【表 2 - 6】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
25	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		0.84	420.2	B	124 - 132
26	メチル N-[4-[6-[(2-メトキ シ-4-ピリジル)-メチル-カ ルバモイル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]フェニル] カルバメート		0.67	433	A	
27	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-シクロプロピル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		0.81	462	A	
28	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-(シクロプロピルメ チル)カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		0.87	476	A	
29	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-(2,2,2-トリフルオ ロエチル)カルバモイル]イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]フェニル]カルバメート		0.86	503	A	

10

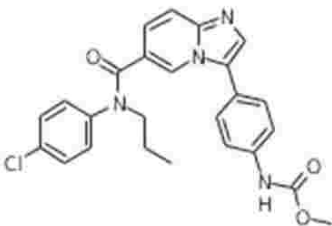
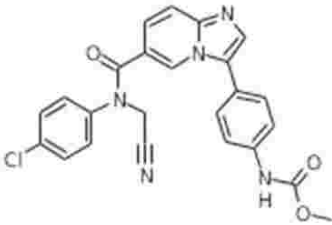
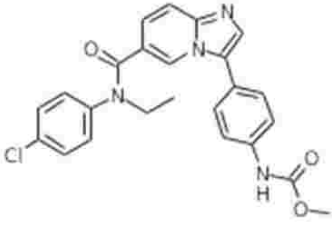
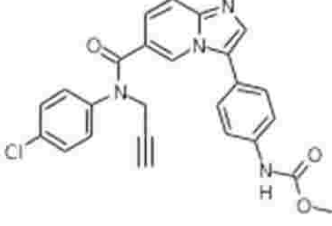
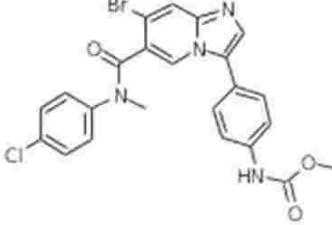
20

30

40

50

【表 2 - 7】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
30	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-プロピル-カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]フェニル]カル バメート		0.76	430	A	
31	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-(シアノメチル)カ ルバモイル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]フェニル] カルバメート		0.77	460	A	
32	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-エチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]フェニル]カルバ メート		0.80	449	A	
33	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-プロプ-2-イニル -カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		0.80	459	A	
34	メチル N-[4-[7-ブromo-6- [(4-クロロフェニル)-メチル カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		1.28	512.9	B	125 - 130

10

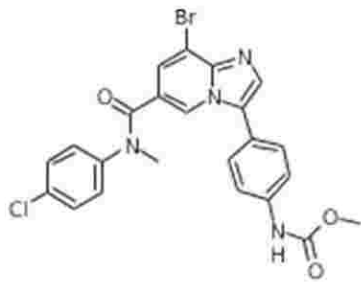
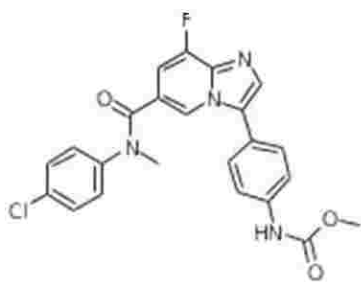
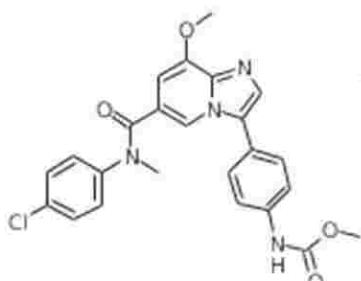
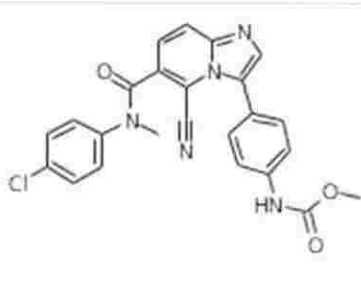
20

30

40

50

【表 2 - 8】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
35	メチル N-[4-[8-ブromo-6- [(4-クロロフェニル)-メチル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]フェニ ル]カルバメート		1.44	513.0	B	150 - 155
36	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-8-フルオロ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.39	453.1	B	140 - 145
37	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-8-メトキシ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.09	465.1	B	150 - 155
38	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-5-シアノ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.34	460.1	B	130 - 135

10

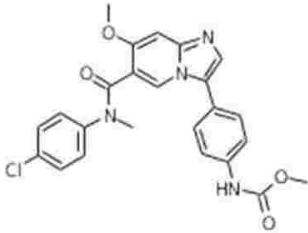
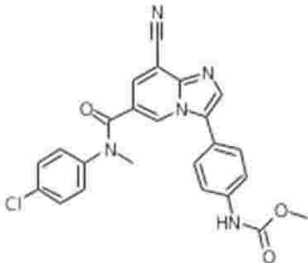
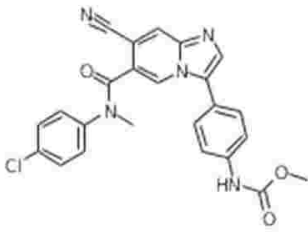
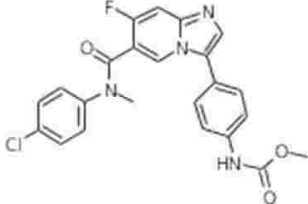
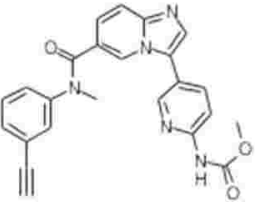
20

30

40

50

【表 2 - 9】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
39	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-7-メトキシ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.01	465.1	B	125 - 130
40	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-8-シアノ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.42	460.1	B	150 - 155
41	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-7-シアノ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.39	460.1	B	175 - 180
42	メチル N-[4-[6-[(4-クロロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]-7-フルオロ-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]フェ ニル]カルバメート		1.15	453.1	B	90 - 95
43	メチル N-[5-[6-[(3-エチニ ルフェニル)-メチル-カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		0.90	426.2	B	

10

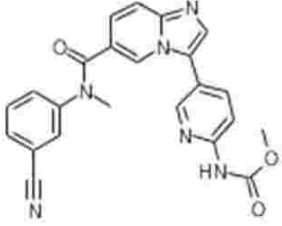
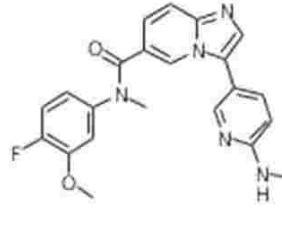
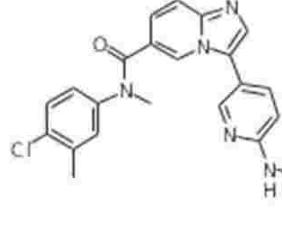
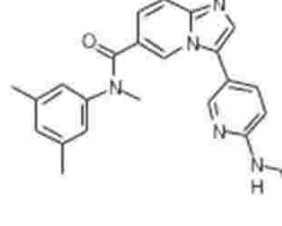
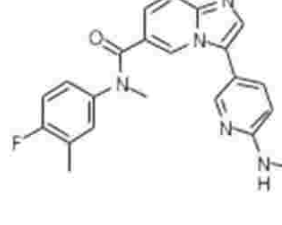
20

30

40

50

【表 2 - 1 0】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
44	メチル N-[5-[6-[(3-シアノ フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート		0.76	427.2	B	
45	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシ-フェニル)-メ チル-カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート		0.87	450.2	B	208 - 210
46	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ 3-メチル-フェニル)-メチル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		1.04	450.2	B	
47	メチル N-[5-[6-[(3,5-ジメ チルフェニル)-メチル-カル バモイル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		1.01	430.2	B	
48	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メチル-フェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.94	434.2	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 1】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
49	メチル N-[5-[6-[メチル-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.01	470.2	B	
50	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジフルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.89	438.2	B	210 - 214
51	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.82	457.2	B	
52	メチル N-[5-[6-[(3-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.85	420.2	B	
53	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ-3-メチルフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.86	441.2	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 2】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
54	メチル N-[5-[6-[メチル(m-トリル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.92	416.2	B	
55	メチル N-[5-[6-[(5-メトキシ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.67	433.2	B	206 - 209
56	メチル N-[5-[6-[メチル-(5-メチル-3-ピリジル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.65	417.2	B	
57	メチル N-[5-[6-[[3-(ジフルオロメチル)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.89	452.2	B	180 - 183
58	メチル N-[5-[6-[(3,5-ジメトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.90	462.2	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 3】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
59	メチル N-[5-[6-[(3-メトキシ-5-メチル-フェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.95	446.2	B	
60	メチル N-[5-[6-[(6-フルオロ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.69	421.2	B	
61	メチル N-[5-[6-[メチル(フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.88	402.5	B	
62	メチル N-[5-[6-[(3-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.00	436.1	B	
63	メチル N-[5-[6-[(3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.92	432.4	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 4】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
64	メチル N-[5-[6-[メチル(p-トリル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.98	416.4	B	
65	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジメチルフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.06	430.5	B	
66	メチル N-[5-[6-[[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.98	468.4	B	
67	メチル N-[5-[6-[(6-メトキシ-3-ピリジル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.82	433.3	B	
68	メチル N-[5-[6-[(4-ブロモフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.03	480.1	B	

10

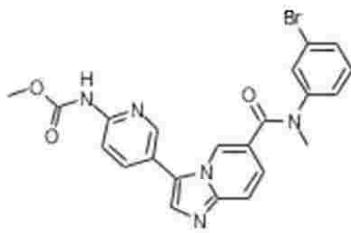
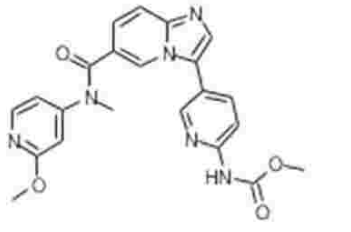
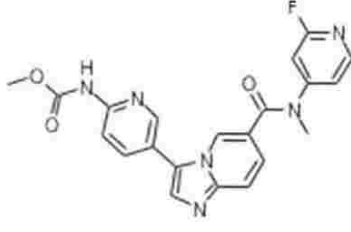
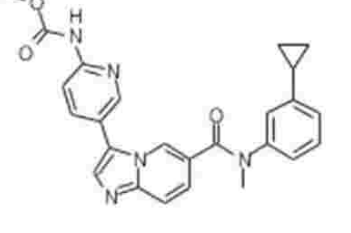
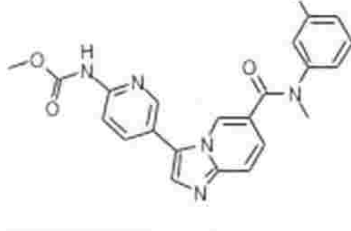
20

30

40

50

【表 2 - 1 5】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
69	メチル N-[5-[6-[(3-ブロモフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.02	480.1	B	
70	メチル N-[5-[6-[(2-メトキシ-4-ピリジル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.84	433.2	B	
71	メチル N-[5-[6-[(2-フルオロ-4-ピリジル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.77	421.1	B	
72	メチル N-[5-[6-[(3-シクロプロピルフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.08	442.5	B	
73	メチル N-[5-[6-[(3-ヨードフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.06	528.3	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 6】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
74	メチル N-[5-[6-[[3-(2,2-ジフルオロエチル)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.74	466	A	
75	メチル N-[5-[6-[[4-クロロ-3-メトキシ-フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.77	466	A	
76	メチル N-[5-[6-[[4-フルオロフェニル]-(2-メトキシエチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.71	464	A	
77	メチル N-[5-[6-[[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.72	494	A	
78	N-(4-フルオロ-3-メチル-フェニル)-N-メチル-3-[6-(プロパノイルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド		0.76	432	A	

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 7】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
79	N-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)-3-[6-[[メトキシ(メ チル)カルバモイル]アミノ]- 3-ピリジル]-N-メチル-イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カル ボキサミド		0.73	479	A	
80	N-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)-N-メチル-3-[4- (メチルカルバモイルアミノ) フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-6-カルボキサミド		0.64	448	A	
81	N-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)-N-メチル-3-[6- (メチルカルバモイルアミノ)- 3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-6-カルボキサミド		0.65	449	A	
82	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]-8-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.90	434.5	B	140 - 145
83	メチル N-[5-[8-シクロプロ ピル-6-[(4-フルオロフェニ ル)-メチル-カルバモイル] イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート		1.01	460.6	B	210 - 215

10

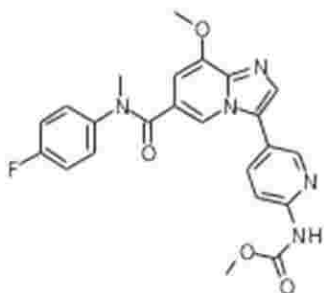
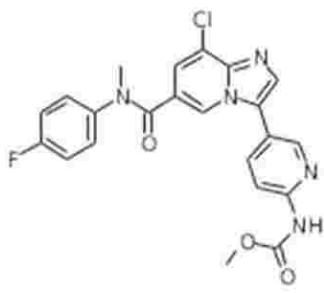
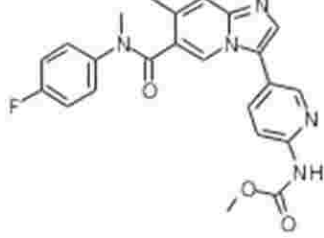
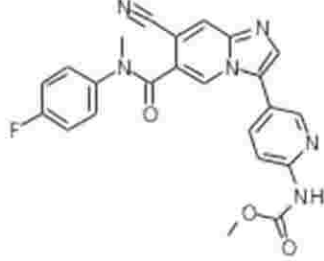
20

30

40

50

【表 2 - 1 8】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
84	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]-8-メトキシ-イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート		0.93	450.5	B	200 - 205
85	メチル N-[5-[8-クロロ-6- [(4-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		1.20	454.5	B	120 - 125
86	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]-7-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.83	434.5	B	180 - 185
87	メチル N-[5-[7-シアノ-6- [(4-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		1.15	445.5	B	215 - 220

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 9】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
88	3-[6-(ジメチルカルバモイル ルアミノ)-3-ピリジル]-N- (4-フルオロ-3-メトキシフ ェニル)-N-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキ サミド		0.66	463	A	102 - 105
89	メチル N-[5-[6-(シアノメチ ル-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)カルバモイル]イ ミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]-2-ピリジル]カルバメー ト		0.71	475	A	
90	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ 3-メトキシフェニル)-(シア ノメチル)カルバモイル]イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]-2-ピリジル]カルバメー ト		0.75	491	A	
91	メチル 2-(4-フルオロ-3-メ トキシ-N-[3-[6-(メトキシカ ルボニルアミノ)-3-ピリジ ル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 6-カルボニル]アニリノ)アセ テート		0.73	508	A	
92	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-(メ チルスルホニルメチル)カル バモイル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		0.67	528	A	

10

20

30

40

50

【表 2 - 20】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
93	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-(メ トキシメチル)カルバモイル] イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート		0.74	480	A	65 - 72
94	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-(メ トキシメチル)カルバモイ ル]-8-メチル-イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		0.96	494.6	B	90 - 95
95	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-メ チル-カルバモイル]-8-メチ ル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート		0.92	464.5	B	160 - 165
96	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-ヒドロキシフェニル)- メチル-カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート		0.62	436	A	185 - 200
97	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)- [2-(メチルアミノ)-2-オキソ エチル]カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート		0.61	507	A	

10

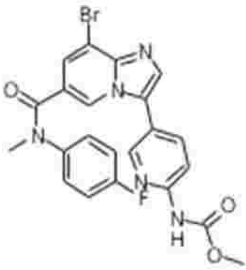
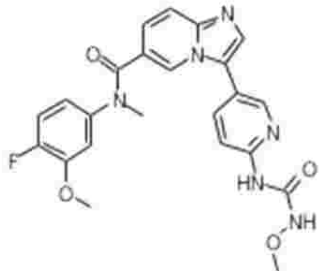
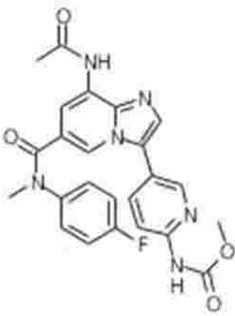
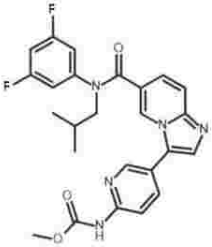
20

30

40

50

【表 2 - 2 1】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
98	メチル N-[5-[8-ブロモ-6- [(4-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.84	498	A	
99	N-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)-3-[6-(メトキシカ ルバモイルアミノ)-3-ピリジ ル]-N-メチル-イミダゾ[1,2- a]ピリジン-6-カルボキサミ ド		0.63	465	A	
100	メチル N-[5-[8-アセトアミド -6-[(4-フルオロフェニル)- メチル-カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート		0.78	477	A	
101	メチル N-[5-[6-[(3,5-ジフ ルオロフェニル)-イソブチル -カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.98	480.2	2	

10

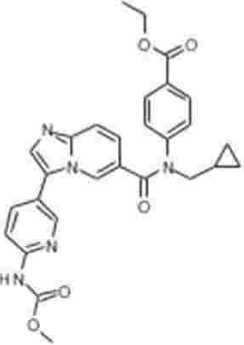
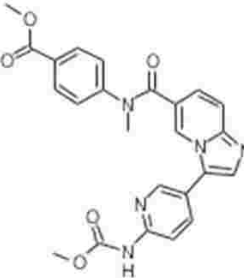
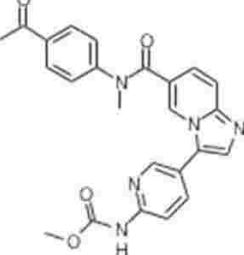
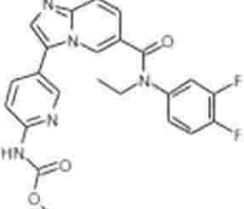
20

30

40

50

【表 2 - 2 2】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
102	エチル 4-[シクロプロピルメチル-3-[6-(メキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]アミノ]ベンゾエート		1.24	514.0	1	
103	メチル 4-[[3-[6-(メキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]-メチル-アミノ]ベンゾエート		0.71	460.2	1	
104	メチル N-[5-[6-[(4-アセチルフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.66	444.2	1	
105	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジフルオロフェニル)-エチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.11	452.0	1	

10

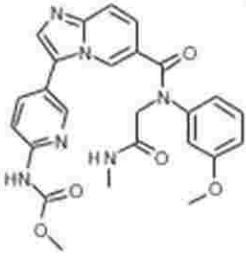
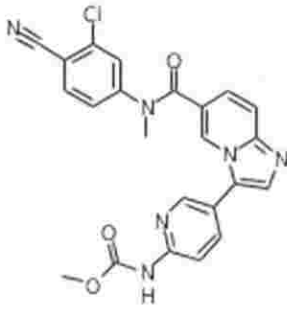
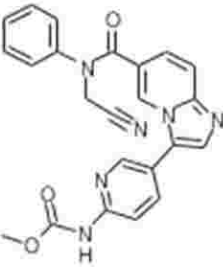
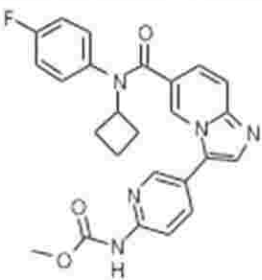
20

30

40

50

【表 2 - 2 3】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
106	メチル N-[5-[6-[(3-メトキシフェニル)-2-(メチルアミノ)-2-オキソエチル]カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.62	489.2	1	
107	メチル N-[5-[6-[(3-クロロ-4-シアノフェニル)-メチルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.73	461.2	1	
108	メチル N-[5-[6-[シアノメチル(フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.69	427.2	1	
109	メチル N-[5-[6-[シクロブチル-(4-フルオロフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.84	460.2	1	

10

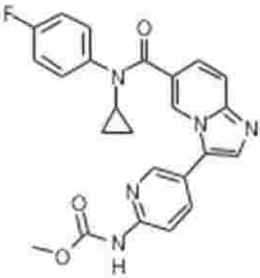
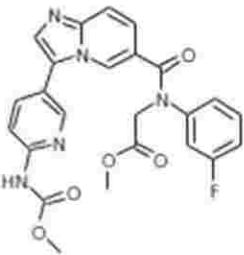
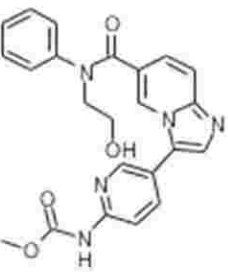
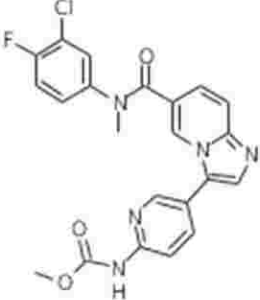
20

30

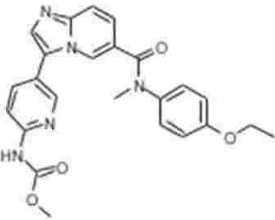
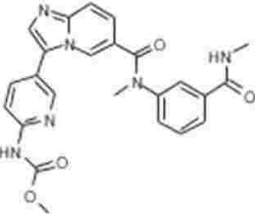
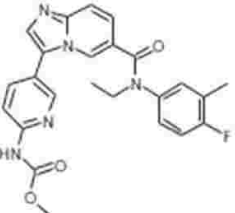
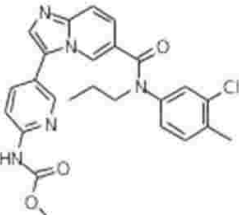
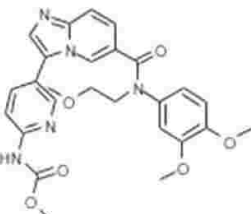
40

50

【表 2 - 2 4】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
110	メチル N-[5-[6-[シクロプロ ピル-(4-フルオロフェニル) カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		0.76	446.2	1	
111	メチル 2-(3-フルオロ-N- [3-[6-(メトキシカルボニル アミノ)-3-ピリジル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボニ ル]アニリノ)アセテート		0.85	478.2	1	
112	メチル N-[5-[6-[2-ヒドロキ シエチル(フェニル)カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート		0.88	432.2	1	
113	メチル N-[5-[6-[(3-クロロ 4-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		1.09	454.2	1	

【表 2 - 2 5】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
114	メチル N-[5-[6-[(4-エトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.09	446.2	1	
115	メチル N-[5-[6-[メチル-(3-(メチルカルバモイル)フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.88	459.2	1	
116	メチル N-[5-[6-[エチル-(4-フルオロ-3-メチル-フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.16	448.2	1	
117	メチル N-[5-[6-[(3-クロロ-4-メチル-フェニル)-プロピル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.28	478.2	1	
118	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジメトキシフェニル)-(2-メトキシエチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.01	506.2	1	

10

20

30

40

50

【表 2 - 2 6】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
119	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジメトキシフェニル)-エチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.01	476.2	1	
120	メチル N-[5-[6-[シクロプロピルメチル-(3-フルオロ-4-メチルフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.24	474.2	1	
121	メチル N-[5-[6-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.99	504.2	1	
122	エチル 3-[エチル-[3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]アミノ]ベンゾエート		0.82	488.2	1	

10

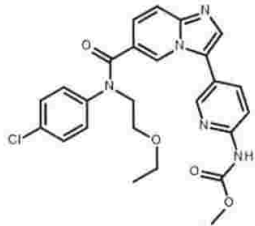
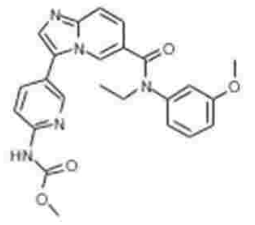
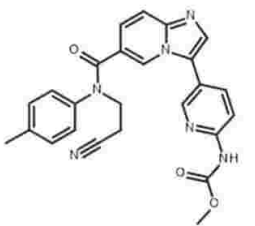
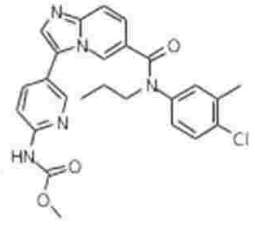
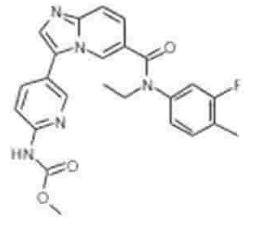
20

30

40

50

【表 2 - 2 7】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
123	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ フェニル)-(2-エトキシエチ ル)カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		1.16	494.0	1	
124	メチル N-[5-[6-[エチル- (3-メトキシフェニル)カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		1.10	446.2	1	
125	メチル N-[5-[6-[2-シアノエ チル(p-トリル)カルバモイ ル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート		1.08	455.2	1	
126	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ- 3-メチルフェニル)-プロピ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.93	478.0	1	
127	メチル N-[5-[6-[エチル- (3-フルオロ-4-メチルフェ ニル)カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.82	448.2	1	

10

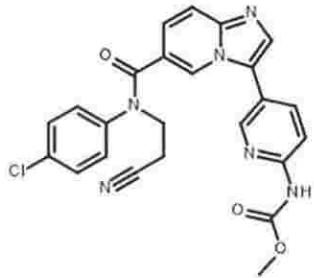
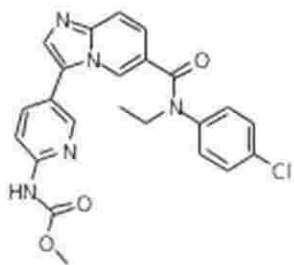
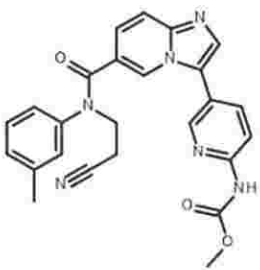
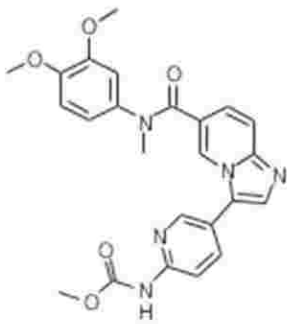
20

30

40

50

【表 2 - 2 8】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
128	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ フェニル)-(2-シアノエチル) カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		0.83	475.2	2	
129	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ フェニル)-エチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート					
130	メチル N-[5-[6-[2-シアノエ チル(m-トリル)カルバモイ ル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート		1.01	455.3	1	
131	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジメ キシフェニル)-メチル-カル バモイル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート		0.94	462.1	1	

10

20

30

40

50

【表 2 - 2 9】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
132	メチル N-[5-[6-[2-シアノエチル-(4-フルオロフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.88	459.2	2	
133	メチル N-[5-[6-[シクロプロピルメチル-(4-メトキシフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.90	472.2	2	
134	メチル N-[5-[6-[イソブチル(フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.93	444.2	2	
135	メチル N-[5-[6-[(3,5-ジメチルフェニル)-エチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.18	444.2	1	

10

20

30

40

50

【表 2 - 3 0】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
136	メチル N-[5-[6-[エチル-(4-フルオロフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.09	434.2	1	
137	メチル N-[5-[6-[エチル(フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.04	416.2	1	
138	メチル N-[5-[6-[[2-(ジメチルアミノ)-2-オキソエチル]-フェニル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.99	473.1	1	
139	メチル N-[5-[6-[シクロプロピルメチル-(3-フルオロフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.18	460.2	1	

【表 2 - 3 1】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
140	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-イソプロピル- カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		1.10	448.2	1	
141	メチル N-[5-[6-[(3-シアノ フェニル)-エチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート		1.04	441.2	1	
142	メチル N-[5-[6-[(シアノメチ ル-(4-メトキシフェニル)カ ルバモイル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジ ル]カルバメート		1.04	457.2	1	
143	メチル N-[5-[6-[(シアノメチ ル(p-トリル)カルバモイル] イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート		1.05	441.2	1	

10

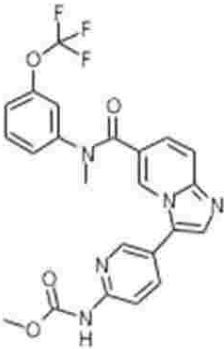
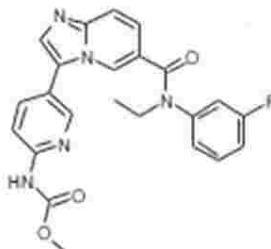
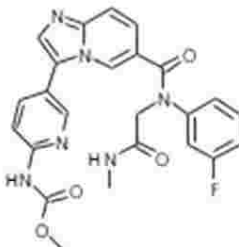
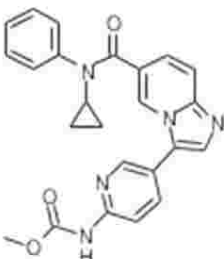
20

30

40

50

【表 2 - 3 2】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
144	メチル N-[5-[6-[メチル-[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.16	486.0	1	
145	メチル N-[5-[6-[エチル-(3-フルオロフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.06	434.2	1	
146	メチル N-[5-[6-[(3-フルオロフェニル)-2-(メチルアミノ)-2-オキソ-エチル]カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.95	477.2	1	
147	メチル N-[5-[6-[シクロプロピル(フェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		0.92	428.0	1	

10

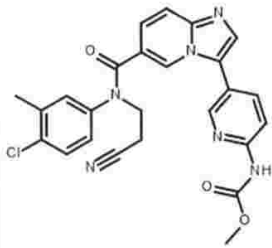
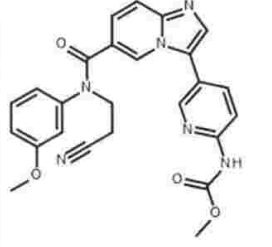
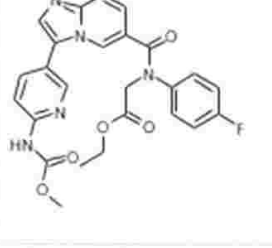
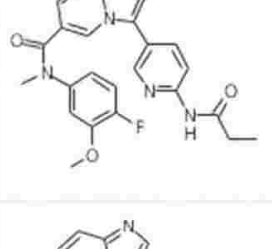
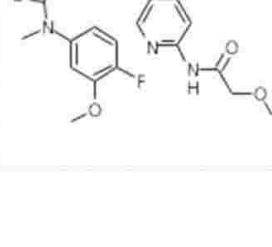
20

30

40

50

【表 2 - 3 3】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
148	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ-3-メチルフェニル)-(2-シアノエチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.13	489.2	1	
149	メチル N-[5-[6-[2-シアノエチル-(3-メトキシフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート		1.03	471.2	1	
150	エチル 2-(4-フルオロ-N-[3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]アニリノ)アセテート		0.86	492.2	2	
151	N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-3-[6-(プロパノイルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					135 - 137
152	N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-3-[6-[(2-メトキシアセチル)アミノ]-3-ピリジル]-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					140 - 142

10

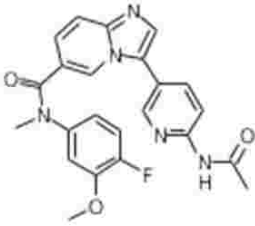
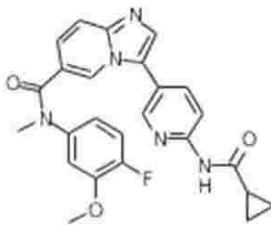
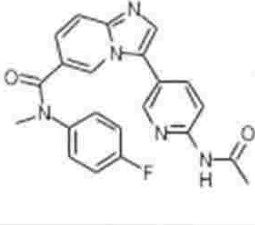
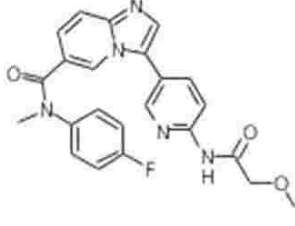
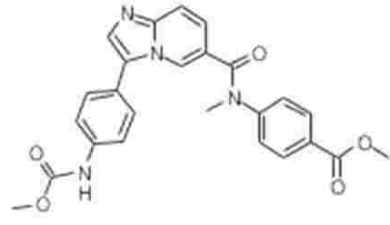
20

30

40

50

【表 2 - 3 4】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
153	3-(6-アセトアミド-3-ピリジル)-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					120 - 122
154	3-[6-(シクロプロパンカルボニルアミノ)-3-ピリジル]-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					106 - 108
155	3-(6-アセトアミド-3-ピリジル)-N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					196 - 198
156	N-(4-フルオロフェニル)-3-[6-[(2-メトキシアセチル)アミノ]-3-ピリジル]-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					155 - 157
157	メチル 4-[[3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]-メチル-アミノ]ベンゾエート		0.97	459.5	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 3 5】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
158	メチル N-[4-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-メ チルカルバモイル]イミダゾ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フ ェニル]カルバメート		0.70	449	A	208 - 210
159	メチル N-[5-[6-[メチル-(4- メチルスルファニルフェニ ル)カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.95	448.2	B	
160	メチル N-[5-[6-[メチル-(3- メチルスルファニルフェニ ル)カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.95	448.2	B	
161	メチル N-[5-[6-[メチル-(4- メチルスルホニルフェニル) カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		0.66	480.2	B	
162	メチル N-[5-[6-[メチル-(3- メチルスルホニルフェニル) カルバモイル]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート		0.66	480.2	B	

10

20

30

40

50

【表 2 - 3 6】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
163	メチル N-[5-[6-[メチル-[4-(メチルカルバモイル)フェニ ル]カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート		0.63	459.2	B	
164	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モチオイル]イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジ ル]カルバメート		0.77	435	A	
165	3-[6-(シクロプロパンカル ボニルアミノ)-3-ピリジル]- N-(4-フルオロフェニル)-N- メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-6-カルボキサミド					143 - 145
166	N-(4-フルオロフェニル)-N- メチル-3-[6-(プロパノイル アミノ)-3-ピリジル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキ サミド					
167	3-(6-アセトアミド-3-ピリジ ル)-N-(4-フルオロ-3-メト キシ-フェニル)-N,8-ジメチ ル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 6-カルボキサミド					180 - 182

10

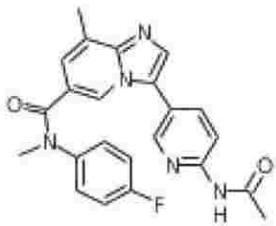
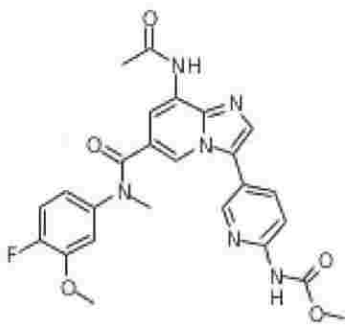
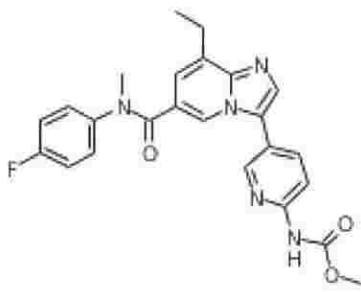
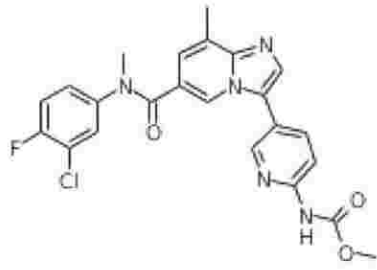
20

30

40

50

【表 2 - 3 7】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
168	3-(6-アセトアミド-3-ピリジル)-N-(4-フルオロフェニル)-N,8-ジメチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド					178 - 180
169	メチル N-[5-[8-アセトアミド-6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					216 - 218
170	メチル N-[5-[8-エチル-6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					183 - 185
171	メチル N-[5-[6-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					147 - 149

10

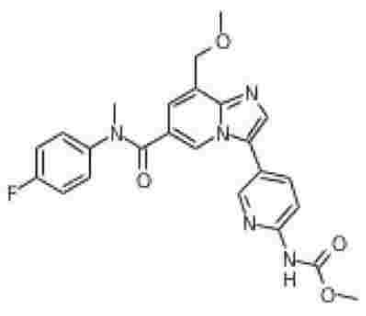
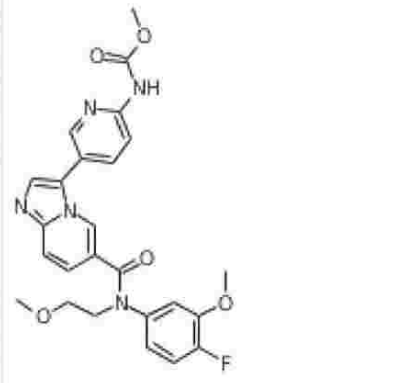
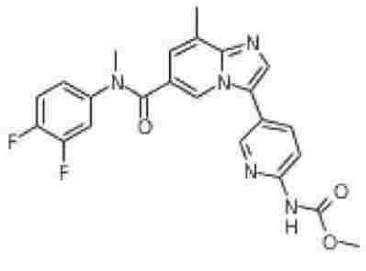
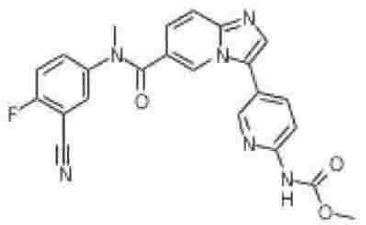
20

30

40

50

【表 2 - 3 8】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
172	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]-8-(メキシメチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					191 - 193
173	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)- (2-メトキシエチル)カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート					172 - 175
174	メチル N-[5-[6-[(3,4-ジフ ルオロフェニル)-メチル-カ ルバモイル]-8-メチル-イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]-2-ピリジル]カルバメ ート					138 - 140
175	メチル N-[5-[6-[(3-シアノ 4-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート					243 - 245

10

20

30

40

50

【表 2 - 3 9】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
176	エチル 2-フルオロ-5-[[3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニル]-メチル-アミノ]ベンゾエート					136 - 138
177	メチル N-[5-[6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-(2-メトキシエチル)カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					159 - 162
178	メチル N-[5-[6-[エチル-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					145 - 148

10

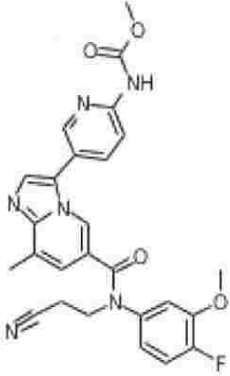
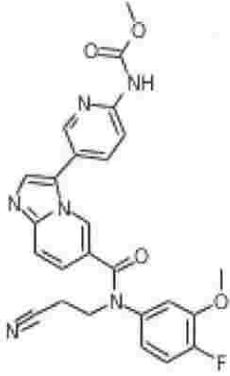
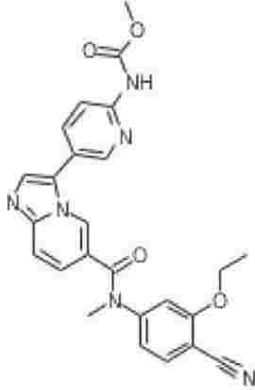
20

30

40

50

【表 2 - 4 0】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
179	メチル N-[5-[6-[2-シアノエチル-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					152 - 154
180	メチル N-[5-[6-[2-シアノエチル-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					134 - 137
181	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ-3-エトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					212 - 216

10

20

30

40

50

【表 2 - 4 1】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
182	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシフェニル)-プ ロプ-2-イニル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート					161 - 163
183	メチル N-[5-[6-[シクロプロ ピル-(4-フルオロ-3-メトキ シフェニル)カルバモイル] イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					112 - 114
184	メチル N-[5-[6-[(4-クロロ- 3-メトキシフェニル)-メチ ル-カルバモイル]-8-メチル -イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					196 - 199

10

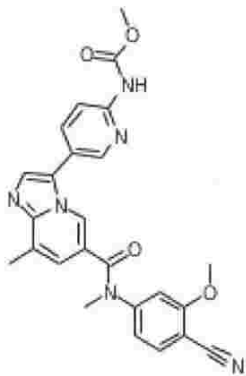
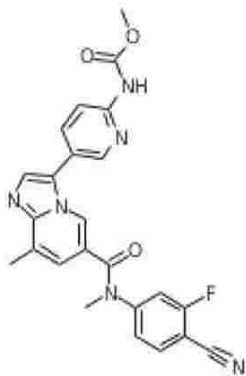
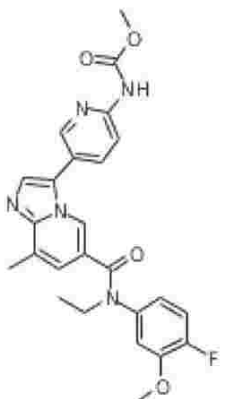
20

30

40

50

【表 2 - 4 2】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
185	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ 3-メトキシフェニル)-メチ ル-カルバモイル]-8-メチル -イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					197 - 199
186	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ 3-フルオロフェニル)-メチ ル-カルバモイル]-8-メチル -イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					205 - 207
187	メチル N-[5-[6-[エチル (4-フルオロ-3-メトキシフ ェニル)カルバモイル]-8-メ チル-イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート					119 - 121

10

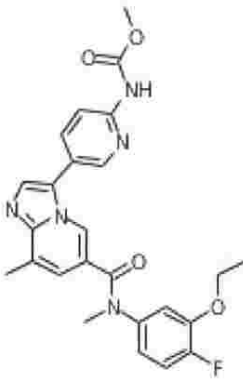
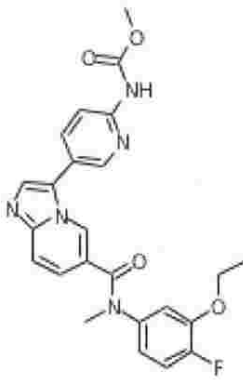
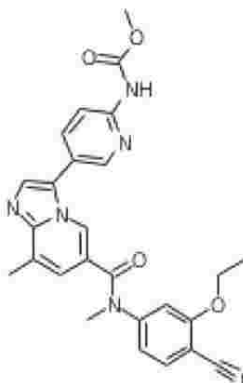
20

30

40

50

【表 2 - 4 3】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
188	メチル N-[5-[6-[(3-エトキシ-4-フルオロ-フェニル)-メチル-カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					182 - 185
189	メチル N-[5-[6-[(3-エトキシ-4-フルオロ-フェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					182 - 184
190	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ-3-エトキシ-フェニル)-メチル-カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					219 - 222

10

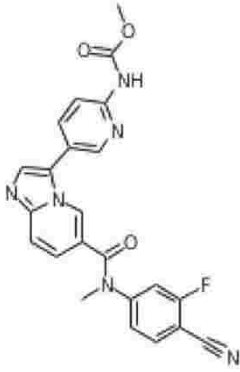
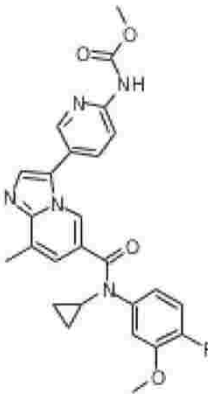
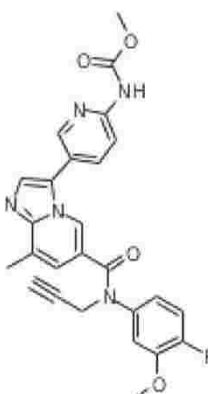
20

30

40

50

【表 2 - 4 4】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] ⁺ (測定 値)	方法	mp (°C)
191	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ 3-フルオロ-フェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート					232 - 234
192	メチル N-[5-[6-[シクロプロ ピル-(4-フルオロ-3-メトキ シ-フェニル)カルバモイル]- 8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート					114 - 117
193	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシ-フェニル)-ブ ロブ-2-イニル-カルバモイ ル]-8-メチル-イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-イル]-2-ピリ ジル]カルバメート					168 - 170

10

20

30

40

50

【表 2 - 4 5】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] ⁺ (測定 値)	方法	mp (°C)
194	メチル N-[5-[8-エチル-6- [(4-フルオロ-3-メトキシフ ェニル)-メチル-カルバモイ ル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート					168 - 170
195	メチル N-[5-[8-(シクロプロ ピルメチル)-6-[(4-フルオロ フェニル)-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート					176 - 178
196	メチル N-[5-[6-[(3-シアノ 4-フルオロ-フェニル)-メチ ル-カルバモイル]-8-メチル -イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル]-2-ピリジル]カルバメ ート					133 - 135
197	エチル 2-フルオロ-5-[[3- [6-(メトキシカルボニルアミ ノ)-3-ピリジル]-8-メチル- イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6- カルボニル]-メチル-アミノ] ベンゾエート					124 - 126

10

20

30

40

50

【表 2 - 4 6】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
198	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシ-フェニル)-メ チル-カルバモイル]-8-(メト キシメチル)イミダゾ[1,2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジ ル]カルバメート					180 - 182
199	メチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-(メチルカルバモイル) フェニル)-メチル-カルバモ イル]-8-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート					117 - 119
200	メチル N-[5-[8-シクロプロ ピル-6-[(4-フルオロ-3-メト キシ-フェニル)-メチル-カル バモイル]イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート					237 - 239
201	メチル N-[5-[8-(シクロプロ ピルメチル)-6-[(4-フルオロ -3-メトキシ-フェニル)-メチ ル-カルバモイル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート					218 - 220

10

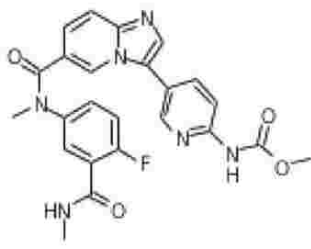
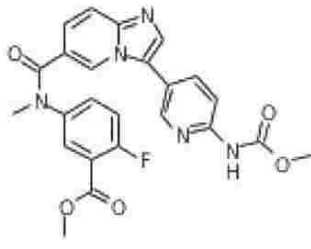
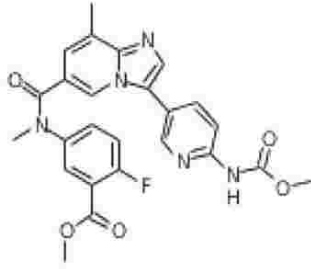
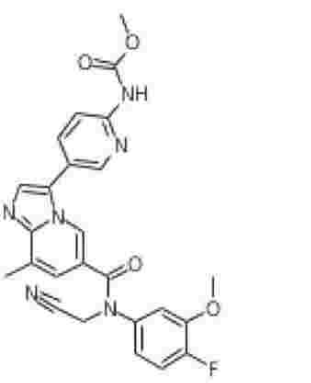
20

30

40

50

【表 2 - 4 7】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
202	メチル N-[5-[6-[4-フルオ ロ-3-(メチルカルバモイル) フェニル]-メチル-カルバモ イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル]-2-ピリジル]カ ルバメート					220 - 222
203	メチル 2-フルオロ-5-[[3- [6-(メトキシカルボニルアミ ノ)-3-ピリジル]イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボニ ル]-メチル-アミノ]ベンゾエ ート					138 - 140
204	メチル 2-フルオロ-5-[[3- [6-(メトキシカルボニルアミ ノ)-3-ピリジル]-8-メチル- イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6- カルボニル]-メチル-アミノ] ベンゾエート					151 - 153
205	メチル N-[5-[6-[シアノメチ ル-(4-フルオロ-3-メトキシ フェニル)カルバモイル]- 8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピ リジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート					159 - 162

10

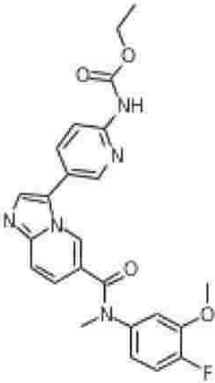
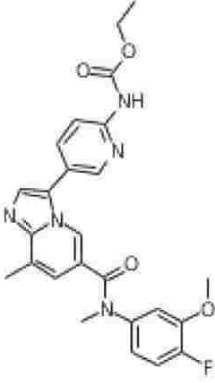
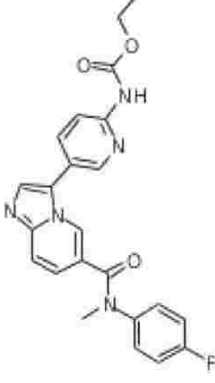
20

30

40

50

【表 2 - 4 8】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
206	エチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシ-フェニル)-メ チル-カルバモイル]イミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]- 2-ピリジル]カルバメート					191 - 193
207	エチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロ-3-メトキシ-フェニル)-メ チル-カルバモイル]-8-メチ ル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 3-イル]-2-ピリジル]カルバ メート					181 - 183
208	エチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-3-イル]-2-ピリジル] カルバメート					123 - 125

10

20

30

40

50

【表 2 - 4 9】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
209	エチル N-[5-[6-[(4-フルオ ロフェニル)-メチル-カルバ モイル]-8-メチル-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル]-2- ピリジル]カルバメート					108 - 111
210	エチル N-[5-[6-[(2-メトキ シ-4-ピリジル)-メチル-カ ルバモイル]-8-メチル-イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]-2-ピリジル]カルバメー ト					231 - 233
211	メチル N-[5-[6-[(2-メトキ シ-4-ピリジル)-メチル-カ ルバモイル]-8-メチル-イミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イ ル]-2-ピリジル]カルバメー ト					161 - 163

10

20

30

40

50

【表 2 - 5 0】

番号	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (測定 値)	方法	mp (°C)
212	メチル N-[5-[6-[(4-シアノ-3-メチルフェニル)-メチルカルバモイル]-8-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					132 - 135
213	メチル N-[5-[8-アミノ-6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート					

10

20

【0246】

化合物129は、Brucker AVANCE III 400MHzでNMRによって明確に特性評価した。

30

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 10.48 (s, 1H), 8.40 (d, $J=2.3$ Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.02 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.74 (dd, $J=8.7, 2.5$ Hz, 1H), 7.50 (d, $J=9.4$ Hz, 1H), 7.39-7.32 (m, 4H), 7.14 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 3.87 (q, $J=7.1, 7.1$, 2H), 3.74 (s, 3H), 1.09 (t, $J=7.0, 7.0$ Hz, 3H).

【0247】

化合物166は、Brucker AVANCE III 400MHzでNMRによって明確に特性評価した。

40

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 1.08-1.33 (t, 3H), 2.43-2.48 (q, 2H), 3.35-3.39 (s, 3H), 7.05-7.22 (m, 3H), 7.35-7.41 (m, 2H), 7.50 (d, $J=9.4$ Hz, 1H), 7.77-7.82 (m, 2H), 8.26 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.41 (d, $J=2.0$ Hz, 1H), 10.66 (s, 1H).

【0248】

化合物213は、Brucker AVANCE III 400MHzでNMRによって明確に特性評価した。

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 10.34 (s, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.47-7.58 (m, 2H), 7.41 (s

50

, 1 H), 7.15–7.20 (m, 1 H), 6.93–7.0 (m, 1 H), 6.56–6.61 (m, 1 H), 6.27 (s, 1 H), 5.75 (br s, 2 H), 3.64 (app s, 6 H), 3.25 (s, 3 H).

【0249】

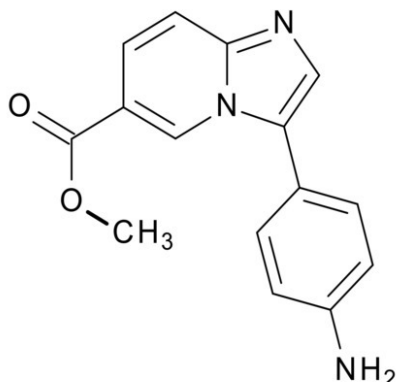
実施例1：この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート（化合物11）の調製を例示する。

【0250】

ステップ1：メチル3-(4-アミノフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

10

【化30】



20

メチル3-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート（1000 mg、3.80 mmol、1.00当量）及び（4-アミノフェニル）ボロン酸塩酸塩（893 mg、4.94 mmol、1.30当量）をジオキサン（57 mL）及び水（5.7 mL）に溶解して、黄色溶液を得た。炭酸セシウム（3130 mg、9.51 mmol、2.50当量）を添加し、混合物をアルゴン気流で5分間パージした。次いで、CATACX IUM (R) Pd G3（146 mg、0.190 mmol、0.05当量）を添加し、反応混合物を80℃で一晩加熱した。混合物を冷却し、酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理した。目的の物質を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を水、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ（酢酸エチル／MeOH）により精製することで、メチル3-(4-アミノフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートをベージュ色の固体として得た。

30

LC/MS（方法A）保持時間=0.40分；[M+H]⁺=268

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）δ：9.01 (dd, J=1.1, 1.8 Hz, 1 H), 7.75–7.71 (m, 1 H), 7.68 (s, 1 H), 7.67–7.64 (m, 1 H), 7.38–7.33 (m, 2 H), 6.89–6.84 (m, 2 H), 3.94 (s, 3 H), 3.93–3.88 (br s, 2 H).

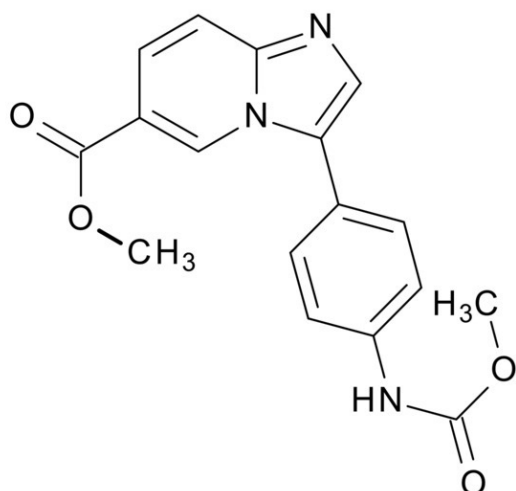
40

【0251】

ステップ2：メチル3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

50

【化 3 1】



10

メチル 3- (4-アミノフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (905 mg、3.22 mmol、1.00 当量) とピリジン (1280 mg、1.31 mL、16.1 mmol、5.00 当量) との混合物を酢酸エチル (36 mL) に溶解した。クロロギ酸メチル (614 mg、0.502 mL、6.43 mmol、3.00 当量) を 20~25℃ で滴下し、混合物を室温でさらに 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を NaHCO₃ の飽和溶液で処理した。形成された析出物を濾過し、水及び酢酸エチルで洗浄することで、メチル 3- [4- (メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

20

LC/MS (方法 A) 保持時間 = 0.66 分; [M+H]⁺ = 326

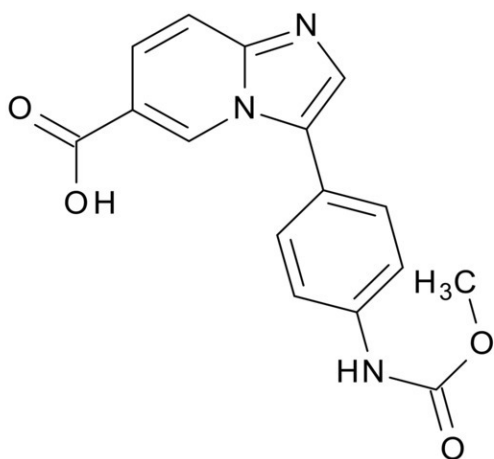
¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 9.92 (br s, 1H), 8.95–8.91 (m, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.76–7.71 (m, 1H), 7.71–7.65 (m, 3H), 7.64–7.59 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.72 (s, 3H).

30

【0252】

ステップ 3: 3- [4- (メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸の調製

【化 3 2】



40

メチル 3- [4- (メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (818 mg、2.34 mmol、1.00 当量) を THF/水 3:1 (40 mL) に溶解した。次いで、水酸化リチウム (150 mg、3.51

50

mmol、1.50当量)を添加し、混合物を室温で4時間攪拌した。その後、混合物を水(10mL)で希釈し、THFを減圧留去した。残渣を2NのHClで酸性にしてpHを4にした。懸濁液を濾過し、得られた固体を水で洗浄し、真空乾燥することで、3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。

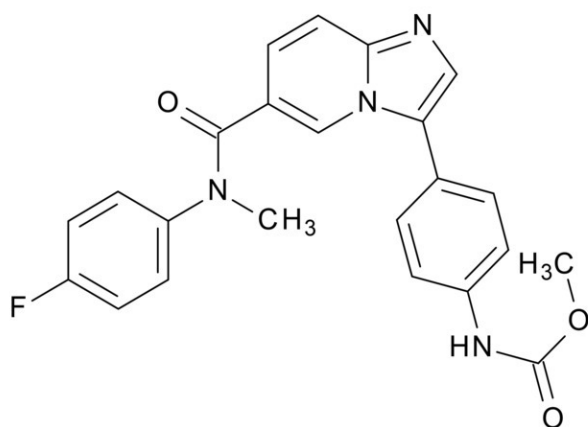
LC/MS (方法A) 保持時間=0.32分; $[M+H]^+=310$

1H NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ 13.75-12.89 (br s, 1H), 9.89 (br s, 1H), 8.93 (t, $J=1.1$ Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.74-7.67 (m, 3H), 7.64-7.58 (m, 2H), 3.72 (s, 3H)。

[0253]

ステップ4: メチルN-[4-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートの調製

[化33]



ジメチルアセトアミド(0.24mL)中の3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸(0.042mmol、1当量)の溶液にN-メチル-4-フルオロアニリン(0.084mmol、2当量)のジメチルアセトアミド(0.40mL)溶液、ジイソプロピルエチルアミン(0.252mmol、6.0当量)溶液及びビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィン酸クロリド(BOP-Cl)(0.105mmol、2.5当量)の溶液を添加した。バイアルを密閉し、70℃で16時間攪拌した。全ての揮発性物質を減圧留去し、得られたスラリーをメタノール(1mL)に溶解し、濾過し、再度減圧濃縮した。粗製残渣をジメチルアセトアミド(900uL)に溶解し、分取HPLCに移して精製することで、メチルN-[4-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートをオフホワイト固体として得た。

。

LC/MS (方法A) 保持時間=0.71分; $[M+H]^+=419$

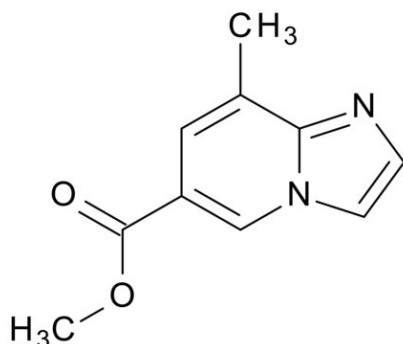
1H NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ 9.87 (br s, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.66 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.51 (dd, $J=0.7, 9.4$ Hz, 1H), 7.41-7.34 (m, 2H), 7.27 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.22-7.06 (m, 3H), 3.72 (s, 3H), 3.37 (s, 3H)。

[0254]

実施例2: この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート(化合物19)の調製を例示する。

[0255]

ステップ1：メチル 8-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートの調製
【化 3 4】



10

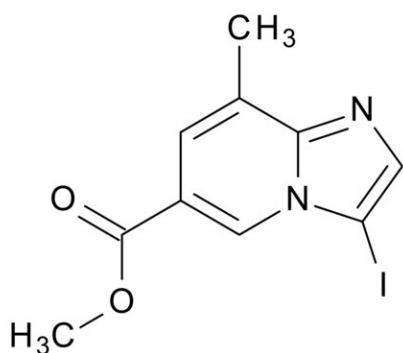
メチル 8-ブロモイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (750 mg、2.65 mmol、1 当量)、メチル硼酸 (323 mg、5.29 mmol、2 当量)、炭酸カリウム (731 mg、5.29 mmol、2 当量) 及び THF (20 mL) を封管に入れた。反応混合物をアルゴンで 2 分間脱気し、次いでクロロ (2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II) (104 mg、0.132 mmol、0.05 当量) を添加した。反応混合物を 80℃で 6 時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物をセライトパッドを通して濾過し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 8-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 8.81 (s, 1H), 7.70 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.66 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.65 (s, 3H)。

20

【0256】

ステップ2：メチル 3-ヨード-8-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートの調製
【化 3 5】

30



40

ジメチルホルムアミド (10 mL) 中のメチル 8-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (530 mg、2.37 mmol、1 当量) の攪拌溶液に室温で N-ヨードスクシンイミド (1.07 g、4.74 mmol、2 当量) を添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 3-ヨード-8-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートを

50

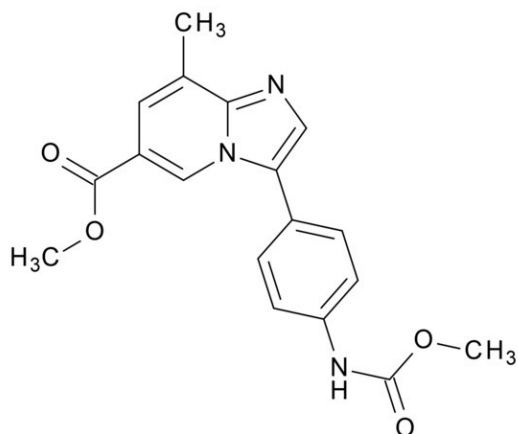
褐色固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.76 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.67 (s, 1H), 3.99 (s, 3H), 2.76 (s, 3H).

【0257】

ステップ3：メチル3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化36】



10

20

メチル3-ヨード-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート(50.0 mg、0.127 mmol、1当量)、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート(市販品、CAS 844500-75-0、77.9 mg、0.253 mmol、2当量)、炭酸カリウム(2 mol/L、0.127 mL、0.253 mmol、2当量)及び1,4-ジオキサン(5 mL)を封管に入れた。反応混合物を2分間アルゴンで脱気した後、クロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム(II)(4.98 mg、0.00633 mmol、0.05当量)を添加した。マイクロ波を照射しながら、反応混合物を80℃で6時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物をセライトパッドを通して濾過し、さらに酢酸エチルでフラッシュした。濾液を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより洗浄することで、メチル3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイト固体として得た。

30

^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ : 9.91 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 7.6 (s, 1H), 7.67 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.58 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.52 (br s, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 2.57 (s, 3H).

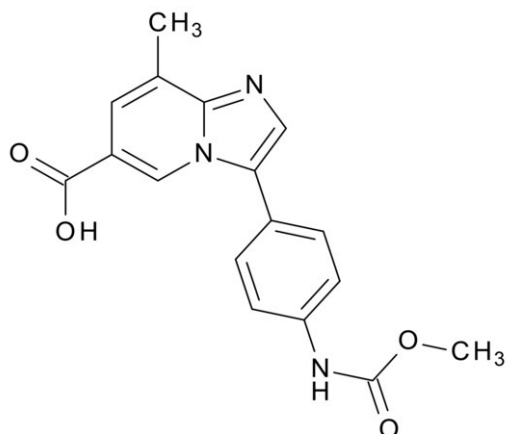
【0258】

40

ステップ4：3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-8-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸の調製

50

【化 3 7】



10

THF：水の 3：1 混合物（5 mL）中のメチル 3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-8-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレート（30.0 mg、0.0796 mmol、1 当量）の攪拌溶液に 0℃で水酸化リチウム水和物（6.68 mg、0.159 mmol、2 当量）を添加した。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した後、これを減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、飽和 NaHSO₄ 水溶液を用いて酸性にした。出現した析出物を濾過し、減圧乾燥することで、3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-8-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボン酸を得た。これは、さらに精製することなく次のステップで使用した。¹H NMR（400 MHz, DMSO-d₆）δ：13.24（br s, 1H）, 9.90（s, 1H）8.78（s, 1H）, 7.76（s, 1H）, 7.67（d, J=8.8 Hz, 2H）, 7.58（d, J=8.8 Hz, 2H）, 7.49-7.53（m, 1H）, 3.70（s, 3H）, 2.56（s, 3H）.

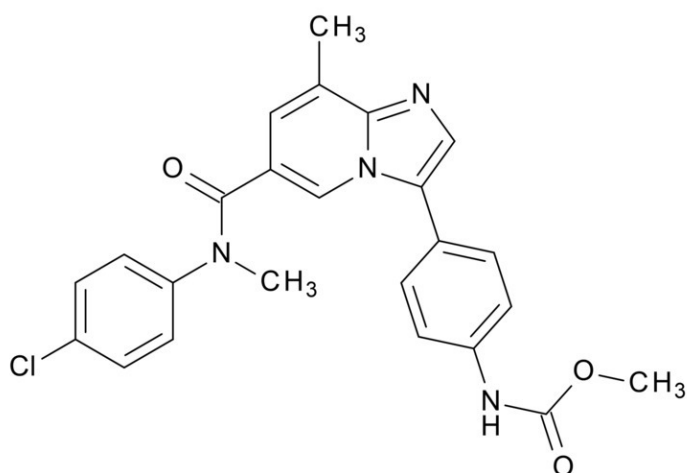
20

【0259】

ステップ 5：メチル N-〔4-〔6-〔（4-クロロフェニル）-メチルカルバモイル〕-8-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕フェニル〕カルバメートの調製

30

【化 3 8】



40

ピリジン（4 mL）中の 3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-8-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボン酸（90.0 mg、0.241 mmol、1 当量）の攪拌溶液に 4-クロロ-N-メチルアニリン（40.9 mg、0.722 mmol、1.2 当量）を添加した。次いで、オキシ塩化リン（V）（0.0661 mL、0.722 mmol、5 当量）を 0℃で添加した。反応混合物を室温で 3 時間攪

50

拌した。反応混合物を氷水でクエンチし、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を飽和NaHSO₄水溶液、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣を逆相クロマトグラフィーにより精製することで、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル) -メチル-カルバモイル] -8-メチル-イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートを非晶質の白色固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 7.95 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.50 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.01-7.10 (m, 4H), 6.81 (br s, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 2.56 (s, 3H).

10

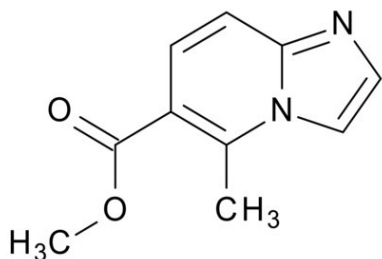
【0260】

実施例3: この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル) -メチル-カルバモイル] -5-メチル-イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート(化合物20)の調製を例示する。

【0261】

ステップ1: メチル5-メチルイミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化39】



20

メチル6-アミノ-2-メチル-ピリジン-3-カルボキシレート(50.0 mg、0.295 mmol、1当量)、エタノール(3 mL)及び2-クロロアセトアルデヒド(231 mg、1.47 mmol、5当量)を封管に入れた。反応混合物を80℃で16時間攪拌した。室温まで冷却した後、予め攪拌した低温の飽和NaHCO₃水溶液に反応混合物を注ぎ入れ、10分間攪拌した。その後、反応混合物をジクロロメタンで希釈した。有機層を分離し、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、メチル5-メチルイミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-カルボキシレートを褐色固体として得た。

30

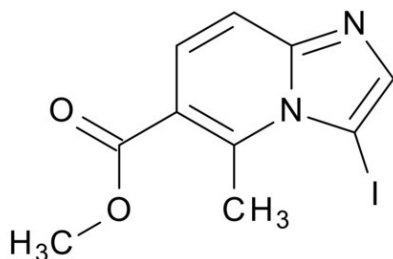
¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 8.49 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.17 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.03 (s, 3H).

【0262】

ステップ2: メチル3-ヨード-5-メチル-イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

40

【化40】



50

ジメチルホルムアミド（0.5 mL）中のメチル 5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレート（50.0 mg、0.197 mmol、1 当量）の攪拌溶液に室温で N-ヨードスクシンイミド（44.4 mg、0.197 mmol、1 当量）を添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 3-ヨード-5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイト固体として得た。

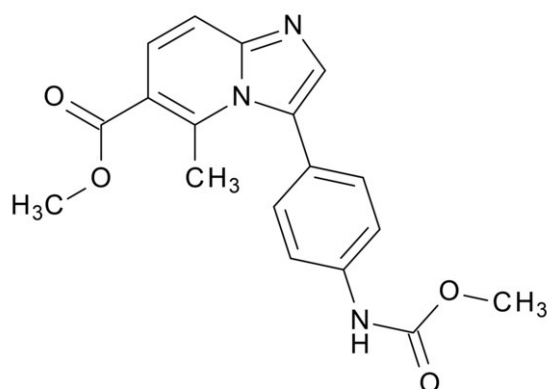
^1H NMR（400 MHz, DMSO- d_6 ） δ ：7.73（br s, 1H）, 7.53–7.56（m, 2H）, 3.86（m, 3H）, 3.38（s, 3H）。

10

【0263】

ステップ 3：メチル 3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化 4 1】



20

マイクロ波バイアルにメチル 3-ヨード-5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレート（450 mg、1.42 mmol、1 当量）、メチル N-〔4-（4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル）フェニル〕カルバメート（市販品、CAS 844500-75-0、592 mg、2.14 mmol、1.5 当量）、炭酸セシウム（928 mg、2.85 mmol、2 当量）、1, 4-ジオキサン（10 mL）及び水（2 mL）を入れた。反応混合物をアルゴンで 5 分間脱気した後、Pd（dppf）Cl₂（104 mg、0.142 mmol、0.1 当量）を添加し、これをさらに 2 分間脱気した。マイクロ波を照射しながら反応混合物を 90 °C に加熱し、16 時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

30

^1H NMR（400 MHz, DMSO- d_6 ） δ ：9.86（s, 1H）, 7.57–7.60（m, 2H）, 7.56（s, 1H）, 7.54（d, J = 8.5 Hz, 2H）, 7.42（d, J = 8.5 Hz, 2H）, 3.84（s, 3H）, 3.70（s, 3H）, 2.45（s, 3H）。

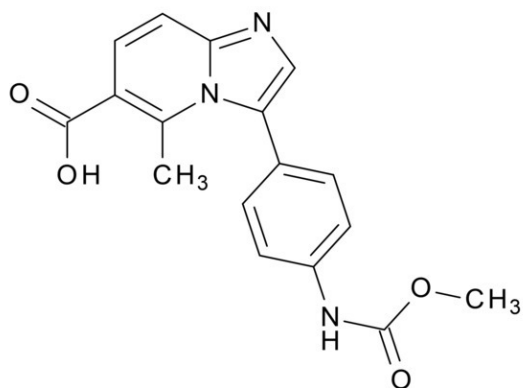
40

【0264】

ステップ 4：3-〔4-（メトキシカルボニルアミノ）フェニル〕-5-メチルイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボン酸の調製

50

【化 4 2】



10

THF (2 mL) 及びメタノール (0.5 mL) 中のメチル 3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-5-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート (10.0 mg、0.00295 mmol、1 当量) の攪拌溶液に水 (0.5 mL) 中の水酸化リチウム水和物 (2.60 mg、0.00589 mmol、2 当量) の溶液を室温で添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮し、得られた残渣を水で希釈し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。水層を、飽和 NaHSO₄ 水溶液を用いて酸性にした後、析出物が生じた。析出物を酢酸エチルに溶解し、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮することで、3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-5-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸を得た。これは、さらに精製することなく次のステップで利用した。

20

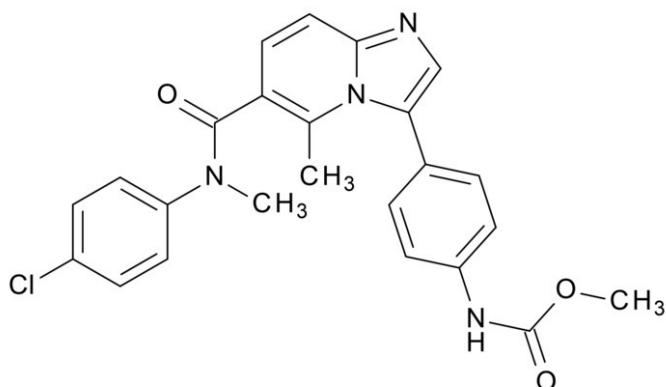
¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 13.20 (br s, 1H), 9.86 (s, 1H), 7.62 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.51–7.58 (m, 4H), 7.41 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 3.70 (s, 3H), 2.47 (s, 3H)。

【0265】

ステップ 5: メチル N-[4-[6-[(4-クロロフェニル) -メチルカルバモイル]-5-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートの調製

30

【化 4 3】



40

ピリジン (2 mL) 中の 3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]-5-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸 (110 mg、0.304 mmol、1 当量) の攪拌溶液に 4-クロロ-N-メチルアニリン (64.6 mg、0.456 mmol、1.5 当量) を添加した。次いで、オキシ塩化リン (V) (0.0836 mL、0.913 mmol、5 当量) を 0℃ で添加した。反応混合物を室温まで温め、さ

50

らに1時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-5-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートを得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 7.46 (m, 4H), 7.15–7.26 (m, 3H), 6.89–7.03 (m, 4H), 6.80 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.45 (br s, 3H), 2.10 (br s, 3H).

【0266】

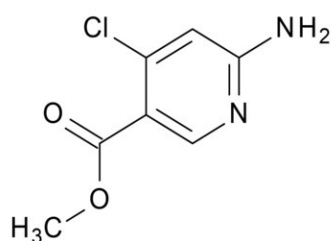
実施例4：この実施例は、メチルN-[4-[7-クロロ-6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート（化合物23）の調製を例示する。

10

【0267】

ステップ1：メチル2-アミノ-4-クロロ-1,2-ジヒドロピリジン-5-カルボキシレートの調製

【化44】



20

4-クロロ-5-ヨード-ピリジン-2-アミン（100 mg、0.393 mmol、1当量）、トリエチルアミン（0.110 mL、0.786 mmol、2当量）及びメタノール（10 mL）をオートクレーブに入れた。反応混合物をアルゴンで5分間脱気した後、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）ジクロリドジクロロメタン錯体（16.0 mg、0.0196 mmol、0.05当量）を添加し、これをさらに5分間脱気した。反応混合物をCO雰囲気（100 PSI）で100℃で16時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル2-アミノ-4-クロロ-1,2-ジヒドロピリジン-5-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

30

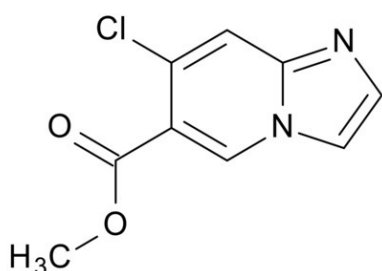
^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ : 8.49 (s, 1H), 7.06 (s, 2H), 6.52 (s, 1H), 3.76 (s, 3H).

【0268】

ステップ2：メチル7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

40

【化45】



50

メチル 2-アミノ-4-クロロ-1, 2-ジヒドロピリジン-5-カルボキシレート (1.20 g、6.04 mmol、1 当量)、エタノール (20 mL) 及び 2-クロロアセトアルデヒド (0.474 g、6.04 mmol、1 当量) をオートクレーブに入れた。反応混合物を 80 °C で 16 時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を減圧濃縮した。残渣を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

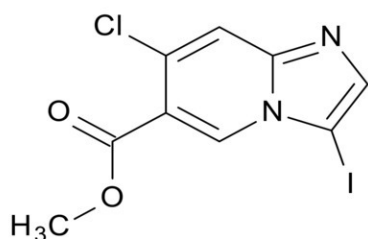
^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.34 (d, $J=0.8$ Hz, 1 H), 8.12 (dd, $J=0.8, 1.3$ Hz, 1 H), 7.87 (s, 1 H), 7.73 (d, $J=1.3$ Hz, 1 H), 3.88 (s, 3 H).

10

【0269】

ステップ 3: メチル 7-クロロ-3-ヨードイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化 46】



20

ジメチルホルムアミド (9 mL) 中のメチル 7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (900 mg、3.42 mmol、1 当量) の攪拌溶液に室温で N-ヨードスクシンイミド (1.15 g、5.13 mmol、1.5 当量) を添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 7-クロロ-3-ヨードイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートを褐色固体として得た。

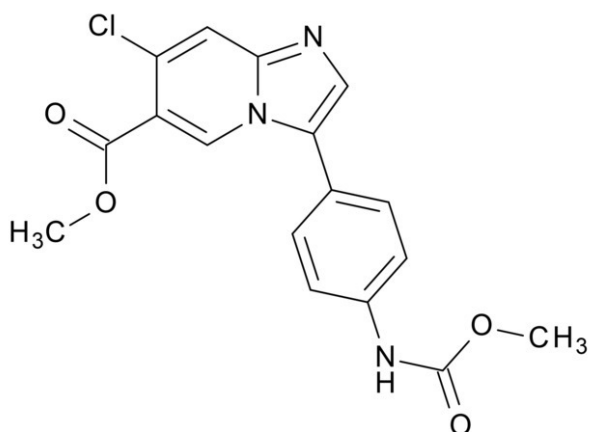
30

^1H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 8.77 (s, 1 H), 7.77 (s, 1 H), 7.73 (s, 1 H), 4.01 (s, 3 H).

【0270】

ステップ 4: メチル 7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化 47】



40

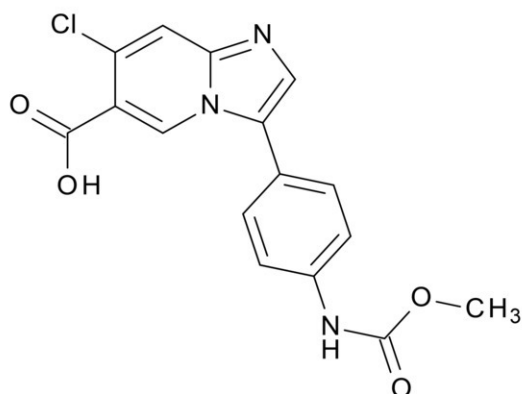
50

マイクロ波バイアルにメチル 7-クロロ-3-ヨードイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (800 mg、2.26 mmol、1 当量)、メチル N-[4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル) フェニル] カルバメート (市販品、CAS 844500-75-0, 939 mg、3.39 mmol、1.5 当量)、炭酸セシウム (1.47 g、4.52 mmol、2 当量)、1, 4-ジオキサン (15 mL) 及び水 (2 mL) を入れた。反応混合物をアルゴンで 5 分間脱気した後、Pd(dppf)Cl₂ (165 mg、0.226 mmol、0.1 当量) を添加し、さらに 2 分間脱気した。マイクロ波を照射しながら反応混合物を 90 °C で加熱し、16 時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 9.91 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.67 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (s, 3H) .

【0271】

ステップ 5: 7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸の調製
【化 48】



THF (10 mL) 及びメタノール (10 mL) 中のメチル 7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (550 mg、1.53 mmol、1 当量) の攪拌溶液に水 (2 mL) 中の水酸化リチウム-水和物 (128 mg、3.06 mmol、2 当量) の溶液を室温で添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、2 M の HCl で中和した。析出物が生じ、これを濾過し、減圧乾燥することで、7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ) フェニル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。これは、さらに精製することなく次のステップで使用した。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 13.54 (br s, 1H), 9.90 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.66 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 3.70 (s, 3H) .

【0272】

ステップ 6: メチル N-[4-[7-クロロ-6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル] フェニル] カルバメートの調製

10

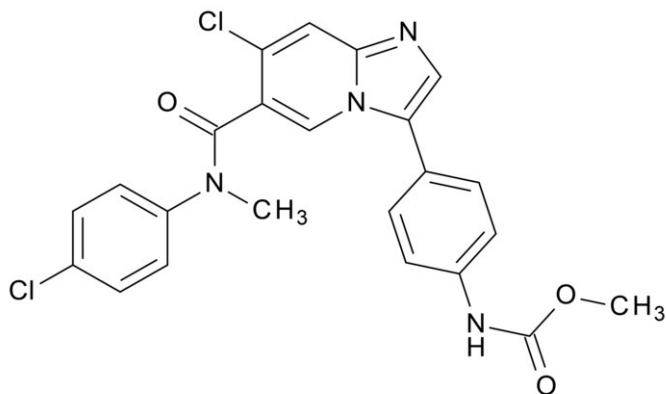
20

30

40

50

【化 4 9】



10

ピリジン（5 mL）中の 7-クロロ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸（200 mg、0.550 mmol、1 当量）の攪拌溶液に 4-クロロ-N-メチル-アニリン（93.4 mg、0.659 mmol、1.2 当量）を添加した。次いで、オキシ塩化リン（V）（0.252 mL、2.75 mmol、5 当量）を 0℃で添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブ

20

ラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル N-[4-[7-クロロ-6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートをオフホワイトの固体として得た。

^1H NMR（400 MHz, DMSO- d_6 ） δ : 9.90 (s, 1H), 8.60 (br s, 1H), 7.76 (br s, 1H), 7.72 (br s, 1H), 7.65 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.30–7.48 (m, 6H), 3.71 (s, 3H), 3.32 (s, 3H)。

【0273】

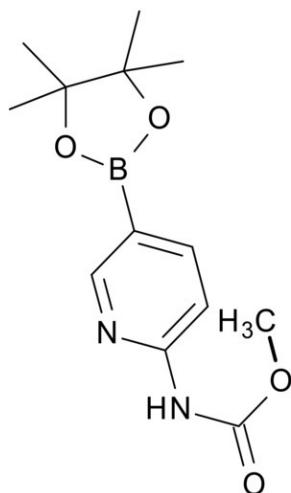
実施例 5：この実施例は、N-[5-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート（実施例 25）の調製を例示する。

30

【0274】

ステップ 1：メチル N-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]カルバメートの調製

【化 50】



40

50

2-アミノピリジン-5-ボロン酸ピナコールエステル (2000 mg、8.63 mmol、1.00 当量) 及びピリジン (2.79 g、2.85 mL、34.5 mmol、4.00 当量) を酢酸エチル (50 mL) に溶解し、10℃に冷却した。次いで、クロロギ酸メチル (3.30 g、2.70 mL、34.5 mmol、4.00 当量) を10～15℃で滴下した。添加が完了した後、混合物を室温でさらに2時間攪拌した。その後、混合物を酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮することで、メチルN-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]カルバメートを白色固体として得た。これは、さらに精製することなく次のステップで使用した。

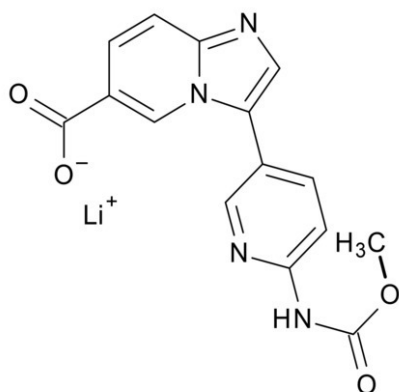
10

LC/MS (方法A) 保持時間 = 0.16 分; [M+H]⁺ = 279

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 8.64 (dd, J = 0.9, 1.7 Hz, 1H), 8.10–8.05 (m, 1H), 7.99 (dd, J = 0.7, 8.4 Hz, 1H), 7.28 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 1.37 (s, 12H) [0275]

ステップ2: リチウム3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製
【化51】

20



30

メチル3-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート (3000 mg、11.76 mmol、1.00 当量) 及びメチルN-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]カルバメート (5010 mg、17.1 mmol、1.50 当量) をジオキサン (75 mL) 及び水 (7.5 mL) に溶解した。炭酸セシウム (7510 mg、22.8 mmol、2.0 当量) を添加し、混合物をアルゴン気流で5分間パージした。次いで、CATACX IUM (R) Pd G3 (437 mg、0.570 mmol、0.05 当量) を添加し、反応混合物を85℃に17時間加熱した。混合物を室温まで冷却し、セライトのパッドを通して濾過した。濾液を減圧濃縮し、形成された懸濁液を濾過した。固体を酢酸エチルで洗浄し、真空乾燥することで、メチル3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートを黄色固体として得た。この粗製残渣 (2140 mg、6.23 mmol、1.00 当量) をTHF/水の3:1混合物 (152 mL) に溶解し、水酸化リチウム (400 mg、1.50 当量、9.35 mmol) を添加し、反応混合物を室温で17時間攪拌した。混合物を濾過し、THFで洗浄した。得られた固体を真空乾燥することで、リチウム3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

40

LC/MS (方法A) 保持時間 = 0.25 分; [M]⁻ = 311

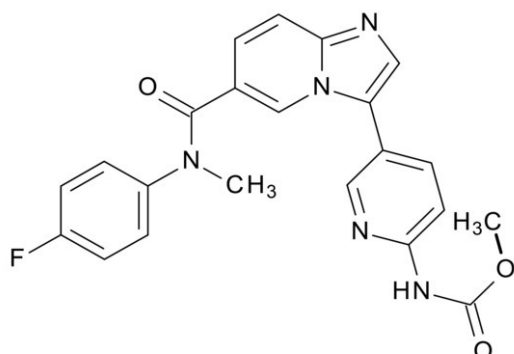
¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 10.42 (br s, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.52 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.14–8.00 (m,

50

2 H), 7.79–7.70 (m, 2 H), 7.49 (br d, $J=0.7$ Hz, 1 H), 3.72 (s, 3 H).

【0276】

ステップ3：メチルN-[5-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートの調製【化52】



10

ジメチルアセトアミド（0.24 mL）中のリチウム3-[6-(メトキシカルボニルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート（1当量、0.042 mmol）の混合物にN-メチル-4-フルオロアニリン（2当量、0.084 mmol）のジメチルアセトアミド（0.40 mL）溶液、ジイソプロピルエチルアミン（6.0当量、0.252 mmol）及びビス（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）ホスフィン酸クロリド（BOP-Cl）のストック溶液（2.5当量、0.101 mmol）を添加した。反応混合物を70℃で16時間攪拌し、次いで室温まで冷却した後、全ての揮発性物質を減圧留去した。得られた残渣をメタノール（1 mL）に溶解し、濾過し、減圧濃縮した。この粗製残渣をジメチルアセトアミド（900 μ L）に溶解し、HPLCにより精製することで、メチルN-[5-[6-[(4-フルオロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートをオフホワイトの固体として得た。

20

LC/MS（方法A）保持時間=0.70分； $[M+H]^+=420$

30

^1H NMR（400 MHz, CDCl_3 ） δ ：8.29–8.19 (m, 2 H), 8.15 (d, $J=8.4$ Hz, 1 H), 7.93 (br s, 1 H), 7.69 (s, 1 H), 7.58 (dd, $J=2.4, 8.5$ Hz, 1 H), 7.49 (d, $J=9.4$ Hz, 1 H), 7.16 (dd, $J=1.8, 9.4$ Hz, 1 H), 7.13–7.02 (m, 4 H), 3.89 (s, 3 H), 3.49 (s, 3 H).

【0277】

実施例6：この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-(シアノメチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート（化合物31）の調製を例示する。

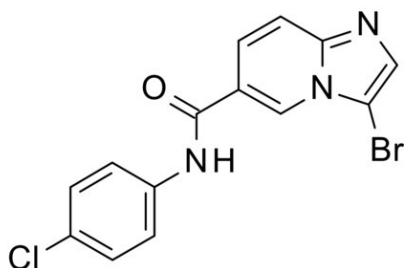
【0278】

40

ステップ1：3-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

50

【化 5 3】



3-ブロモイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボン酸（500mg、1.0当量、1.97mmol）と、4-クロロアニリン（308mg、1.2当量、2.36mmol）と、ジイソプロピルエチルアミン（1290mg、5.0当量、9.85mmol、1.73mL）との混合物をジメチルアセトアミド（15mL）に溶解した。混合物を室温で5分間攪拌した後、プロパンホスホン酸無水物（酢酸エチル中50重量%、3140mg、2.93mL、4.93mmol、2.5当量）を添加した。反応を40℃で2時間加熱した。反応混合物を室温まで冷却した後、これを酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液でクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル）により精製することで、3-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドをベージュ色の固体として得た。

10

20

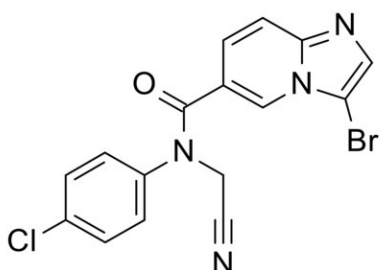
LC/MS（方法A）保持時間=0.92分；[M+H]⁺=352

¹H NMR（400MHz, DMSO-d₆）δ：10.69（s, 1H）, 9.01（s, 1H）, 7.96-7.72（m, 4H）, 7.52-7.37（m, 2H）.

【0279】

ステップ2：3-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-N-（シアノメチル）イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 5 4】



30

0℃に冷却したメチルテトラヒドロフラン（3mL）中の3-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（74.0mg、1.00当量、0.194mmol）の溶液に水素化ナトリウム（11.8mg、1.50当量、0.291mmol）を添加し、得られた混合物を室温まで温め、さらに約2時間攪拌した。反応混合物を再び0℃に冷却し、2-ブロモアセトニトリル（48.7mg、2.00当量、0.394mmol、0.028mL）を0～5℃で滴下した。その後、混合物を55℃で17時間攪拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。その後、合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣を次のステップで直接で利用した。

40

LC/MS（方法A）保持時間=0.86分、[M+H]⁺=391

¹H NMR（400MHz, CDCl₃）δ：8.39-8.33（m, 1H）, 7.

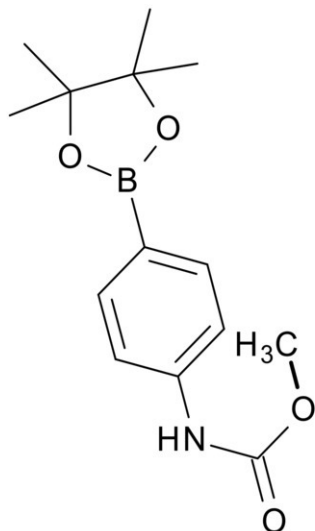
50

6.7–7.60 (m, 2H), 7.42–7.35 (m, 2H), 7.23–7.15 (m, 2H), 7.07–7.01 (m, 1H), 4.76 (s, 2H).

【0280】

ステップ3：メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメートの調製

【化55】



4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)アニリン (2.00 g、1.00当量、8.95 mmol) とピリジン (2.17 g、3.00当量、26.8 mmol、2.21 mL) との混合物を酢酸エチル (100 mL) に溶解した。その後、クロロギ酸メチル (1.71 g、2.00当量、17.9 mmol、1.40 mL) を10℃で滴下し、混合物を室温で2時間攪拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン／酢酸エチル) により精製することで、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメートを無色オイルとして得た。

LC/MS (方法A) 保持時間=1.00分; [M+H]⁺=278

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 7.70–7.83 (m, 2H), 7.33–7.47 (m, 2H), 6.57–6.77 (m, 1H), 3.79 (s, 3H), 1.34 (s, 12H).

【0281】

ステップ4：メチルN-[5-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートの調製

10

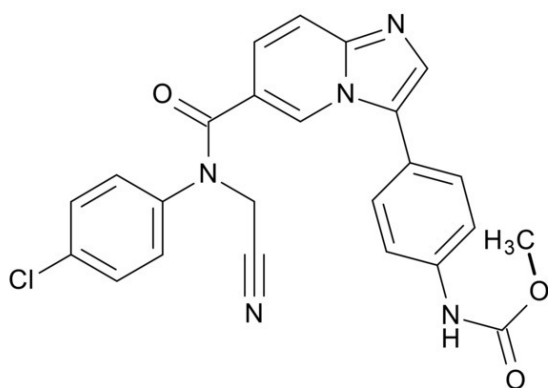
20

30

40

50

【化 5 6】



10

3-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-(シアノメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(50.0mg、1.00当量、0.116mmol)とメチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート(43.8mg、1.30当量、0.150mmol)との混合物をジオキサン(0.8mL)及び水(0.24mL)に溶解させた。炭酸セシウム(76.0mg、2.00当量、0.231mmol)を添加し、反応混合物をアルゴンで5分間フラッシュした。次いで、CATACXIUM(R)Pd G3(4.43mg、0.05当量、0.00578mmol)を添加し、混合物にマイクロ波を95℃で45分間照射した。混合物を酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。その後、合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣を逆相分取HPLC(水/アセトニトリル)により精製することで、メチルN-[5-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート9mgをオフホワイトの固体として得た。

20

LC/MS(方法A)保持時間=0.77分; [M+H]⁺=460

¹H NMR(400MHz, CDCl₃) δ: 8.28-8.34(m, 1H), 7.63-7.68(m, 1H), 7.47-7.59(m, 3H), 7.38-7.44(m, 2H), 7.13-7.23(m, 5H), 6.91-7.00(m, 1H), 4.72(s, 2H), 3.87(s, 3H).

30

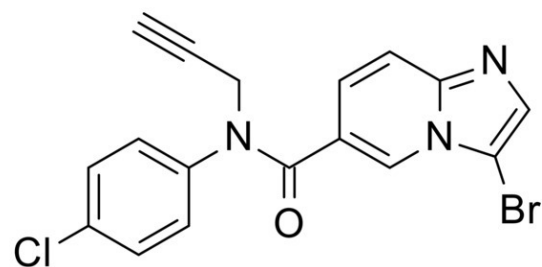
【0282】

実施例7: この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-プロプ-2-イニルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート(化合物33)の調製を例示する。

【0283】

ステップ1: 3-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-プロプ-2-イニルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 5 7】



40

室温でメチルテトラヒドロフラン(4.5mL)中の3-ブロモイミダゾ[1,2-a]

50

〕ピリジン-6-カルボン酸（112mg、0.44mmol、1.0当量）にジメチルホルムアミド（3.3mg、0.003mL、0.044mmol、0.1当量）及び塩化オキサリル（68.6mg、0.047mL、0.53mmol、1.20当量）を添加した。3時間後、反応混合物を蒸発乾固し、3-ブロモイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボニルクロリドを粗製残渣として得た。別のフラスコにおいて、4-クロロ-N-プロプ-2-イル-アニリン（79.0mg、0.44mmol、1.0当量）及びピリジン（106mg、0.11mL、1.32mmol、3.0当量）をメチルテトラヒドロフラン（4mL）に溶解した。この混合物を上で調製した3-ブロモイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボニルクロリドに添加し、得られた混合物を70℃で16時間攪拌した。次いで、反応混合物を室温まで冷却し、酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。その後、合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル）により精製することで、3-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-N-プロプ-2-イニル-イミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを黄色樹脂として得た。

10

20

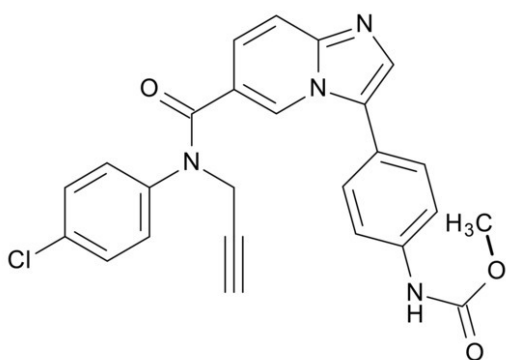
LC/MS（方法A）保持時間=0.91分；[M+H]⁺=388

¹H NMR（400MHz, CDCl₃）δ：8.36（dd, J=0.9, 1.7Hz, 1H）, 7.64（s, 1H）, 7.38（dd, J=0.9, 9.4Hz, 1H）, 7.36-7.32（m, 2H）, 7.22-7.17（m, 2H）, 7.08（dd, J=1.7, 9.4Hz, 1H）, 4.70（d, J=2.6Hz, 2H）, 2.33（t, J=2.4Hz, 1H）.

【0284】

ステップ2：メチルN-〔4-〔6-〔（4-クロロフェニル）-プロプ-2-イニル-カルバモイル〕イミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-3-イル〕フェニル〕カルバメートの調製

【化58】



30

40

50

マイクロ波バイアルにおいて、3-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-N-プロプ-2-イニル-イミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（80.0mg、0.189mmol、1.0当量）及びメチルN-〔4-（4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル）フェニル〕カルバメート（71.8mg、0.246mmol、1.3当量）をジオキサン（2.8mL）及び水（0.8mL）に溶解した。炭酸セシウム（125.0mg、0.379mmol、2.0当量）を添加し、反応混合物をアルゴンでパージした。最後に、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）（11.1mg、0.05当量、0.01mmol）を添加し、マイクロ波を照射しながら反応混合物を100℃で80分間加熱した。混合物を酢酸エチルで希釈し、NaHCO₃の飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。その後、合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル）により精製することで、メチルN-〔4-〔6-〔（4-クロロフェニル）-プロプ-2-イニル-カルバモイル

】イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕フェニル〕カルバメートを黄色固体として得た。

LC/MS (方法A) 保持時間=0.86分、 $[M+H]^+=391$

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.31–8.28 (m, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.56 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 7.50 (dd, $J=0.7, 9.5$ Hz, 1H), 7.39–7.33 (m, 2H), 7.23 (dd, $J=1.8, 9.5$ Hz, 1H), 7.21–7.13 (m, 4H), 7.09 (br s, 1H), 4.66 (d, $J=2.6$ Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.29 (t, $J=2.4$ Hz, 1H).

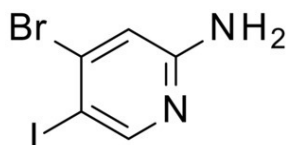
【0285】

実施例8: この実施例は、メチルN-〔4-〔7-ブロモ-6-〔(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル〕イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕フェニル〕カルバメート (化合物34) の調製を例示する。

【0286】

ステップ1: 4-ブロモ-5-ヨード-ピリジン-2-アミンの調製

【化59】



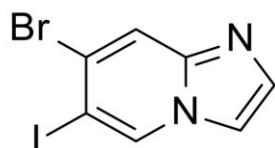
アセトニトリル (10 mL) 中の4-ブロモピリジン-2-アミン (500 mg、2.75 mmol、1当量) の攪拌溶液に室温でN-ヨードスクシンイミド (1.23 g、5.49 mmol、1.5当量) を添加した。反応混合物を50℃で24時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、4-ブロモ-5-ヨード-ピリジン-2-アミンを褐色固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ : 8.19 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.37 (br s, 2H).

【0287】

ステップ2: 7-ブロモ-6-ヨードイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジンの調製

【化60】



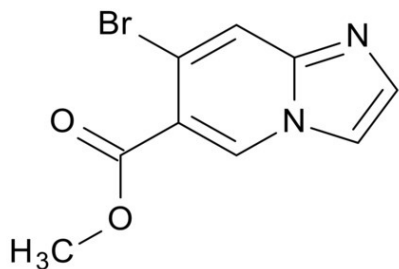
4-ブロモ-5-ヨード-ピリジン-2-アミン (10.5 g、31.6 mmol、1当量)、2-クロロアセトアルデヒド (45%、22.3 mL、158 mmol、5当量) を封管に入れた。反応混合物を80℃で16時間攪拌した。室温まで冷却した後、予め攪拌した低温の飽和 NaHCO_3 水溶液に反応混合物を注ぎ入れ、5分間攪拌したままにした。その後、反応混合物を酢酸エチルで希釈した。有機層を分離し、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、7-ブロモ-6-ヨードイミダゾ〔1, 2-a〕ピリジンをオフホワイトの固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.57 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.54 (s, 1H).

【0288】

ステップ3：メチル7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化61】



10

7-ブロモ-6-ヨードイミダゾ[1,2-a]ピリジン(6.40g、17.8mmol、1当量)、酢酸ナトリウム(3.66g、44.6mmol、2.5当量)、1,4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン(0.761g、1.78mmol、0.1当量)及びメタノール(100mL)をオートクレーブに入れた。反応混合物を窒素で5分間脱気した後、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド(0.626g、0.892mmol、0.05当量)を添加した。反応混合物をCO雰囲気下(200PSI)、80℃で16時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートを褐色固体として得た。

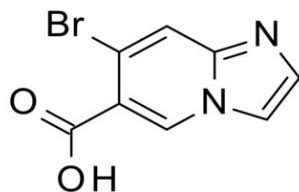
20

^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ : 8.83 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.70–7.72 (m, 1H), 7.65 (br s, 1H), 3.97 (s, 3H)。

【0289】

ステップ4：7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸の調製

【化62】



30

THF：メタノール：水(40mL)の4：4：2混合物中のメチル7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート(3.30g、11.6mmol、1当量)の攪拌溶液に室温で水酸化リチウム-水和物(0.977g、23.3mmol、2当量)を添加した。反応混合物を室温で1時間攪拌した後、減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、飽和NaHSO₄水溶液を用いて酸性にした。析出物が生じ、これを濾過し、減圧乾燥することで、7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸を褐色固体として得た。これは、さらに精製することなく次のステップで使用した。

40

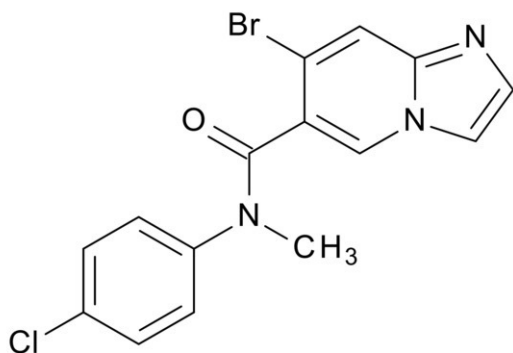
^1H NMR (400MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ : 13.21–13.75 (br s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.68 (d, $J=1.0\text{Hz}$, 1H)。

【0290】

ステップ5：7-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

50

【化 6 3】



10

ジメチルホルムアミド（2 mL）中の7-ブロモイミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボン酸（50.0 mg、0.176 mmol、1当量）の攪拌溶液に4-クロロ-N-メチル-アニリン（30.0 mg、0.212 mmol、1.2当量）、トリエチルアミン（0.0737 mL、0.529 mmol、3当量）及びプロパンホスホン酸無水物（酢酸エチル中50重量%、0.210 mL、0.353 mmol、2当量）を添加した。反応混合物を室温で16時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、7-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドをオフホワイトの固体として得た。

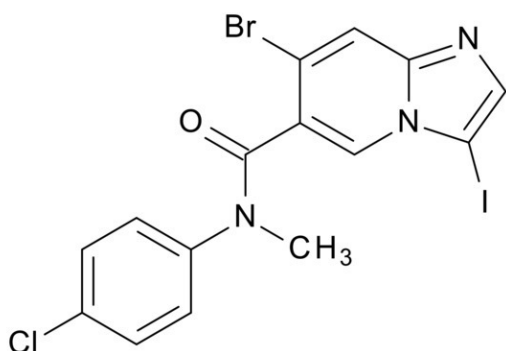
20

^1H NMR（400 MHz，DMSO- d_6 ） δ ：8.56–8.79（m，1H），7.89（br s，2H）7.59（br s，1H）7.25–7.45（m，4H）3.38（br s，3H）。

【0291】

ステップ6：7-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-3-ヨード-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 6 4】



30

室温のアセトニトリル（20 mL）中の7-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（800 mg、2.15 mmol、1当量）の攪拌溶液にN-ヨードスクシンイミド（967 mg、4.30 mmol、2当量）を添加した。反応混合物を室温で16時間攪拌した後、これを水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、7-ブロモ-N-（4-クロロフェニル）-3-ヨード-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを褐色固体として得た。

40

^1H NMR（400 MHz，DMSO- d_6 ） δ ：8.46（br s，1H），7.92（br s，1H），7.70（br s，1H），7.26–7.47（m，4H）

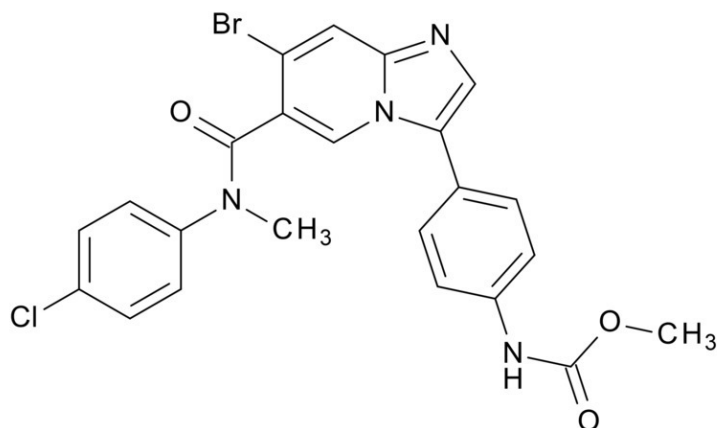
50

, 3.40 (br s, 3H).

【0292】

ステップ7：メチルN-[4-[7-ブromo-6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートの調製

【化65】



10

マイクロ波バイアルに7-ブromo-N-(4-クロロフェニル)-3-ヨード-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(50.0mg、0.0917mmol、1当量)、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート(市販品、CAS844500-75-0、42.4mg、0.138mmol、1.5当量)、炭酸セシウム(59.8mg、0.183mmol、2当量)、1,4-ジオキサン(1.5mL)及び水(0.5mL)を入れた。反応混合物をアルゴンで2分間脱気し、その後、cataCXium(登録商標)APdG3(3.34mg、0.00459mmol、0.05当量)を添加した。その後、マイクロ波を照射しながら反応混合物を90℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物をセライトパッドを通して濾過し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチルN-[4-[7-ブromo-6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートをオフホワイトの固体として得た。

20

¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ: 9.90(s, 1H), 8.56(br s, 1H) 7.92(br s, 1H), 7.70(br s, 1H), 7.65(d, J=8.6Hz, 2H), 7.29-7.55(m, 6H), 3.71(s, 3H), 3.36(br s, 3H)。

30

【0293】

実施例9：この実施例は、メチルN-[4-[8-ブromo-6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート(化合物35)の調製を例示する。

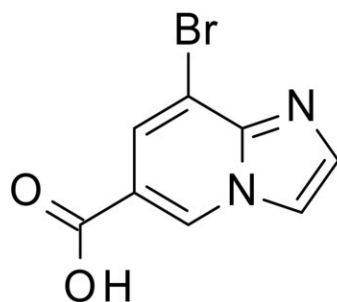
40

【0294】

ステップ1：8-ブromoイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸の調製

50

【化 6 6】



10

THF (10 mL) 及びメタノール (5 mL) 中のメチル 8-ブロモイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート (2.00 g、7.84 mmol、1 当量) の攪拌溶液に水 (5 mL) 中の水酸化リチウム-水和物 (0.658 g、15.7 mmol、2 当量) の溶液を室温で添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、2 M の HCl で中和した。析出物が生じ、これを濾過し、減圧乾燥することで、8-ブロモイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。これは、さらに精製することなく次のステップで使用した。

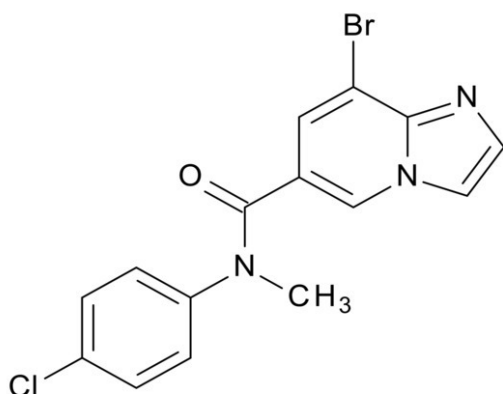
^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.40 (d, $J=1.3$ Hz, 1 H), 8.33 (d, $J=1.3$ Hz, 1 H), 8.03 (d, $J=1.3$ Hz, 1 H), 7.89 (d, $J=1.3$ Hz, 1 H).

20

【0295】

ステップ 2: 8-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 6 7】



30

ピリジン (20 mL) 中の 8-ブロモイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸 (1.40 g、5.81 mmol、1 当量) の攪拌溶液に 4-クロロ-N-メチルアニリン (0.822 g、5.81 mmol、1 当量) を添加した。次いで、オキシ塩化リン (V) (2.66 mL、29.0 mmol、5 当量) を 0°C で添加した。その後、反応混合物を室温まで温め、さらに 1 時間攪拌した。反応混合物を飽和 NaHCO₃ 水溶液でクエンチし、水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、8-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドをオフホワイトの固体として得た。

40

^1H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 8.29 (d, $J=1.0$ Hz, 1 H), 7.77 (s, 1 H), 7.61 (s, 1 H), 7.30–7.34 (m, 2 H), 7

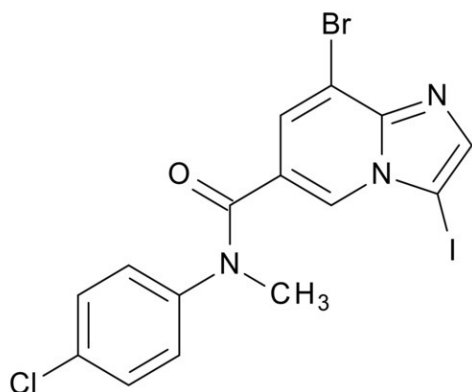
50

． 2 9 (d , J = 1 . 2 H z , 1 H) , 7 . 0 4 - 7 . 0 9 (m , 2 H) , 3 . 4 9 (s , 3 H) .

【 0 2 9 6 】

ステップ 3 : 8 - ブロモ - N - (4 - クロロフェニル) - 3 - ヨード - N - メチル - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 6 - カルボキサミドの調製

【 化 6 8 】



10

ジメチルホルムアミド (3 m L) 中の 8 - ブロモ - N - (4 - クロロフェニル) - N - メチル - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 6 - カルボキサミド (5 0 0 m g 、 1 . 3 0 m m o l 、 1 当量) の攪拌溶液に室温で N - ヨードスクシンイミド (4 4 0 m g 、 1 . 9 5 m m o l 、 1 . 5 当量) を添加した。反応混合物を室温で 1 6 時間攪拌した。その後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、8 - ブロモ - N - (4 - クロロフェニル) - 3 - ヨード - N - メチル - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 6 - カルボキサミドを褐色固体として得た。

20

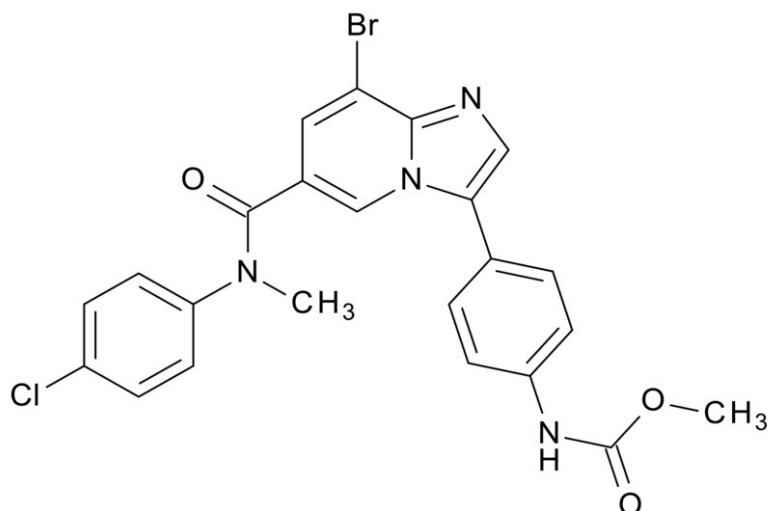
^1H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d_6) δ : 8 . 1 7 (d , J = 1 . 2 H z , 1 H) , 7 . 7 8 (s , 1 H) , 7 . 5 1 (d , J = 1 . 2 H z , 1 H) , 7 . 3 9 (s , 4 H) , 3 . 4 0 (s , 3 H) .

30

【 0 2 9 7 】

ステップ 4 : メチル N - [4 - [8 - ブロモ - 6 - [(4 - クロロフェニル) - メチル - カルバモイル] イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル] フェニル] カルバメートの調製

【 化 6 9 】



40

50

マイクロ波バイアルに 8-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-3-ヨード-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド (200 mg、0.408 mmol、1 当量)、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート (市販品、CAS 844500-75-0、113 mg、0.408 mmol、1 当量)、炭酸セシウム (265 mg、0.816 mmol、2 当量)、1,4-ジオキサン (10 mL) 及び水 (2 mL) を入れた。反応混合物をアルゴンで 5 分間脱気した後、cataCXium (7.30 mg、0.0204 mmol、0.05 当量) 及び Pd(OAc)₂ (2.7 mg、0.012 mmol、0.03 当量) を添加した。マイクロ波を照射しながら反応混合物を 80℃ で 30 分間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーで精製することで、メチルN-[4-[8-ブロモ-6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートをオフホワイトの固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 9.91 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.63 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.53 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.34-7.44 (m, 4H), 7.17 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.72 (s, 3H), 3.37 (s, 3H).

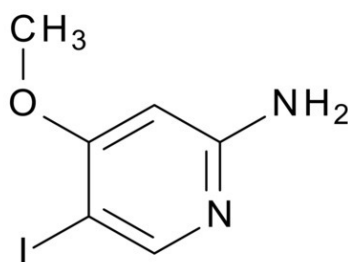
[0298]

実施例 10: この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]-7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート (化合物 39) の調製を例示する。

[0299]

ステップ 1: 5-ヨード-4-メトキシピリジン-2-アミンの調製

[化 70]



室温でジメチルホルムアミド中の 4-メトキシピリジン-2-アミン (1.00 g、7.65 mmol、1 当量) の攪拌溶液に N-ヨードスクシンイミド (2.58 g、11.5 mmol、1.5 当量) を添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、5-ヨード-4-メトキシピリジン-2-アミンをオフホワイトの固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 8.16 (s, 1H), 5.98 (s, 1H), 3.87 (s, 3H).

[0300]

ステップ 2: メチル 6-アミノ-4-メトキシピリジン-3-カルボキシレートの調製

10

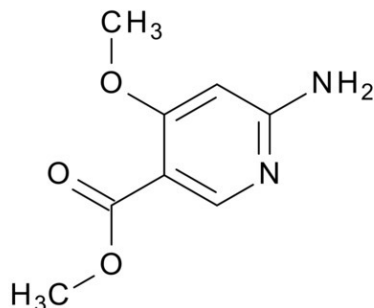
20

30

40

50

【化 7 1】



10

5-ヨード-4-メトキシピリジン-2-アミン (1.00 g、4.00 mmol、1 当量)、トリエチルアミン (1.11 mL、8.00 mmol、2 当量) 及びメタノール (20 mL) をオートクレーブに入れた。反応混合物をアルゴンで 5 分間脱気した。次いで、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) ジクロロジクロロメタン錯体 (163 mg、0.200 mmol、0.05 当量) を添加し、反応混合物をさらに 5 分間脱気した。その後、反応混合物を CO ガス (100 PSI) 中で 100 °C で 16 時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 6-アミノ-4-メトキシピリジン-3-カルボキシレート オフホワイトの固体として得た。

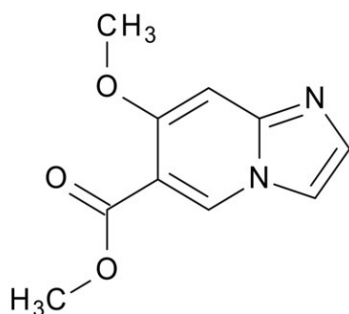
20

^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 8.33 (s, 1H), 7.07 (br s, 2H), 6.12 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.71 (s, 3H) .

【0301】

ステップ 3: メチル 7-メトキシイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化 7 2】



30

メチル 6-アミノ-4-メトキシピリジン-3-カルボキシレート (100 mg、0.521 mmol、1 当量)、水 (5 mL) 及びブromoアセトアルデヒドジメチルアセタール (0.186 g、1.04 mmol、2 当量) を封管に入れた。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を予め攪拌した低温の飽和 NaHCO₃ 水溶液に注ぎ入れ、10 分間攪拌したままにした。その後、反応混合物をジクロロメタンで希釈した。有機層を分離し、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 7-メトキシイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキシレート 褐色固体として得た。

40

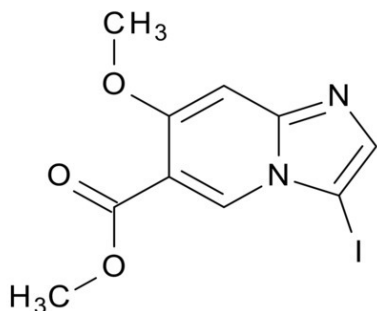
^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.12 (s, 1H), 7.92–7.95 (m, 1H), 7.61 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.83 (s, 3H) .

50

【0302】

ステップ4：メチル3-ヨード-7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートの調製

【化73】



10

ジメチルホルムアミド（0.5 mL）中のメチル7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート（100 mg、0.364 mmol、1当量）の攪拌溶液に室温でN-ヨードスクシンイミド（123 mg、0.546 mmol、1.2当量）を添加した。反応混合物を室温で16時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル3-ヨード-7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートを得た。

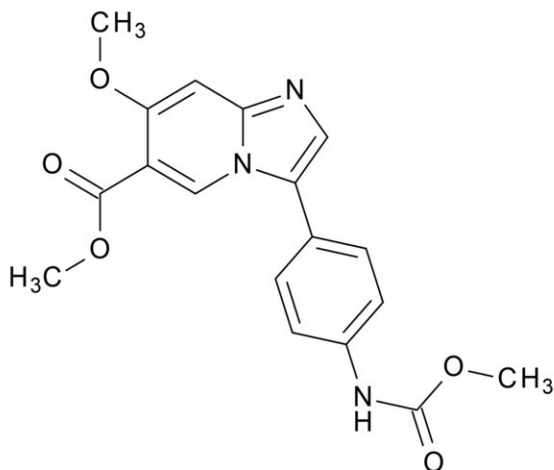
20

^1H NMR（400 MHz, DMSO- d_6 ） δ ：8.56（s, 1H）, 7.64（s, 1H）, 7.15（s, 1H）, 3.89（s, 3H）, 3.85（s, 3H）。

【0303】

ステップ5：メチル7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸の調製

【化74】



30

40

マイクロ波バイアルにメチル3-ヨード-7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート（400 mg、1.14 mmol、1当量）、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート（市販品、CAS 844500-75-0、349 mg、1.26 mmol、1.1当量）、炭酸セシウム（746 mg、2.29 mmol、2当量）、1,4-ジオキサン（3 mL）及び水（0.5 mL）を入れた。反応混合物をアルゴンで5分間脱気した後、cataCXium（登録商標）APdG3（43.9 mg、0.0572 mmol、0.05当量）を添加し、これをさらに2分間脱気した。マイクロ波を

50

照射しながら反応混合物を 95℃で 1 時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル 7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。

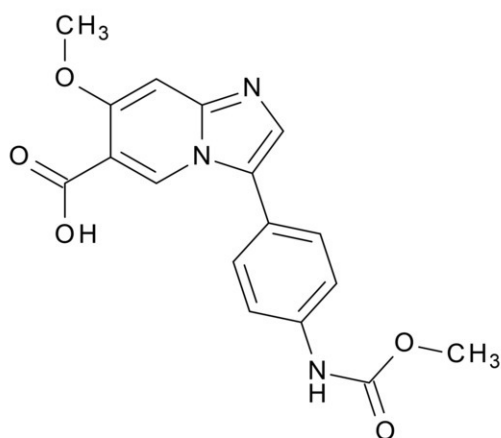
^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.86 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 7.59–7.62 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.53–7.58 (m, 2H), 7.13 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.70 (s, 3H).

10

【0304】

ステップ 6: 7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸の調製

【化 75】



20

THF (10 mL) 及びメタノール (5 mL) 中のメチル 7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート (150 mg、0.401 mmol、1 当量) の撹拌溶液に水 (5 mL) 中の水酸化リチウム-水和物 (33.7 mg、0.802 mmol、2 当量) の溶液を室温で添加した。反応混合物を室温で 1 時間撹拌した。反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、2 M の HCl で中和した。生じた析出物を濾過し、減圧乾燥することで、7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。これは、さらに精製することなく次の工程で使用した。

30

^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.86 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 7.61–7.66 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.53–7.58 (m, 2H), 7.09 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.70 (s, 3H).

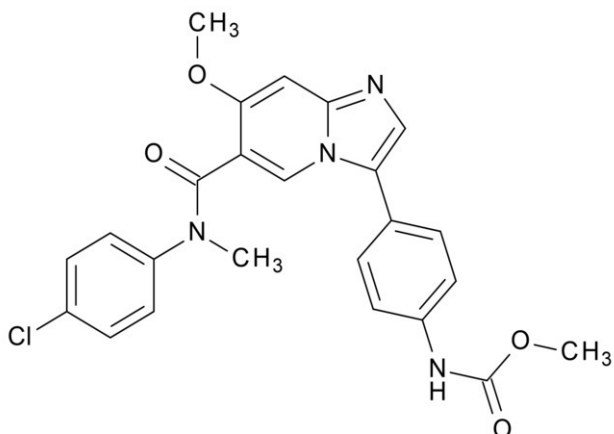
40

【0305】

ステップ 7: メチル N-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-メトキシ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートの調製

50

【化 7 6】



10

ピリジン（1 mL）中の 7-メトキシ-3-[4-(メトキシカルボニルアミノ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボン酸（20.0 mg、0.059 mmol、1 当量）の攪拌溶液に 4-クロロ-N-メチルアニリン（12.4 mg、0.0879 mmol、1.5 当量）を添加した。次いで、オキシ塩化リン（V）（0.0268 mL、0.293 mmol、5 当量）を 0℃で添加した。反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した。得られた残渣を水で希釈し、2 M の HCl で中和した。析出物が生じ、これを濾過し、減圧乾燥した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチル N-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]-7-メトキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートを得た。

20

^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ : 9.85 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.61–7.65 (d, $J=8.6$ Hz, 2H), 7.40–7.55 (m, 3H), 7.22–7.41 (m, 3H), 6.80–6.87 (br s, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.67 (br s, 3H), 3.33 (br s, 3H).

【0306】

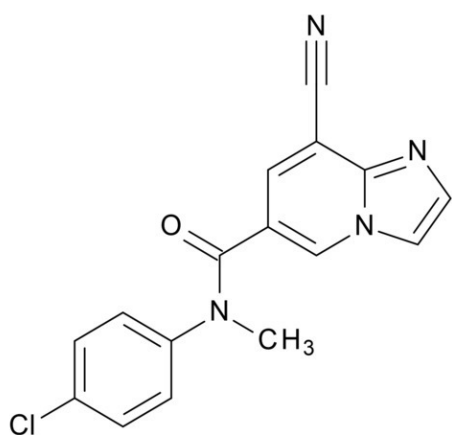
実施例 11：この実施例は、メチル N-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]-8-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート（化合物 40）の調製を例示する。

30

【0307】

ステップ 1：N-(4-クロロフェニル)-8-シアノ-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 7 7】



40

8-ブromo-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリ

50

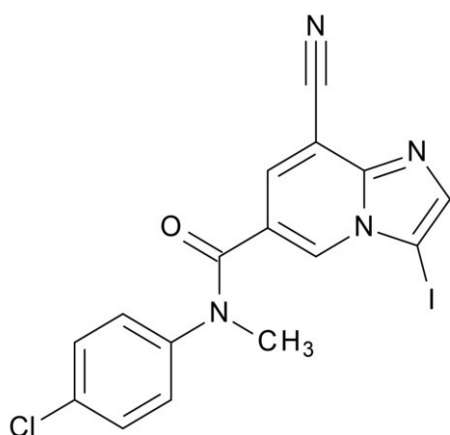
ジーン-6-カルボキサミド（実施例9、ステップ2で既述、300mg、0.740mmol、1当量）、Zn(CN)₂（87.0mg、0.740mmol、1当量）及びジメチルホルムアミド（2mL）を封管に入れた。反応混合物を15分間窒素で脱気した後、Xantphos（41.1mg、0.0740mmol、0.1当量）及びトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（67.8mg、0.0740mmol、0.1当量）を添加した。反応混合物を140℃に加熱し、16時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を氷水に注ぎ入れ、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、N-（4-クロロフェニル）-8-シアノ-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドを得た。

¹H NMR（400MHz，DMSO-d₆）δ：8.99（d，J=1.5Hz，1H），8.13（d，J=1.3Hz，1H），7.73（d，J=1.5Hz，1H），7.70（d，J=1.3Hz，1H），7.38-7.41（m，2H），7.32-7.36（m，2H），3.40（s，3H）。

【0308】

ステップ2：N-（4-クロロフェニル）-8-シアノ-3-ヨード-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化78】



ジメチルホルムアミド（0.5mL）中のN-（4-クロロフェニル）-8-シアノ-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド（250mg、0.603mmol、1当量）の攪拌溶液に室温でN-ヨードスクシンイミド（136mg、0.603mmol、1当量）を添加した。反応混合物を室温で16時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、N-（4-クロロフェニル）-8-シアノ-3-ヨード-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドをオフホワイトの固体として得た。

¹H NMR（400MHz，DMSO-d₆）δ：8.44（s，1H）7.89（br s，1H），7.88（s，1H），7.40（s，4H），3.41（s，3H）。

【0309】

ステップ3：メチルN-〔4-〔6-〔（4-クロロフェニル）-メチル-カルバモイル〕-8-シアノ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル〕フェニル〕カルバメートの調製

10

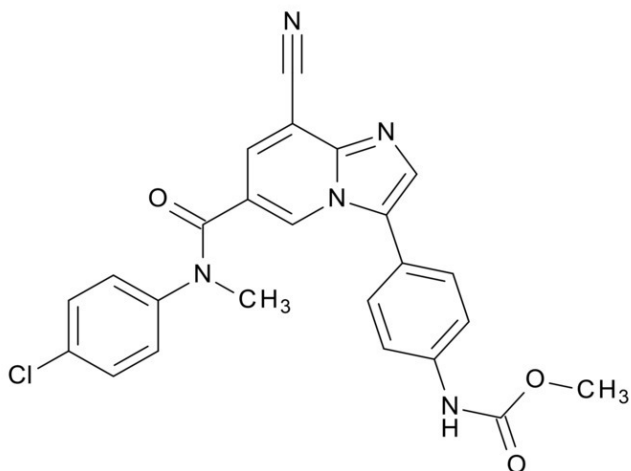
20

30

40

50

【化 7 9】



10

マイクロ波バイアルにN-(4-クロロフェニル)-8-シアノ-3-ヨード-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(100mg、0.218mmol、1当量)、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート(市販品、CAS844500-75-0、66.3mg、0.239mmol、1.1当量)、炭酸セシウム(142mg、0.435mmol、2当量)、1,4-ジオキサン(3mL)及び水(0.5mL)を入れた。反応混合物をアルゴンで5分間脱気した後、cataCXium(登録商標)APdG3(8.34mg、0.0109mmol、0.05当量)を添加した。マイクロ波を照射しながら反応混合物を95℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を水、次いでブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]-8-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートを黄色固体として得た。

20

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ : 9.93 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.90 (d, $J=1.3$ Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.64 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.35-7.43 (m, 4H), 7.21 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 3.72 (s, 3H), 3.38 (s, 3H)。

30

【0310】

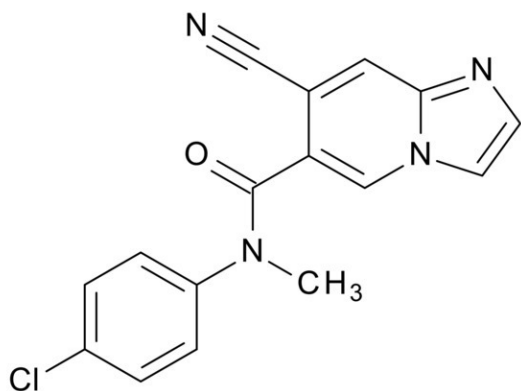
実施例12: この実施例は、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチルカルバモイル]-7-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメート(化合物41)の調製を例示する。

【0311】

ステップ1: N-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

40

【化 8 0】



10

7-ブロモ-N-(4-クロロフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド（実施例 8、ステップ 5 で既述、1.00 g、2.47 mmol、1 当量）、Zn(CN)₂（0.580 g、4.94 mmol、2 当量）及びジメチルホルムアミド（15 mL）を封管に入れた。反応混合物を窒素で 5 分間脱気した後、Xantphos（0.137 g、0.247 mmol、0.1 当量）及びトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（0.226 g、0.247 mmol、0.1 当量）を添加した。反応混合物を 140℃で 16 時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を氷水に注ぎ入れ、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製することで、N-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドをオフホワイトの固体として得た。¹H NMR（400 MHz，DMSO-d₆）δ：8.78（s，1H），8.36（s，1H），8.10（s，1H），7.85（d，J=1.10 Hz，1H），7.36-7.43（m，2H）7.27-7.36（m，2H）3.42（s，3H）。

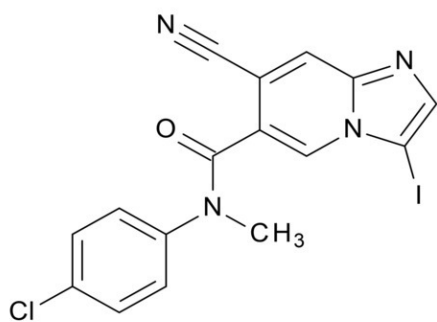
20

【0312】

ステップ 2：N-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-3-ヨード-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

30

【化 8 1】



40

アセトニトリル（20 mL）中の N-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド（450 mg、1.32 mmol、1 当量）の撹拌溶液に室温で N-ヨードスクシンイミド（593 mg、2.64 mmol、2 当量）を添加した。反応混合物を室温で 16 時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、N-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-3-ヨード-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドを褐色固体として得た。

¹H NMR（400 MHz，DMSO-d₆）δ：8.40（s，1H），7.99（

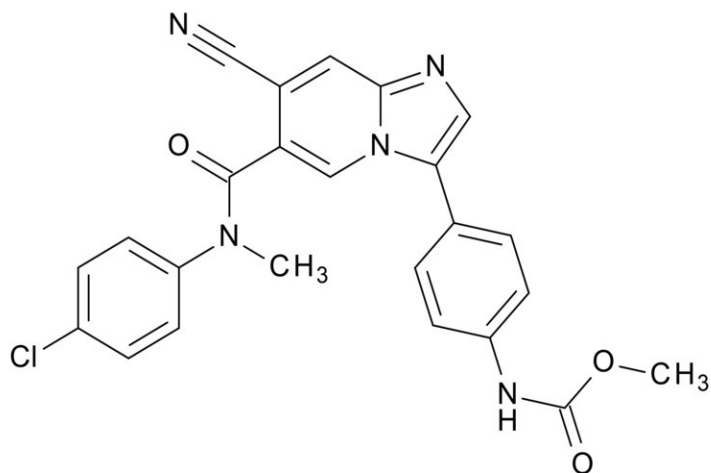
50

s, 1 H), 7.39 (m, 5 H), 3.43 (s, 3 H).

【0313】

ステップ3：メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-シアノ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートの調製

【化82】



10

20

マイクロ波バイアルにN-(4-クロロフェニル)-7-シアノ-3-ヨード-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(300mg、0.666mmol、1当量)、メチルN-[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェニル]カルバメート(市販品、CAS844500-75-0、308mg、1.00mmol、1.5当量)、炭酸セシウム(434mg、1.33mmol、2当量)、1,4-ジオキサン(7.5mL)及び水(2.5mL)を入れた。反応混合物をアルゴンで2分間脱気した後、cataCXium(登録商標)APdG3(24.3mg、0.0333mmol、0.05当量)を添加した。マイクロ波を照射しながら反応混合物を90℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物をセライトパッドを通して濾過し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を水、次いでブ

30

ラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をフラッシュクロマトグラフィーにより精製することで、メチルN-[4-[6-[(4-クロロフェニル)-メチル-カルバモイル]-7-シアノ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]フェニル]カルバメートを黄色固体として得た。

¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ: 9.94(s, 1H), 8.47(b r s, 1H) 8.43(s, 1H), 7.99(s, 1H), 7.65(d, J=8.7Hz, 2H), 7.33-7.43(m, 4H), 7.25(b r d, J=6.6Hz, 2H), 3.72(s, 3H), 3.40(s, 3H)。

【0314】

実施例13：この実施例は、メチルN-[5-[6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート(化合物45)の調製を例示する。

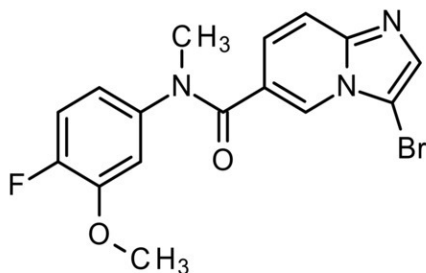
40

【0315】

ステップ1：3-ブromo-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

50

【化 8 3】



10

N, N-ジメチルアセトアミド (17.5 mL) 中の 3-ブロモイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボン酸 (0.700 g、2.90 mmol) の混合物に 4-フルオロ-3-メトキシ-N-メチル-アニリン (0.712 g、4.36 mmol)、続いて N-エチル-N-イソプロピル-プロパン-2-アミン (1.88 g、2.49 mL、14.5 mmol) 及びプロパンホスホン酸無水物 (酢酸エチル中 50%、4.32 mL、7.26 mmol) を添加した。反応混合物を 50℃で1時間攪拌した。その後、混合物を氷水に注ぎ入れ、次いで酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和 NaHCO₃ 水溶液及びブラインで洗浄し、MgSO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をジイソプロピルエーテルで処理したところ、析出物が生じた。析出物を濾過し、ジイソプロピルエーテルで洗浄することで、3-ブロモ-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドを白色固体として得た。

20

LC/MS (方法A) 保持時間 = 0.81分; [M+H]⁺ = 378

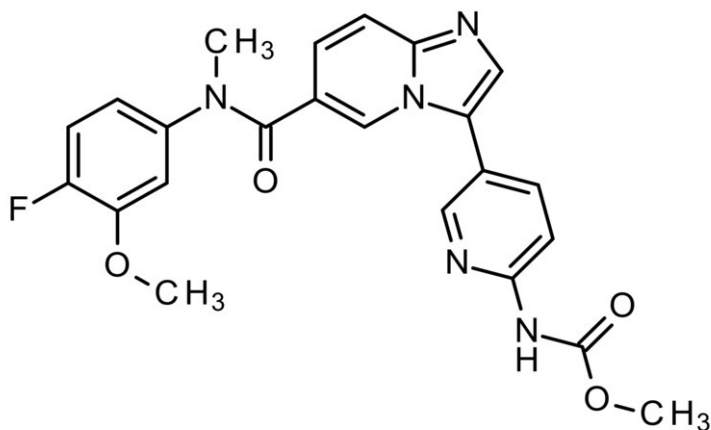
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 8.29 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.39 (dd, J = 9.5, 0.7 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 10.9, 8.7 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 7.3, 2.5 Hz, 1H), 6.62-6.70 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.52 (s, 3H)。

【0316】

ステップ2: N-[5-[6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートの調製

30

【化 8 4】



40

水 (4.3) 及び 1, 4-ジオキサン (12.8 mL) 中の 3-ブロモ-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミド (0.809 g、2.14 mmol、1当量) と、メチル N-[5-[6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ [

50

1, 2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート(0.877g、3.00mmol、1.4当量)と、炭酸セシウム(1.045g、3.21mmol、1.5当量)との混合物をアルゴンで5分間フラッシュした。次いで、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(0.127g、0.107mmol、0.05当量)を添加し、マイクロ波を照射しながら反応混合物を100℃で加熱し、1時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、その後、水を添加した。水層を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ(シクロヘキサン/[酢酸エチル/EtOH 3/1])で精製することで、メチルN-[5-[6-[(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートを白色固体として得た。

10

L C / M S (方法 A) 保持時間 = 0 . 7 0 ; [M + H] ⁺ = 4 5 0

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ: 8.28–8.26 (dd, J=0.7, 2.2 Hz, 1H), 8.20 (s, 2H), 8.15 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.55 (dd, J=2.4, 8.5 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=0.7, 9.4 Hz, 1H), 7.23 (dd, J=1.6, 9.3 Hz, 1H), 7.00 (dd, J=8.5, 10.7 Hz, 1H), 6.74 (dd, J=2.5, 7.3 Hz, 1H), 6.64–6.58 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 3.47 (s, 3H)

20

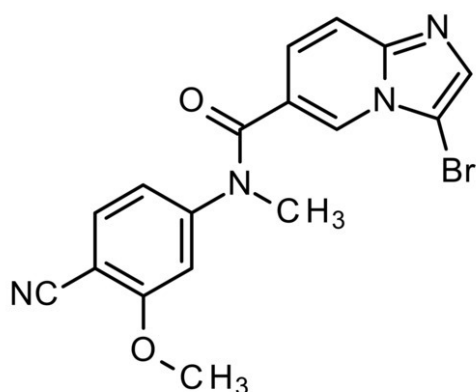
【 0 3 1 7 】

実施例 14：この実施例は、メチル N-〔5-〔6-〔(4-シアノ-3-メトキシフェニル)-メチル-カルバモイル〕イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕-2-ピリジル〕カルバメート (化合物 51) の調製を例示する。

【 0 3 1 8 】

ステップ1：3-プロモ-N-(4-シアノ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

【化 8 5】



30

アルゴン中で室温の2-メトキシ-4-(メチルアミノ)ベンゾニトリル(0.187 g、1.12 mmol)のトルエン(0.75 mL)溶液にトリメチルアルミニウムのトルエン溶液(0.45 g、0.56 mL、1.12 mmol)をゆっくりと添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌した後、メチル3-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシレート(0.100 g、0.372 mmol)を添加した。その後、反応混合物を90℃で1時間攪拌した。次いで、反応を0℃に冷却し、1MのHCl溶液で注意深くクエンチした。得られた混合物を、水層が塩基性pHに到達するまで飽和NaHCO₃水溶液で処理し、その後、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮し、シリカゲルカートリッジ(シクロヘキサン/[酢酸エチル/EtOH]; 3/1)で精製することで、3-ブロモ-N-(4-シアノ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン

40

50

－6－カルボキサミドを黄色固体として得た。

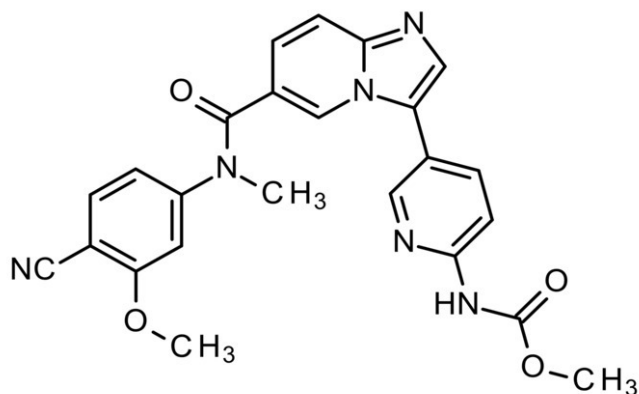
LC/MS（方法A）保持時間＝0.76分；[M+H]⁺＝385

NMR：¹H NMR（400MHz，CDCl₃）δ：ppm 8.43（s，1H），7.73（s，1H），7.67（d，J＝9.5Hz，1H），7.51（d，J＝8.0Hz，1H），7.22（dd，J＝9.5，1.5Hz，1H），6.74－6.81（m，2H），3.87（s，3H），3.59（s，3H）。

【0319】

ステップ2：メチルN－[5－[6－[(4－シアノ－3－メトキシフェニル)－メチルカルバモイル]イミダゾ[1，2－a]ピリジン－3－イル]－2－ピリジル]カルバメートの調製

【化86】



マイクロ波試験管に3－ブロモ－N－（4－シアノ－3－メトキシフェニル）－N－メチルイミダゾ[1，2－a]ピリジン－6－カルボキサミド（130mg、0.338mmol）、2－メトキシカルボニルアミノピリジン－5－ボロン酸ピナコールエステル（136mg、0.473mmol）、炭酸セシウム（167mg、0.506mmol）、1，4－ジオキサン（10mL）、水（3.4mL）及びテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）（19.7mg、0.0168mmol）を添加した。反応混合物をアルゴンでパージし、MWを照射しながら100℃で30分間加熱した。反応混合物を室温まで冷却し、これに水を添加し、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮し、シリカゲルカートリッジ（CH₂Cl₂/MeOH）で精製することで、メチルN－[5－[6－[(4－シアノ－3－メトキシフェニル)－メチルカルバモイル]イミダゾ[1，2－a]ピリジン－3－イル]－2－ピリジル]カルバメートをベージュ色の固体として得た。

LC/MS（方法A）保持時間＝0.68分；[M+H]⁺＝457

NMR：¹H NMR（400MHz，DMSO－d₆）δ：10.45（s，1H），8.40（dt，J＝3.3，1.6Hz，2H），8.00（dd，J＝8.7，0.7Hz，1H），7.77－7.85（m，1H），7.71－7.77（m，1H），7.57－7.63（m，1H），7.55（d，J＝9.5Hz，1H），7.34（d，J＝1.8Hz，1H），7.17－7.20（m，1H），6.92（dd，J＝8.4，1.8Hz，1H），3.80（s，3H），3.74（s，3H），3.44（s，3H）。

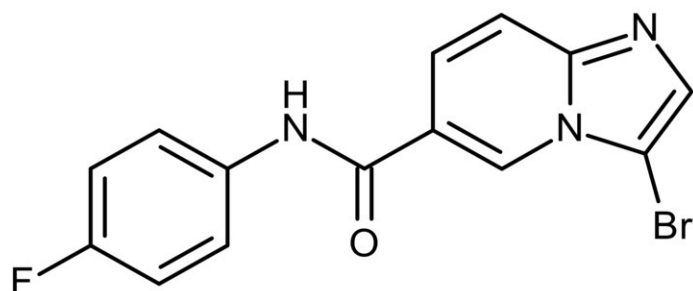
【0320】

実施例15：この実施例は、メチルN－[5－[6－[(4－フルオロフェニル)－(2－メトキシエチル)カルバモイル]イミダゾ[1，2－a]ピリジン－3－イル]－2－ピリジル]カルバメート（化合物76）の調製を例示する。

【0321】

ステップ1：3－ブロモ－N－（4－フルオロフェニル）イミダゾ[1，2－a]ピリジ

ン-6-カルボキサミドの調製
【化87】



10

ジメチルアセトアミド（16 mL）中の3-ブロモイミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボン酸（1.00 g、4.00 mmol）の溶液に4-フルオロアニリン（0.47 mL、4.8 mmol）、続いてN，N-ジイソプロピルエチルアミン（3.5 mL、20 mmol）及びプロパンホスホン酸無水物（酢酸エチル中50重量%、4.8 mL、8.0 mmol）を添加し、反応混合物を50℃で一晩攪拌した。その後、反応混合物を室温まで冷却し、水を添加し、混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。蒸発中に析出物が形成され、これを濾過し、酢酸エチルで洗浄することで、3-ブロモ-N-（4-フルオロフェニル）イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを黄色固体として得た。
LC/MS（方法A）保持時間=0.82；[M+H]⁺=334

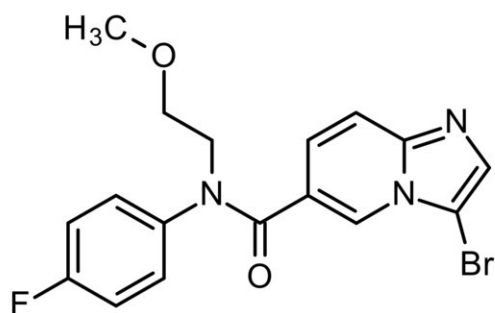
20

¹H NMR（400 MHz，DMSO-d₆）δ：10.57（s，1H），8.97（s，1H），7.83-7.89（m，2H），7.76-7.81（m，3H），7.21-7.27（m，2H）。

【0322】

ステップ2：3-ブロモ-N-（4-フルオロフェニル）-N-（2-メトキシエチル）イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドの調製
【化88】

30



ジエチルホルムアミド（3 mL）中の3-ブロモ-N-（4-フルオロフェニル）イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（0.100 g、0.299 mmol）の溶液に2-ブロモエチルメチルエーテル（0.064 g、0.043 mL、0.45 mmol）及び炭酸セシウム（0.294 g、0.898 mmol）を添加した。反応混合物を80℃で一晩攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、水を添加し、混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮し、シリカゲルカートリッジ（シクロヘキサン／酢酸エチル）で精製することで、3-ブロモ-N-（4-フルオロフェニル）-N-（2-メトキシエチル）イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを白色固体として得た。

40

LC/MS（方法A）保持時間=0.82分；[M+H]⁺=392

¹H NMR（400 MHz，DMSO-d₆）δ：8.37（br s，1H），7.6

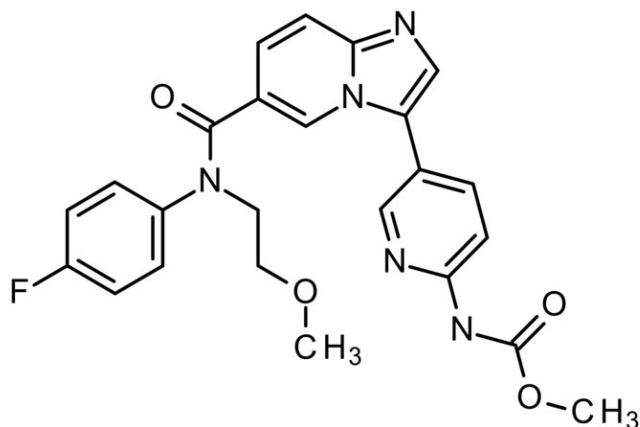
50

9 (s, 1H), 7.55–7.65 (m, 1H), 7.19–7.25 (m, 3H), 7.03 (t, J=8.4 Hz, 2H), 4.12 (t, J=5.4 Hz, 2H), 3.68 (t, J=5.4 Hz, 2H), 3.40 (s, 3H).

【0323】

ステップ3：メチルN-[5-[6-[(4-フルオロフェニル)-(2-メトキシエチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートの調製

【化89】



マイクロ波試験管に3-ブロモ-N-(4-フルオロフェニル)-N-(2-メトキシエチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(0.085g、0.22mmol)、2-メトキシカルボニルアミノピリジン-5-ボロン酸ピナコールエステル(0.087g、0.30mmol)、炭酸セシウム(0.107g、0.325mmol)、1,4-ジオキサン(6.5mL)、水(2.2mL)及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(0.013mg、0.011mmol)を入れた。反応混合物をアルゴンでパージし、MWを照射しながら100℃で30分間加熱した。反応混合物を室温まで冷却し、水を添加し、混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ(ジクロロメタン/MeOH)で精製することで、メチルN-[5-[6-[(4-フルオロフェニル)-(2-メトキシエチル)カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートをベージュ色の固体として得た。

LC/MS(方法A)保持時間=0.72分; [M+H]⁺=464

¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ: 10.45 (s, 1H), 8.37–8.42 (m, 1H), 8.31–8.37 (m, 1H), 8.02 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.77–7.85 (m, 2H), 7.46–7.53 (m, 1H), 7.32–7.40 (m, 2H), 7.08–7.18 (m, 3H), 3.98 (t, J=5.6 Hz, 2H), 3.74 (s, 3H), 3.51 (br t, J=5.6 Hz, 2H), 3.21 (s, 3H).

【0324】

実施例16：この実施例は、メチルN-[5-[6-[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメート(化合物77)の調製を例示する。

【0325】

ステップ1：3-ブロモ-N-(4-フルオロ-3-ヒドロキシーフェニル)-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

10

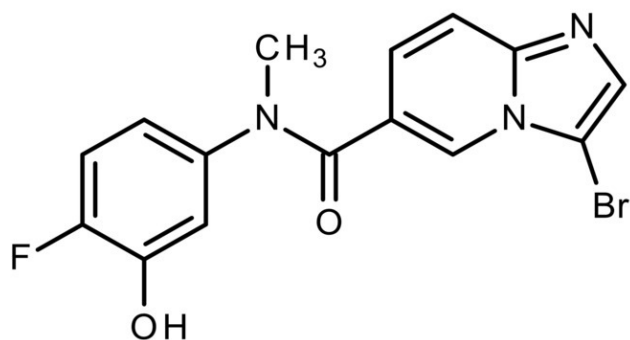
20

30

40

50

【化 9 0】



10

室温のジクロロメタン（12.0 mL）中の3-ブロモ-N-（4-フルオロ-3-メトキシフェニル）-N-メチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（実施例13、ステップ1で既述、0.910 g、2.41 mmol）の懸濁液に三臭化ホウ素（1 Mのジクロロメタン溶液、4.8 mL、4.81 mmol）を滴下した。反応混合物を室温で72時間攪拌した。次いで、反応混合物を非常にゆっくりと水の中に注ぎ入れ、飽和NaHCO₃水溶液で塩基性にし、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、MgSO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。シリカゲルカートリッジ（シクロヘキサン／〔酢酸エチル／EtOH 3／1〕）を溶離液として粗製残渣を精製することで、3-ブロモ-N-（4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル）-N-メチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを褐色のガムとして得た。

20

LC/MS（方法A）保持時間＝0.70分；[M+H]⁺＝364

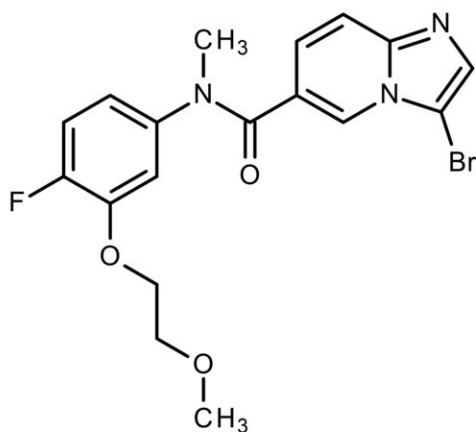
¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）δ：8.39（s, 1H）, 7.57（s, 1H）, 7.19–7.26（m, 1H）, 6.97–7.04（m, 2H）, 6.79（dd, J＝7.6, 2.9 Hz, 1H）, 6.59–6.66（m, 1H）, 3.51（s, 3H）。

【0326】

ステップ2：3-ブロモ-N-〔4-フルオロ-3-（2-メトキシエトキシ）フェニル〕-N-メチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドの調製

30

【化 9 1】



40

3-ブロモ-N-（4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル）-N-メチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（0.100 g、0.275 mmol）と、1-ブロモ-2-メトキシエタン（0.412 mmol、0.039 mL）と、炭酸カリウム（0.096 mg、0.69 mmol）との混合物をジメチルホルムアミド（4 mL）に溶解した。反応混合物を室温で3.5時間攪拌した後、酢酸エチルで希釈し、

50

水でクエンチし、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及びブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ（シクロヘキサン／[酢酸エチル／ EtOH 3／1]）で精製することで、3-ブロモ-N-[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドをオレンジ色の固体として得た。

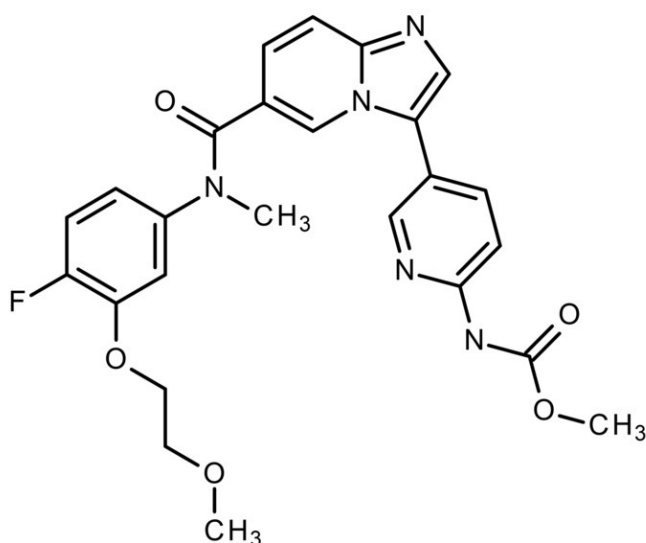
LC/MS（方法A）保持時間=0.82分； $[\text{M}+\text{H}]^+=422$

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.31 (dd, $J=1.8, 1.1$ Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.38 (dd, $J=9.5, 1.1$ Hz, 1H), 7.09 (dd, $J=9.5, 1.5$ Hz, 1H), 7.00 (dd, $J=10.7, 8.5$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J=7.3, 2.5$ Hz, 1H), 6.65–6.72 (m, 1H), 4.08–4.13 (m, 2H), 3.67–3.73 (m, 2H), 3.51 (s, 3H), 3.40 (s, 3H).

【0327】

ステップ3：メチル-N-[5-[6-[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートの調製

【化92】



3-ブロモ-N-[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-N-メチル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド (0.088 g、0.21 mmol) が入ったマイクロ波試験管に2-メトキシカルボニルアミノピリジン-5-ボロン酸ピナコールエステル (0.084 g、0.29 mmol)、炭酸セシウム (0.103 g、0.313 mmol)、1,4-ジオキサン (6.3 mL)、水 (2.1 mL) 及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (0) (0.012 g、0.010 mmol) を添加した。反応混合物をアルゴンでパージし、MWを照射しながら100℃で30分間加熱した。反応を水でクエンチし、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ（シクロヘキサン／[酢酸エチル／ EtOH 3／1]）で精製することで、N-[5-[6-[4-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-メチル-カルバモイル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]カルバメートをオレンジ色のガムとして得た。

LC/MS（方法A）保持時間=0.72分； $[\text{M}+\text{H}]^+=494$

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ : 8.28 (s, 1H), 8.12–8.16 (m, 2H), 8.02 (d, $J=1.5$ Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.59–7.64 (m, 1H), 7.53–7.58 (m, 1H), 7.35 (dd, J

= 9.5, 1.8 Hz, 1H), 6.94–7.02 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 7.3, 2.5 Hz, 1H), 6.54–6.58 (m, 1H), 4.18–4.23 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.80–3.86 (m, 2H), 3.50 (s, 3H), 3.47 (s, 3H).

【0328】

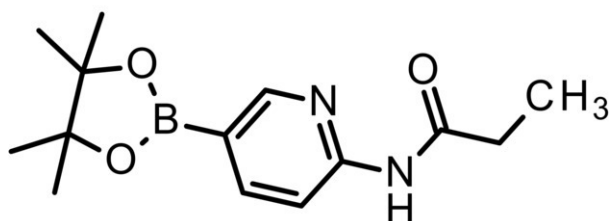
実施例 17：この実施例は、N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-3-[6-(プロパノイルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(化合物151)の調製を例示する。

【0329】

ステップ1：N-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]プロパンアミドの調製

10

【化93】



20

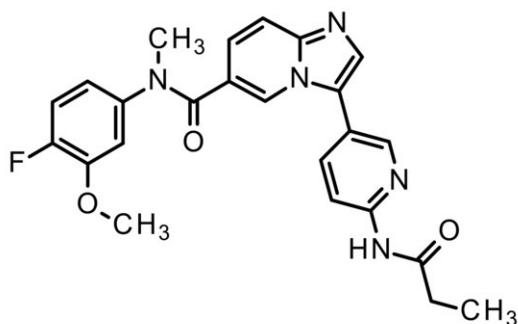
酢酸エチル(50 mL)中の2-アミノピリジン-5-ボロン酸ピナコールエステル(1.0 g、4.3 mmol)の攪拌溶液に窒素中において0℃でピリジン(1.4 mL、17.3 mmol)を添加し、10分間攪拌した。次いで、塩化プロパノイル(1.597 g、1.508 mL、17.26 mmol)を添加し、反応混合物を周囲温度で1時間攪拌した。その後、反応混合物を水で希釈した。水層を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮することで、N-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]プロパンアミドをガムとして得た。この粗製物質は、さらに精製することなく次のステップで使用した。

【0330】

ステップ2：N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-3-[6-(プロパノイルアミノ)-3-ピリジル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミドの調製

30

【化94】



40

水(2.05 mL)及びアセトニトリル(4.10 mL)中の、3-ブロモ-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキサミド(0.200 g、0.513 mmol)と、N-[5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-ピリジル]プロパンアミド(0.212 g、0.769 mmol)と、炭酸ナトリウム(0.163 g、1.54 mmol)との混合物を窒素で10分間フラッシュした。次いで、クロロ(2

50

ージシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II) (0.042 g、0.051 mmol) を添加し、マイクロ波を照射しながら反応混合物を100℃で加熱し、3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、その後、水を添加した。水層を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。粗製残渣をC18シリカカートリッジ (溶離液として40%水-アセトニトリル) で精製することで、N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-3-[6-(プロパノイルアミノ)-3-ピリジル] イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドを白色固体として得た。

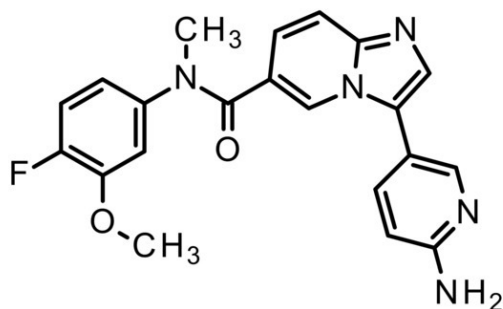
¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ: 10.66 (s, 1H), 8.43 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.27 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.77 (dd, J=8.6, 2.3 Hz, 1H), 7.53 (d, J=9.4 Hz, 1H), 7.30 (dd, J=7.9, 2.5 Hz, 1H), 7.21 (dd, J=9.4, 1.5 Hz, 1H), 7.07 (dd, J=11.3, 8.6 Hz, 1H), 6.78 (br d, J=1.1 Hz, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 2.44-2.49 (m, 2H), 1.12 (t, J=7.6 Hz, 3H)

[0331]

実施例 18: この実施例は、N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-3-[6-[メトキシ(メチル)カルバモイル]アミノ]-3-ピリジル]-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミド (化合物 79) の調製を例示する。

[0332]

ステップ 1: 3-(6-アミノ-3-ピリジル)-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドの調製 [化 95]



水 (3.97 mL) 及び 1, 4-ジオキサン (11.9 mL) 中の 3-ブromo-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミド (0.300 g、0.793 mmol、1 当量) と、5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル) ピリジン-2-アミン (0.249 g、1.11 mmol) と、炭酸セシウム (0.39 g、1.19 mmol) との混合物をアルゴンで10分間フラッシュした。次いで、テトラキス(トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (0.046 g、0.040 mmol) を添加し、マイクロ波を照射しながら反応混合物を100℃で1時間加熱した。反応混合物を室温まで冷却し、その後、水を添加した。水層を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮することで、3-(6-アミノ-3-ピリジル)-N-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-カルボキサミドの粗製塊を褐色固体として得た。これは、さらに精製することなく次のステップに用いた。

LC/MS (方法 A) 保持時間 = 0.51 分; [M+H]⁺ = 392

[0333]

10

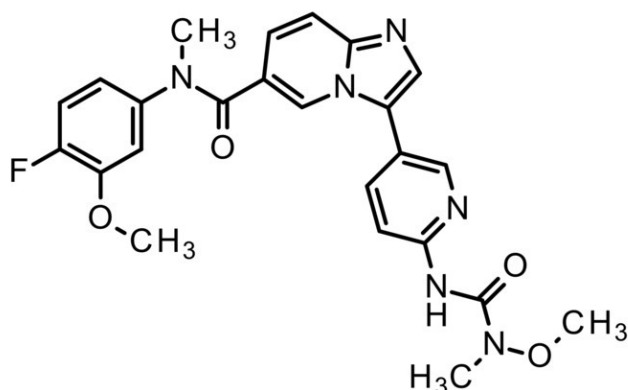
20

30

40

50

ステップ 2：N-（4-フルオロ-3-メトキシフェニル）-3-〔6-〔〔メトキシ（メチル）カルバモイル〕アミノ〕-3-ピリジル〕-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドの調製
【化 9 6】



10

酢酸エチル（0.48 mL）中の3-（6-アミノ-3-ピリジル）-N-（4-フルオロ-3-メトキシフェニル）-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミド（0.075 g、0.19 mmol）の溶液に窒素中において0℃でピリジン（0.15 mL、1.9 mmol）を添加した。反応混合物を10分間攪拌した後、N-メトキシ-N-メチルカルバモイルクロリド（120 mg、0.96 mmol）を添加し、反応混合物を周囲温度でさらに2時間攪拌した。その後、反応混合物を水で希釈した。水層を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過し、減圧濃縮し、シリカゲルカートリッジ（酢酸エチル／シクロヘキサン）で精製することで、N-（4-フルオロ-3-メトキシフェニル）-3-〔6-〔〔メトキシ（メチル）カルバモイル〕アミノ〕-3-ピリジル〕-N-メチル-イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-6-カルボキサミドを褐色固体として得た。

20

LC/MS（方法A）保持時間=0.73；[M+H]⁺=479

¹H NMR（400 MHz，CDCl₃）δ：8.55（s，1H）8.26-8.35（m，1H），8.24（d，J=1.8 Hz，1H），8.21（br s，1H），7.65-7.80（m，2H），7.52-7.60（m，1H），7.38（dd，J=9.5，1.5 Hz，1H），7.02（dd，J=10.5，8.7 Hz，1H），6.66-6.83（m，1H），6.61（dt，J=8.4，3.1 Hz，1H），3.85（s，3H），3.81（s，3H），3.48（s，3H），3.28（s，3H）。

30

【0334】

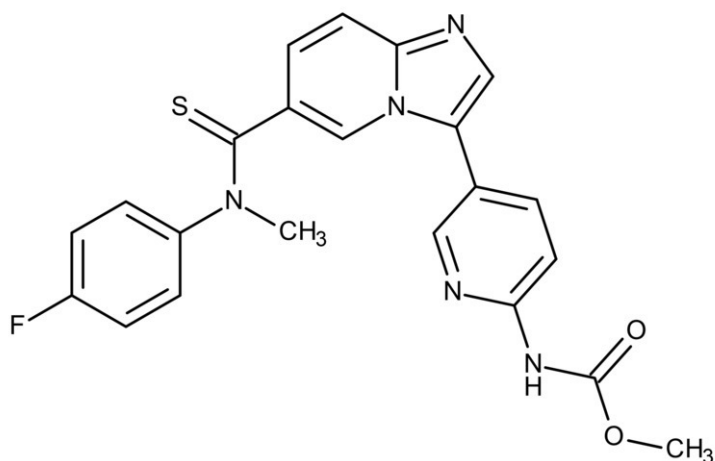
実施例 19：この実施例は、メチル N-〔5-〔6-〔（4-フルオロフェニル）-メチル-カルバモチオイル〕イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-3-イル〕-2-ピリジル〕カルバメート（化合物 164）の調製を例示する。

【0335】

ステップ 1：メチル N-〔5-〔6-〔（4-フルオロフェニル）-メチル-カルバモチオイル〕イミダゾ〔1，2-a〕ピリジン-3-イル〕-2-ピリジル〕カルバメートの調製

40

【化 9 7】



10

トルエン（2 mL）中のメチル N-〔5-〔6-〔（4-フルオロフェニル）-メチル-カルバモイル〕イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕-2-ピリジル〕カルバメート（0.205 g、0.489 mmol）の混合物が入ったマイクロ波試験管にローソン試薬（0.112 g、0.269 mmol）を添加した。得られた混合物を100℃に加熱し、2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、溶媒を減圧留去した。粗製残渣をシリカゲルカートリッジ（シクロヘキサン／〔酢酸エチル／EtOH 3／1〕）で精製することで、メチル N-〔5-〔6-〔（4-フルオロフェニル）-メチル-カルバモチオイル〕イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-3-イル〕-2-ピリジル〕カルバメートを黄色固体として得た。

20

LC/MS（方法A）保持時間＝0.77分；[M+H]⁺＝435

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）δ：8.84（br s, 1H）, 8.32（d, J＝2.2 Hz, 1H）, 8.20（d, J＝8.7 Hz, 1H）, 8.16（br s, 1H）, 7.67（s, 1H）, 7.64（br dd, J＝8.7, 1.8 Hz, 1H）, 7.50（br d, J＝9.4 Hz, 1H）, 7.21（dd, J＝9.4, 1.8 Hz, 1H）, 7.05－7.12（m, 2H）, 6.97－7.05（m, 2H）, 3.89（br s, 3H）, 3.87（s, 3H）。

30

【0336】

生物学の実施例：

本発明の化合物の殺菌・殺カビ活性を以下のとおりに試験した：

－ フィトフソライnfestans（*Phytophthora infestans*）／トマト／葉片予防剤（晩枯病）：

トマトの葉片をマルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から1日後、真菌の孢子懸濁液を葉片に接種する。気候キャビネット内において、接種した葉片を24時間の暗闇、これに続く、12時間の光／12時間の暗闇の光環境下、16℃及び75% rhでインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用の葉片に現れた時点で（適用から5～7日後）、未処理のものと比較した病害防除割合として評価する。

40

【0337】

表Aの以下の化合物は、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比較した場合、200 ppmで少なくとも80%のフィトフソライnfestans（*Phytophthora infestans*）の防除をもたらした：

2、3、4、6、7、10、11、15、19、25、26、27、31、32、37、43、45、46、48、50、51、52、53、55、57、62、63、70、71、73、75、76、77、80、81、82、83、84、85、86、89、90、92、93、94、95、96、97、98、99、100、105、107、109

50

、 110、113、115、116、119、123、124、128、129、130
、 132、134、136、140、149、158、164、168、169、170
、 171、172、173、174、177、178。

ー プラズモパラビチコーラ (*Plasmopara viticola*) / ブドウ / 葉片予防剤 (晩枯病) :

ブドウのツルの葉片をマルチウェルプレート (24ウェル型) 中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から1日後、真菌の孢子懸濁液を葉片に接種する。気候キャビネット内において、接種した葉片を、12時間の光 / 12時間の暗闇の光環境下、19℃及び80% rhでインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用の葉片に現れた時点で (適用から6~8日後)、未処理のものと比較した病害防除割合として評価する。

10

【0338】

表Aの以下の化合物は、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比較した場合、200 ppmで少なくとも80%のプラズモパラビチコーラ (*Plasmopara viticola*) の防除をもたらした:

1、2、3、4、6、7、9、11、15、19、25、26、27、31、32、37、45、46、48、50、51、53、57、58、61、63、64、70、73、75、76、78、82、84、85、86、89、90、93、94、95、96、98、100、105、107、110、113、116、124、126、136、137、149、158、164、169、170、171、172、173、174、177、178。

20

ー ピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) / 液体培養 (苗立枯病) :

新たに増殖させた液体培養の真菌の菌糸体断片及び卵胞子を栄養培地 (PDBポテトデキストロース培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96ウェル型) に入れた後、真菌の菌糸体 / 孢子混合物が入った栄養培地を添加する。テストプレートを24℃でインキュベートし、適用から2~3日間後に成長の阻害を測光法により測定する。

【0339】

表Aの以下の化合物は、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比較した場合、20 ppmで少なくとも80%のピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) の防除をもたらした:

1、2、3、4、6、7、9、10、11、12、13、15、16、18、19、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、37、39、41、42、43、45、46、48、50、51、52、53、54、55、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、68、69、70、71、72、73、75、76、77、78、80、81、82、83、84、85、86、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、104、105、107、108、109、110、112、113、115、116、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、132、136、137、140、141、143、145、147、148、149、150、158、164、165、166、168、169、170、171、172、173、174、176、178。

30

40

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/077777

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D471/04 A01N43/90
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)
A01N 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.
A	EP 1 229 028 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 7 August 2002 (2002-08-07) the whole document, in particular paragraphs [0001]-[0002], [0006]-[0013], table 5 compounds 131, 135 and 139 ----- -/--	1-15

☒ 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

17 January 2023

Date of mailing of the international search report

09/02/2023

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

Hanisch, Inken

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/077777

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	ZOU BIN ET AL: "Lead Optimization of Imidazopyrazines: A New Class of Antimalarial with Activity on Plasmodium Liver Stages", ACS MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS , vol. 5, no. 8 6 July 2014 (2014-07-06), pages 947-950, XP055840395, US ISSN: 1948-5875, DOI: 10.1021/ml500244m Retrieved from the Internet: URL:https://pubs.acs.org/doi/pdf/10.1021/m1500244m the whole document, in particular the abstract, compounds 1 and 2 e.g. in figure 1, compounds 19 and 20 in scheme 1 and table 1 -----	1-15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/077777

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 1229028 A1	07-08-2002	EP 1229027 A1	07-08-2002
		EP 1229028 A1	07-08-2002
		EP 1229037 A1	07-08-2002

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

A 0 1 N 47/30 (2006.01)
A 0 1 N 53/12 (2006.01)
A 0 1 G 7/06 (2006.01)
A 0 1 C 1/08 (2006.01)

A 0 1 N 47/18 1 0 1 A
A 0 1 N 47/12 1 0 1
A 0 1 N 47/30 D
A 0 1 N 53/12
A 0 1 G 7/06 A
A 0 1 C 1/08

,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,D
K,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),O
A(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,B
B,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB
,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,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,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,W
S,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100212509

弁理士 太田 知子

(72)発明者 ジャンマール ステファヌ アンンドレ マリー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーク

(72)発明者 ブリューム マティアス

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーク

(72)発明者 ルンブロソ アレクサンドル フランコ ジャン カミーユ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーク

(72)発明者 ジェルマン ニコラ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーク

(72)発明者 プリオ マルタン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーク

F ターム (参考) 2B022 EA10

2B051 AB01 AB03 AB06 BA09 BB01 BB14

4H011 AA01 AA03 BB09 BB13 BB14 BB15 DA13 DD03