

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3881654号  
(P3881654)

(45) 発行日 平成19年2月14日(2007.2.14)

(24) 登録日 平成18年11月17日(2006.11.17)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 207/20 (2006.01)

C O 7 D 207/20

C O 7 D 405/12 (2006.01)

C O 7 D 405/12

C O 7 D 409/12 (2006.01)

C O 7 D 409/12

C O 7 D 413/10 (2006.01)

C O 7 D 413/10

A O 1 N 43/36 (2006.01)

A O 1 N 43/36

B

請求項の数 24 (全 99 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2003-528124 (P2003-528124)  
 (86) (22) 出願日 平成14年9月4日(2002.9.4)  
 (65) 公表番号 特表2005-502714 (P2005-502714A)  
 (43) 公表日 平成17年1月27日(2005.1.27)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2002/009866  
 (87) 国際公開番号 W02003/024220  
 (87) 国際公開日 平成15年3月27日(2003.3.27)  
 審査請求日 平成17年4月22日(2005.4.22)  
 (31) 優先権主張番号 101 45 772.3  
 (32) 優先日 平成13年9月17日(2001.9.17)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

(73) 特許権者 302063961  
 バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ40789モンハイム・アルフレー  
 トーノベルーシュトラッセ50  
 (74) 代理人 100062007  
 弁理士 川口 義雄  
 (74) 代理人 100113332  
 弁理士 一入 章夫  
 (74) 代理人 100114188  
 弁理士 小野 誠  
 (74) 代理人 100103920  
 弁理士 大崎 勝真  
 (74) 代理人 100124855  
 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

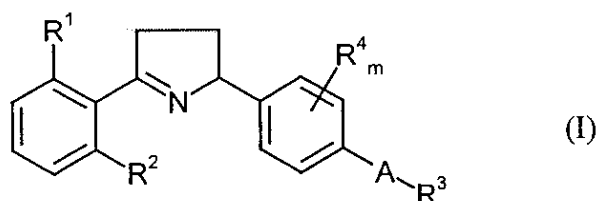
(54) 【発明の名称】 農薬として使用されるデルタ1-ピロリン

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I):

【化1】



(式中、

R<sup>1</sup> は、ハロゲンまたはメチルを表し、R<sup>2</sup> は、水素またはハロゲンを表し、R<sup>3</sup> は、-N(R<sup>6</sup>)-C(=Y)-X-R<sup>7</sup>を表し、ならびに

a) Aは、アリーレン、または窒素原子0個から3個、酸素原子0個から1個および/もしくは硫黄原子0個から1個含むヘテロ原子1個から3個を有する5員ヘテロアリーレン、あるいは窒素原子3個を有する6員ヘテロアリーレン、または窒素原子1個およびさらなるヘテロ原子1個から2個(このうち、0個から2個は、酸素原子であってもよく、および/または0個から2個は、硫黄原子であってもよい)を有する6員ヘテロアリーレ

ンを表し、この場合、各アリーレンまたはヘテロアリーレンは、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により場合によっては1回から4回置換されており、且つ、

Yは、O（酸素）またはS（硫黄）を表し、且つ、

Xは、O（酸素）、S（硫黄）または $NR^8$ を表すか、

b) Aは、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては1回または2回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Yは、O（酸素）またはS（硫黄）を表し、且つ、

Xは、S（硫黄）または $NR^8$ を表すか、

c) Aは、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては1回または2回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Yは、S（硫黄）を表し、且つ、

Xは、O（酸素）を表すか、

d) Aは、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては1回または2回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Yは、O（酸素）を表し、且つ、

Xは、O（酸素）を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  は互いに無関係に、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシまたはハロアルキルチオを表し、

mは、0、1、2、3または4を表し、

$R^6$  は、水素またはアルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  は互いに無関係に水素を表すか、ハロゲン、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオおよびハロゲンアルコキシアルコキシから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回以上置換されているアルキルまたはアルケニルを表すか；

ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルカルボニルおよびアルコシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回以上置換されているシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、飽和または不飽和5員～10員ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、アルキルにより場合によっては1回以上置換されているアルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $-O-$ 、 $-S-$  および  $-NR^9-$  から選択されるさらなるヘテロ原子基を場合によっては含んでもよく、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびハロアルキルチオから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回以上置換されていてもよい飽和または不飽和5員～10員複素環を表し、

$R^9$  は、水素、アルキルまたはアルケニルを表す）  
の  $^1$  - ピロリン。

#### 【請求項2】

$R^1$  が、フッ素、塩素、臭素またはメチルを表し、

$R^2$  が、水素、フッ素、塩素または臭素を表し、

$R^3$  が、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) Aが、アリーレン、または窒素原子0個から3個、酸素原子0個から1個および/もしくは硫黄原子0個から1個含むヘテロ原子1個から3個を有する5員ヘテロアリーレン、あるいは窒素原子3個を有する6員ヘテロアリーレン、または窒素原子1個およびさ

10

20

30

40

50

らなるヘテロ原子 1 個から 2 個（このうち、0 個から 2 個は、酸素原子であってもよく、および / または 0 個から 2 個は、硫黄原子であってもよい）を有する 6 員ヘテロアリーレンを表し、これらは、各々、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により場合によっては 1 回から 3 回置換されており、且つ、

Y が、O（酸素）または S（硫黄）を表し、且つ、

X が、O（酸素）、S（硫黄）または  $NR^8$  を表すか、

b) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O（酸素）または S（硫黄）を表し、且つ、

X が、S（硫黄）または  $NR^8$  を表すか、

c) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、S（硫黄）を表し、且つ、

X が、O（酸素）を表すか、

d) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O（酸素）を表し、且つ、

X が、O（酸素）を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシまたは  $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオを表し、

m が、0、1、2 または 3 を表し、

$R^6$  が、水素または  $C_1 \sim C_6$  - アルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 \sim C_6$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルキルチオおよび  $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されている  $C_1 \sim C_{20}$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_{20}$  - アルケニルを表すか；

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_6$  - アルコシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回から 4 回置換されている、 $C_3 \sim C_{12}$  - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、アリール、アリール -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、窒素原子 0 個から 4 個、非隣接酸素原子 0 個から 2 個および / もしくは非隣接硫黄原子 0 個から 2 個を含むヘテロ原子 1 ~ 4 個を有する飽和または不飽和 5 員 ~ 10 員ヘテロシクリルまたはヘテロシクリル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルにより場合によっては 1 回から 4 回置換されている  $C_2 \sim C_4$  - アルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、-O-、-S- および - $NR^9$  - から選択されるさらなるヘテロ原子基を場合によっては含んでもよく、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシおよび / または  $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により

10

20

30

40

50

場合によっては 1 回から 4 回置換されていてよい飽和または不飽和 5 員 ~ 10 員複素環を表し、ならびに

$R^9$  が、水素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルを表す、請求項 1 に記載の式 (I) の  $^1$  - ピロリン。

【請求項 3】

$R^1$  が、フッ素、塩素またはメチルを表し、

$R^2$  が、水素、フッ素または塩素を表し、

$R^3$  が、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているフェニレン、ピロリレン、フリレン、チエニレン、ピラジレン、イミダジレン、トリアジレン、チアジレンまたはオキサジレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素)、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

b) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

c) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表すか、

d) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ；各場合、フッ素、塩素および / もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシまたは  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオを表し、

m が、0、1 または 2 を表し、

$R^6$  が、水素または  $C_1 \sim C_4$  - アルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルアミノ、ジ- ( $C_1 \sim C_4$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルキルチオおよび  $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ (各場合、フッ素、塩素および / または臭素原子を 1 個から 21 個有する) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されている  $C_1 \sim C_{16}$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_{16}$  - アルケニルを表すか；

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および / もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する)、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回から 3 回置換されている、 $C_3 \sim C_{10}$  - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、テトラゾリル、フリル、フル

10

20

30

40

50

フリル、ベンゾフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テニル、ベンゾチエニル、チオラニル、ピロリル、インドリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、チアゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、トリアジニル、トリアゾリル、キノリニルまたはイソキノリニルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルにより場合によっては1回から3回置換されている  $C_2 \sim C_3$  - アルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-NR^9-$  から選択されるさらなるヘテロ原子群を場合によっては含んでもよく、フッ素、塩素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシおよび/または  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオ（各場合、フッ素、塩素および/もしくは臭素原子を1個から9個有する）から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回から4回置換されていてもよい飽和または不飽和5員～7員複素環を表し、ならびに

$R^9$  が、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルを表す、請求項1に記載の式(I)の<sup>1</sup> - ピロリン。

#### 【請求項4】

$R^1$  が、フッ素または塩素を表し、

$R^2$  が、水素またはフッ素を表し、

$R^3$  が、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては1回置換されている1, 2 - フェニレン、1, 4 - フェニレン、2, 5 - ピロリレン、2, 5 - フリレン、2, 4 - フリレン、2, 5 - チエニレン、2, 4 - チエニレン、2, 5 - チアジレン、2, 4 - チアジレン、2, 5 - オキサジレンまたは2, 4 - オキサジレンを表し、且つ、

Y が、O（酸素）またはS（硫黄）を表し、且つ、

X が、O（酸素）、S（硫黄）または  $NR^8$  を表すか、

b) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては1回置換されている2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O（酸素）またはS（硫黄）を表し、且つ、

X が、S（硫黄）または  $NR^8$  を表すか、

c) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては1回置換されている2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、S（硫黄）を表し、且つ、

X が、O（酸素）を表すか、

d) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては1回置換されている2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O（酸素）を表し、且つ、

X が、O（酸素）を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、n - プロボキシ、i - プロボキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、トリフルオロメチルチオまたはトリフルオロエチルチオを表し、

m が、0 または 1 を表し、

$R^6$  が、水素、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル、 $n$ -ブチル、 $i$ -ブチル、 $s$ -ブチルまたは  $t$ -ブチルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、ジ- ( $C_1 \sim C_4$ -アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および/または臭素原子を1個から21個有する)、 $C_1 \sim C_8$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ (フッ素、塩素および/または臭素原子を1個から17個有する) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回以上置換されている  $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルまたは  $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニルを表すか;

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および/もしくは臭素原子を1個から9個有する)、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回から3回置換されている、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、シクロプロピルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、テトラゾリル、フリル、フルフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テニル、ベンゾチエニル、チオラニル、ピロリル、インドリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、チアゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、トリアジニル、トリアゾリル、キノリニルまたはイソキノリニルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、同じまたは異なるメチル、エチル、 $n$ -プロピルまたは  $i$ -プロピル置換基により、各々、場合によっては1回または2回置換されているメチレンまたはエチレンを表すか、

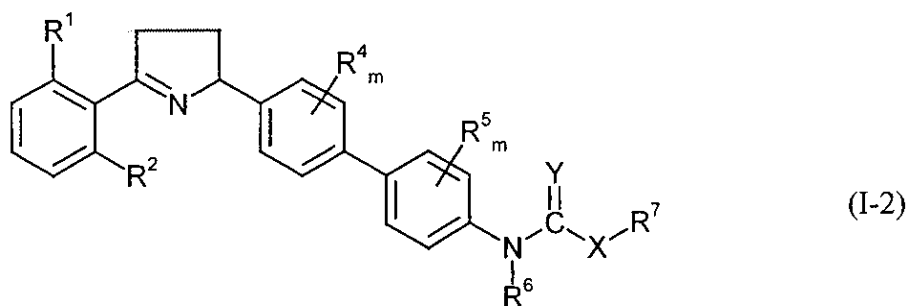
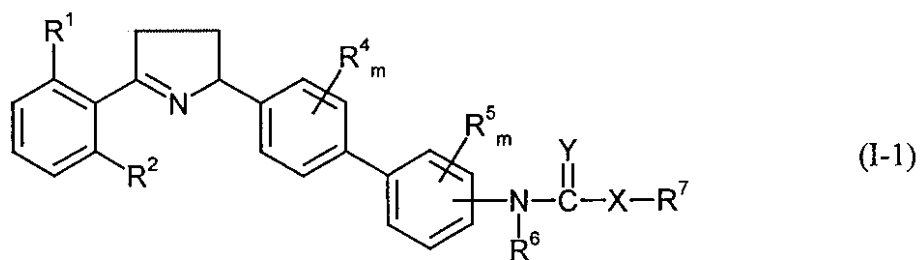
$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル、 $n$ -ブチル、 $i$ -ブチル、 $s$ -ブチル、 $t$ -ブチル、メトキシ、エトキシ、 $n$ -プロポキシ、 $i$ -プロポキシ、 $n$ -ブトキシ、 $i$ -ブトキシ、 $s$ -ブトキシ、 $t$ -ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、 $n$ -プロピルチオ、 $i$ -プロピルチオ、 $n$ -ブチルチオ、 $i$ -ブチルチオ、 $s$ -ブチルチオ、 $t$ -ブチルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および/または臭素原子を1個から9個有する)、ピペラジノラジカル ( $R^9$  により第二窒素原子が置換されている) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回から4回置換されていてもよいピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペラジノ、ピロリジノ、オキサゾリジノ、チアゾリジノ、4H-1-オキサジニル、4H-1-チアジニル系からの5員~6員複素環を表し、ならびに

$R^9$  が、水素、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル、 $n$ -ブチル、 $i$ -ブチル、 $s$ -ブチル、 $t$ -ブチル、ビニルまたはアリルを表す、  
請求項1に記載の式(I)の<sup>1</sup>-ピロリン。

【請求項5】

式(I-1)および/または(I-2):

## 【化2】



(これらの各式中、

a) Yは、O(酸素)またはS(硫黄)を表し、且つ、

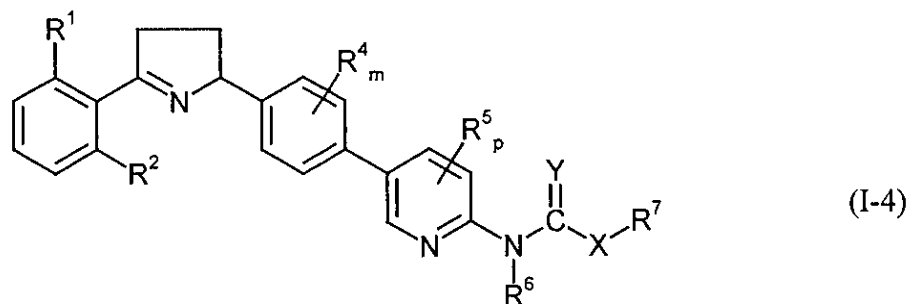
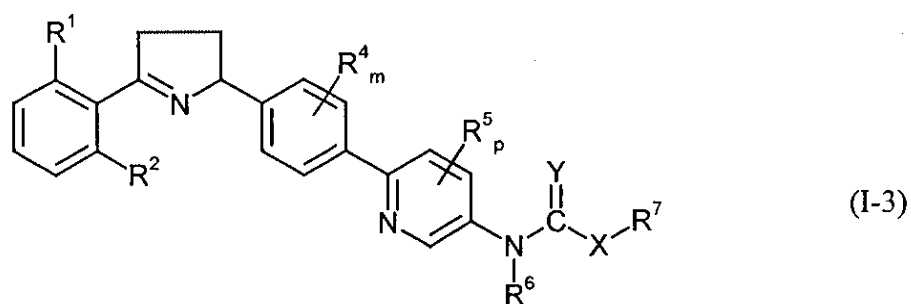
Xは、O(酸素)、S(硫黄)またはNR<sup>8</sup>を表し、ならびに

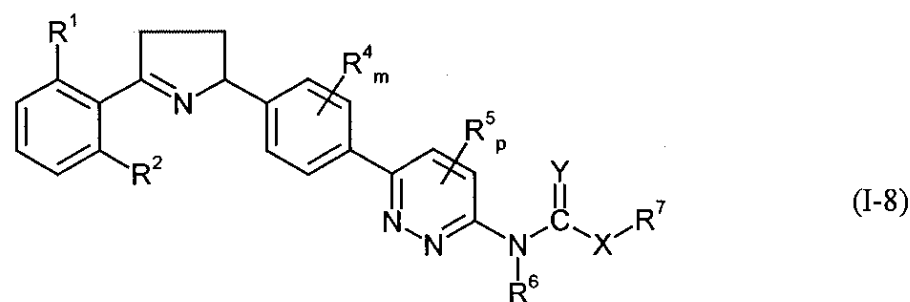
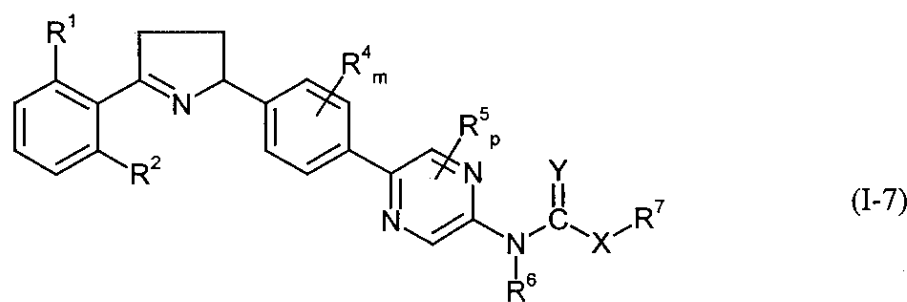
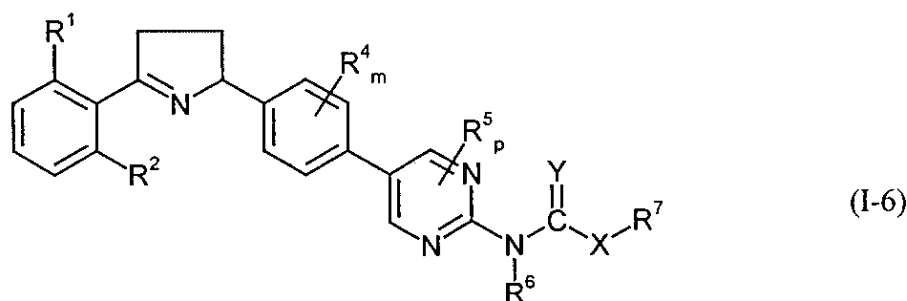
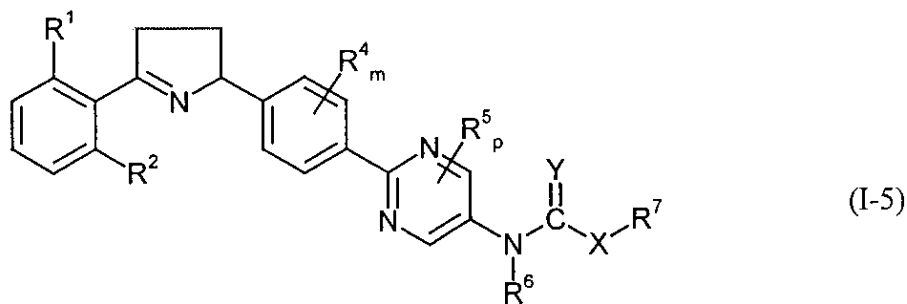
R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、m、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>は、請求項1で与えた意味を有する)の1-ピロリン。

## 【請求項6】

式(I-3)から(I-8)：

## 【化3】





(これらの各式中、

p は、0、1 または 2 を表し、

b) Y は、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X は、S (硫黄) または N R<sup>8</sup> を表すか、

c) Y は、S (硫黄) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表すか、

d) Y は、O (酸素) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表し、ならびに

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、m、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、請求項 1 で与えた意味を有する)

の 1 - ピロリン。

【請求項 7】

A が、フェニレンを表す、請求項 1 に記載の式 (I) の 1 - ピロリン。

【請求項 8】

A が、ピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表す、請

10

20

30

40

50



求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 9】

Y が、O (酸素) を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 10】

X が、O (酸素) または N R<sup>8</sup> を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 11】

Y および X が、各々、O (酸素) を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 12】

Y が、O (酸素) を表し、X が、N R<sup>8</sup> を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。 10

【請求項 13】

A がフェニレンを表し、Y が O (酸素) または S (硫黄) を表し、X が O (酸素)、S (硫黄) または N R<sup>8</sup> を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 14】

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、各々、フッ素を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 15】

R<sup>1</sup> が、メチルを表し、R<sup>2</sup> が、水素を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。 20

【請求項 16】

R<sup>1</sup> が、塩素を表し、R<sup>2</sup> が、水素を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 17】

R<sup>1</sup> が、塩素を表し、R<sup>2</sup> が、フッ素を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

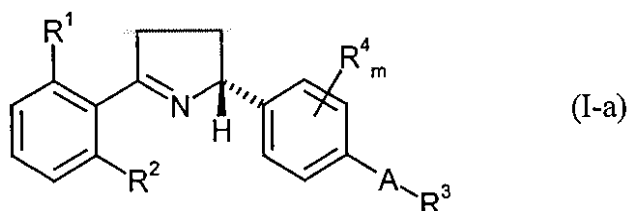
【請求項 18】

R<sup>6</sup> が、水素を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の <sup>1</sup> - ピロリン。

【請求項 19】

ピロリン環の 5 位に (R) 型立体配置を有する式 (I - a) : 30

【化 4】



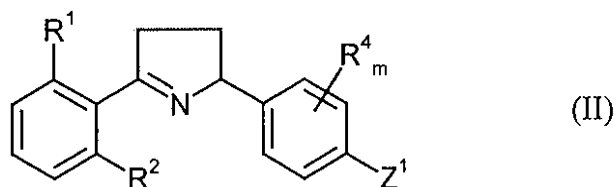
(式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、A、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> および m は、請求項 1 で与えた意味を有する) の <sup>1</sup> - ピロリン。 40

【請求項 20】

A) 式 (II) :

【化 5】



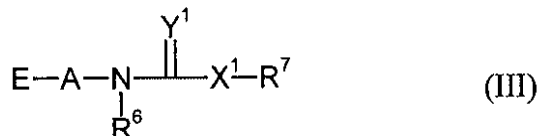
(この式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、ならびに

$Z^1$  は、塩素、臭素、ヨウ素、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  または  $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$  を表す)

の  $^1$ -ピロリンを、式 (III) :

【化 6】



10

(この式中、

$A$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、

$Y^1$  は、 $O$  (酸素) を表し、

$X^1$  は、 $O$  (酸素) または  $\text{NR}^8$  を表し、

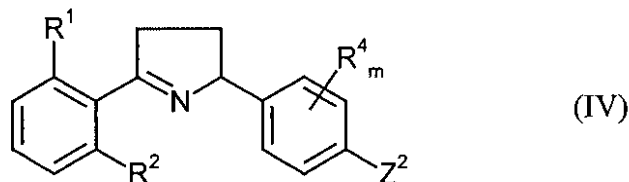
$E$  は、塩素、臭素、ヨウ素、 $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  または  $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$  を表す)

の (複素) 環と、触媒の存在下、ジボロン酸エステル の存在下、および適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下、タンデム反応で反応させること、または

20

B) 式 (IV) :

【化 7】



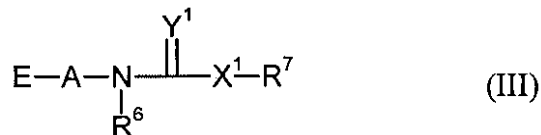
(この式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、

$Z^2$  は、 $-\text{B}(\text{OH})_2$ 、(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン)-2-イル、(5, 5-ジメチル-1, 3, 2-ジオキサボリナン)-2-イル、(4, 4, 6-トリメチル-1, 3, 2-ジオキサボリナン)-2-イルまたは 1, 3, 2-ベンゾジオキサボロール-2-イルを表す)

30

の  $^1$ -ピロリンを、式 (III) :

【化 8】



40

(この式中、

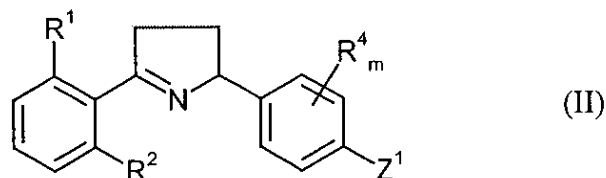
$A$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、

$E$ 、 $Y^1$  および  $X^1$  は、上で与えた意味を有する)

の (複素) 環と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下で反応させること、または

C) 式 (I) :

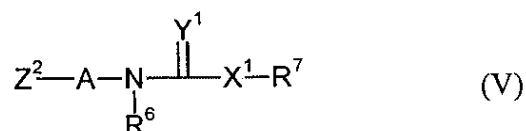
## 【化 9】



(この式中、  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、  
 $Z^1$  は、上で与えた意味を有する)  
 の ¹ - ピロリンを、式 (V) :

10

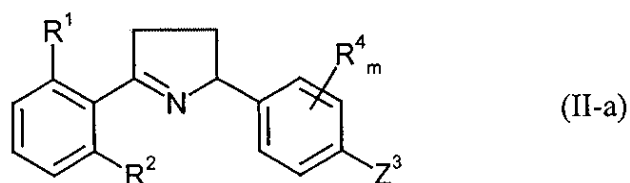
## 【化 10】



(この式中、  
 $A$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、  
 $Z^2$ 、 $Y^1$  および  $X^1$  は、上で与えた意味を有する)  
 のボロン酸誘導体と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下で反応させること、または  
 D) 式 (I I - a) :

20

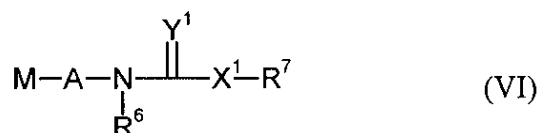
## 【化 11】



30

(この式中、  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、  
 $Z^3$  は、臭素またはヨウ素を表す)  
 の ¹ - ピロリンを、式 (V I) :

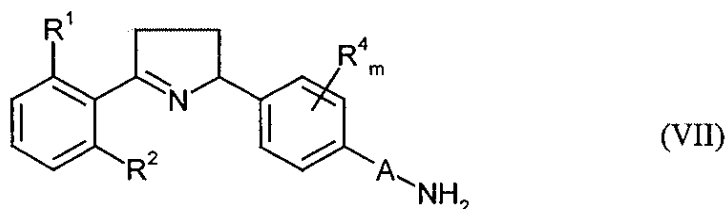
## 【化 12】



40

(この式中、  
 $A$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、  
 $Y^1$  および  $X^1$  は、上で与えた意味を有し、  
 $M$  は、 $ZnCl$ 、 $Sn(Me)_3$  または  $Sn(n-Bu)_3$  を表す)  
 の有機金属化合物と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下で反応させること、または  
 E) 式 (V I I) :

## 【化 1 3】



(この式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $A$ 、 $R^4$  および  $m$  は、請求項 1 で与えた意味を有する) の 1 - ピロリンを、式 (VII) :

## 【化 1 4】



(この式中、 $Y$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有する) のイソ (チオ) シアネートと、もしくは式 (IX) :

## 【化 1 5】



(この式中、

$Y$  および  $R^7$  は、請求項 1 で与えた意味を有し、

$X^2$  は、 $O$  (酸素) または  $S$  (硫黄) を表す)

の (チオ) カーボネートと、各場合、適する場合には希釈剤の存在下、および適する場合には酸性結合剤の存在下で反応させること

を特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の調製法。

## 【請求項 2 1】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の少なくとも 1 つに加えて、増量剤および / または界面活性物質を含むことを特徴とする農薬。

## 【請求項 2 2】

有害生物を駆除するための、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の使用。

## 【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を有害生物および / またはそれらの生息場所に作用させることを特徴とする有害生物駆除法。

## 【請求項 2 4】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を増量剤および / または界面活性物質と混合することを特徴とする農薬製造法。

## 【発明の詳細な説明】

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は、新規 1 - ピロリン、それらを調製するための多数の方法および農薬として  
のそれらの使用に関する。 40

## 【背景技術】

## 【0002】

非常に多数の 1 - ピロリンが殺虫特性を有することは、既に知られている (参照 : 国際公開公報第 00 / 21958 号、同第 99 / 59968 号、同第 99 / 59967 号および同第 98 / 22438 号)。これらの物質の活性は良好であるが、場合によっては望むべき何かが未だ残る。

## 【発明の開示】

## 【0003】

本発明は、今般、式 (I) :

10

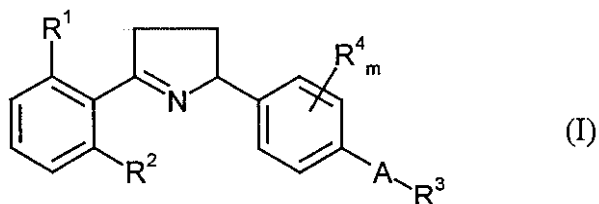
20

30

40

50

## 【化 1】



(式中、

$R^1$  は、ハロゲンまたはメチルを表し、

$R^2$  は、水素またはハロゲンを表し、

$R^3$  は、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) A は、アリーレン、または窒素原子 0 個から 3 個、酸素原子 0 個から 1 個および / もしくは硫黄原子 0 個から 1 個含むヘテロ原子 1 個から 3 個を有する 5 員ヘテロアリーレン、あるいは窒素原子 3 個を有する 6 員ヘテロアリーレン、または窒素原子 1 個およびさらなるヘテロ原子 1 個から 2 個 (このうち、0 個から 2 個は、酸素原子であってもよく、および / または 0 個から 2 個は、硫黄原子であってもよい) を有する 6 員ヘテロアリーレンを表し、この場合、各アリーレンまたはヘテロアリーレンは、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により場合によっては 1 回から 4 回置換されており、且つ、

Y は、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X は、O (酸素)、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

b) A は、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y は、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X は、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

c) A は、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y は、S (硫黄) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表すか、

d) A は、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y は、O (酸素) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  は互いに無関係に、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシまたはハロアルキルチオを表し、

m は、0、1、2、3 または 4 を表し、

$R^6$  は、水素またはアルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  は互いに無関係に水素を表すか、ハロゲン、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルコキシ、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオおよびハロアルコキシアルコキシから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されているアルキルまたはアルケニルを表すか；

ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルカルボニルおよびアルコシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されているシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、飽和または不飽和 5 員 ~ 10 員ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  はさらに一緒に、アルキルにより場合によっては 1 回以上置換されてい

10

20

30

40

50

るアルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、 $-O-$ 、 $-S-$  および  $-NR^9-$  から選択されるさらなるヘテロ原子群を場合によっては含んでいてもよい、ならびにハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびハロアルキルチオから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回以上置換されていてもよい飽和または不飽和5員～10員複素環を表し、ならびに

$R^9$  は、水素、アルキルまたはアルケニルを表す)  
の新規  $^1$ -ピロリンを提供する。

【0004】

10

置換基の性質および数に依存し、適する場合には、上記式(I)の化合物は、様々な組成物中で、幾何および/もしくは光学異性体、位置もしくは立体異性体、またはそれらの異性体混合物の形態であることができる。これらの純粋な異性体および異性体混合物を本発明に従って特許請求する。

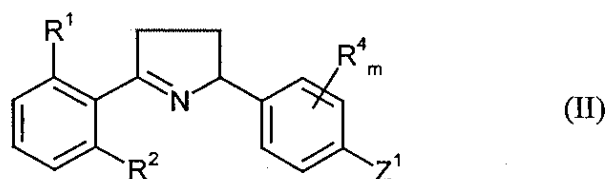
【0005】

上記式(I)の  $^1$ -ピロリンは、

A) 式(II) :

【0006】

【化2】



20

(この式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、上で与えた意味を有し、ならびに

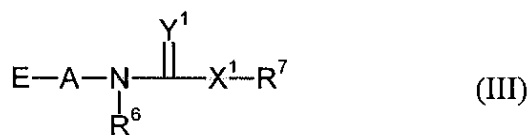
$Z^1$  は、塩素、臭素、ヨウ素、 $-OSO_2CF_3$  または  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$  を表す)

の  $^1$ -ピロリンを、式(III) :

30

【0007】

【化3】



(この式中、

$A$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有し、

$Y^1$  は、 $O$  (酸素) を表し、

$X^1$  は、 $O$  (酸素) または  $NR^8$  を表し、

$E$  は、塩素、臭素、ヨウ素、 $-OSO_2CF_3$  または  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$  を表す)

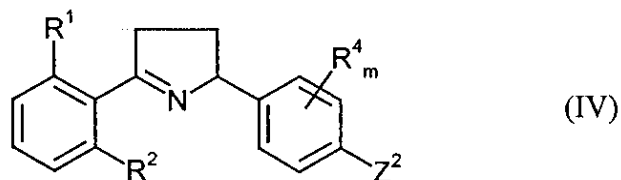
40

の(複素)環と、触媒の存在下、ジボロン酸エステル の存在下、および適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下、タンデム反応で反応させること、または

B) 式(IV) :

【0008】

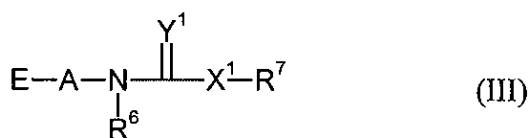
## 【化 4】



(この式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、上で与えた意味を有し、  
 $Z^2$  は、 $-B(OH)_2$ 、(4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボ  
 ロラン) - 2 - イル、(5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イル 10  
 、(4, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルまたは 1, 3  
 , 2 - ベンゾジオキサボロール - 2 - イルを表す)  
 の 1 - ピロリンを、式 (III) :

【0009】

## 【化 5】

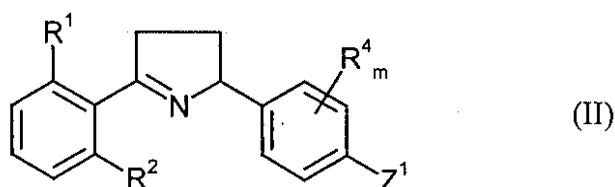


(この式中、 $E$ 、 $A$ 、 $Y^1$ 、 $X^1$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有する)  
 の (複素) 環と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場  
 合には希釈剤の存在下で反応させること、または

C) 式 (II) :

【0010】

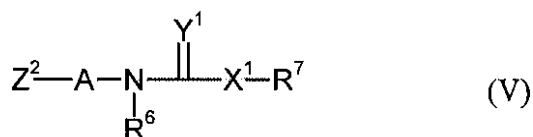
## 【化 6】



(この式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $m$  および  $Z^1$  は、上で与えた意味を有する)  
 の 1 - ピロリンを、式 (V) :

【0011】

## 【化 7】



(この式中、 $Z^2$ 、 $A$ 、 $Y^1$ 、 $X^1$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有する)  
 のボロン酸誘導体と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する  
 場合には希釈剤の存在下で反応させること、または

D) 式 (II - a) :

【0012】

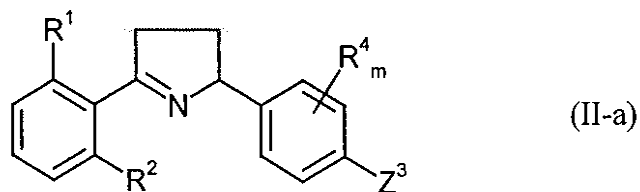
10

20

30

40

## 【化 8】



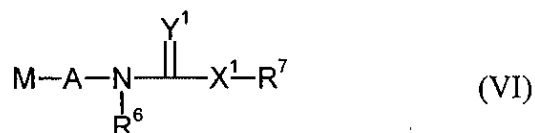
(この式中、  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、上で与えた意味を有し、  
 $Z^3$  は、臭素またはヨウ素を表す)

10

の 1 - ピロリンを、式 (VI) :

## 【0013】

## 【化 9】



(この式中、  
 $A$ 、 $Y^1$ 、 $X^1$ 、 $R^6$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有し、  
 $M$  は、 $ZnCl$ 、 $Sn(Me)_3$  または  $Sn(n-Bu)_3$  を表す)

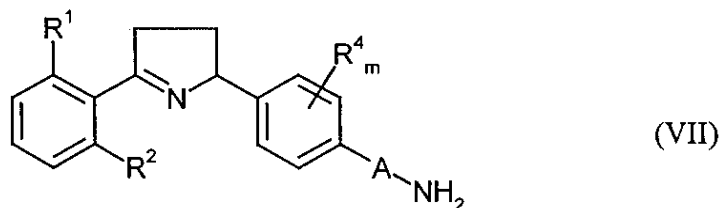
20

の有機金属化合物と、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下で反応させること、または

E) 式 (VII) :

## 【0014】

## 【化 10】



30

(この式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $A$ 、 $R^4$  および  $m$  は、上で与えた意味を有する)  
 の 1 - ピロリンを、式 (VIII) :

## 【0015】

## 【化 11】



40

(この式中、 $Y$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有する)  
 のイソ(チオ)シアネートと、もしくは式 (IX) :

## 【0016】

## 【化 12】



(この式中、  
 $Y$  および  $R^7$  は、上で与えた意味を有し、

50



$X^2$  は、O (酸素) または S (硫黄) を表す)  
 の (チオ) カーボネートと、各場合、適する場合には希釈剤の存在下、および適する場合には酸性結合剤の存在下で反応させること  
 によって調製できることもわかった。

【0017】

最後に、本発明の式 (I) の化合物は、非常に良好な殺虫特性を有すること、ならびに昆虫などの望ましくない有害生物の防除を目的とする農作物の保護および材料の保護、両方に使用できることがわかった。

【0018】

式 (I) は、本発明の  $^1$  - ピロリンの一般的な定義を提供するものである。

10

【0019】

式 (I) の好ましい化合物は、

$R^1$  が、フッ素、塩素、臭素またはメチルを表し、

$R^2$  が、水素、フッ素、塩素または臭素を表し、

$R^3$  が、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) A が、アリーレン (とりわけ、フェニレン)、または窒素原子 0 個から 3 個、酸素原子 0 個から 1 個および / もしくは硫黄原子 0 個から 1 個含むヘテロ原子 1 個から 3 個を有する 5 員ヘテロアリーレン (特に、ピロリレン、フリレン、チエニレン、ピラジレン、イミダジレン、トリアジレン、チアジレンまたはオキサジレン系からのもの)、あるいは窒素原子 3 個を有する 6 員ヘテロアリーレン (とりわけ、トリアジニレン)、または窒素原子 1 個およびさらなるヘテロ原子 1 個から 2 個 (このうち、0 個から 2 個は、酸素原子であってもよく、および / または 0 個から 2 個は、硫黄原子であってもよい) を有する 6 員ヘテロアリーレン (特に、オキサジニレンまたはチアジニレン系からのもの) を表し、これらは、各々、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により場合によっては 1 回から 3 回置換されており、且つ、

20

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素)、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

b) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

30

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

c) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表すか、

d) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

40

Y が、O (酸素) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシまたは  $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオを表し、

m が、0、1、2 または 3 を表し、

$R^6$  が、水素または  $C_1 \sim C_6$  - アルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 \sim C_6$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  -

50

アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルキルチオおよび  $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回以上置換されている  $C_1 \sim C_{20}$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_{20}$  - アルケニルを表すか；

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_6$  - アルコシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては1回から4回置換されている、 $C_3 \sim C_{12}$  - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、アリール、アリール -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、窒素原子0個から4個、非隣接酸素原子0個から2個および/もしくは非隣接硫黄原子0個から2個を含むヘテロ原子1~4個を有する飽和または不飽和5員~10員ヘテロシクリルまたはヘテロシクリル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル(とりわけ、テトラゾリル、フリル、フルフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テニル、ベンゾチエニル、チオラニル、ピロリル、インドリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、チアゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、トリアジニル、トリアゾリル、キノリニルまたはイソキノリニル)を表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルにより場合によっては1回から4回置換されている  $C_2 \sim C_4$  - アルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、-O-、-S- および -NR<sup>9</sup> - から選択されるさらなるヘテロ原子群を場合によっては含んでもよい、ならびにフッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキル、 $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  - ハロアルコキシおよび/または  $C_1 \sim C_6$  - ハロアルキルチオから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回から4回置換されていてもよい飽和または不飽和5員~10員複素環を表し、ならびに

$R^9$  が、水素、 $C_1 \sim C_6$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_6$  - アルケニルを表すものである。

#### 【0020】

式(I)の特に好ましい化合物は、

$R^1$  が、フッ素、塩素またはメチルを表し、

$R^2$  が、水素、フッ素または塩素を表し、

$R^3$  が、-N( $R^6$ )-C(=Y)-X- $R^7$ を表し、ならびに

a) Aが、同じまたは異なる置換基 $R^5$ により、各々、場合によっては1回または2回置換されているフェニレン、ピロリレン、フリレン、チエニレン、ピラジレン、イミダジレン、トリアジレン、チアジレンまたはオキサジレンを表し、且つ、

Yが、O(酸素)またはS(硫黄)を表し、且つ、

Xが、O(酸素)、S(硫黄)またはNR<sup>8</sup>を表すか、

b) Aが、同じまたは異なる置換基 $R^5$ により、各々、場合によっては1回または2回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Yが、O(酸素)またはS(硫黄)を表し、且つ、

Xが、S(硫黄)またはNR<sup>8</sup>を表すか、

c) Aが、同じまたは異なる置換基 $R^5$ により、各々、場合によっては1回または2回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Yが、S(硫黄)を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表すか、

d) A が、同じまたは異なる置換基  $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回または 2 回置換されているピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ；各場合、フッ素、塩素および/もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシまたは  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオを表し、

m が、0、1 または 2 を表し、

$R^6$  が、水素または  $C_1 \sim C_4$  - アルキルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 \sim C_4$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルキルチオおよび  $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ (各場合、フッ素、塩素および/または臭素を 1 個から 21 個有する) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されている  $C_1 \sim C_{16}$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_{16}$  - アルケニルを表すか；

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および/もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する)、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回から 3 回置換されている、 $C_3 \sim C_{10}$  - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  - シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$  - アルキル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、テトラゾリル、フリル、フルフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テニル、ベンゾチエニル、チオラニル、ピロリル、インドリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、チアゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、トリアジニル、トリアゾリル、キノリニルまたはイソキノリニルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルにより場合によっては 1 回から 3 回置換されている  $C_2 \sim C_3$  - アルキレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、-O-、-S- または -NR<sup>9</sup>- 系からのさらなるヘテロ原子群 (特に、ピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペラジノ、ピロリジノ、オキサゾリジノ、チアゾリジノ、4H-1-オキサジニル、4H-1-チアジニル系からものも) を場合によっては含んでもよい、ならびにフッ素、塩素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシおよび/または  $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および/もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては 1 回から 4 回置換されていてもよい飽和または不飽和 5 員 ~ 7 員複素環を表し、ならびに

$R^9$  が、水素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  - アルケニルを表すものである。

【0021】

式 (I) の特に非常に好ましい化合物は、

$R^1$  が、フッ素または塩素を表し、

10

20

30

40

50

$R^2$  が、水素またはフッ素を表し、

$R^3$  が、 $-N(R^6)-C(=Y)-X-R^7$  を表し、ならびに

a) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回置換されている 1, 2 - フェニレン、1, 4 - フェニレン、2, 5 - ピロリレン、2, 5 - フリレン、2, 4 - フリレン、2, 5 - チエニレン、2, 4 - チエニレン、2, 5 - チアジレン、2, 4 - チアジレン、2, 5 - オキサジレンまたは 2, 4 - オキサジレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素)、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

b) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回置換されている 2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは 3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X が、S (硫黄) または  $NR^8$  を表すか、

c) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回置換されている 2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは 3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、S (硫黄) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表すか、

d) A が、 $R^5$  により、各々、場合によっては 1 回置換されている 2, 5 - ピリジニレン、2, 5 - ピリミジニレン、2, 5 - ピラジニレンまたは 3, 6 - ピリダジニレンを表し、且つ、

Y が、O (酸素) を表し、且つ、

X が、O (酸素) を表し、ならびに

$R^4$  および  $R^5$  が互いに無関係に、フッ素、塩素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、n - プロボキシ、i - プロボキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、トリフルオロメチルチオまたはトリフルオロエチルチオを表し、

m が、0 または 1 を表し、

$R^6$  が、水素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチルまたは t - ブチルを表し、

$R^7$  および  $R^8$  が互いに無関係に水素を表すか、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 \sim C_4$  - アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  - アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$  - ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および / または臭素原子を 1 個から 21 個有する)、 $C_1 \sim C_8$  - ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_6$  - アルコキシ (フッ素、塩素および / または臭素原子を 1 個から 17 個有する) から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回以上置換されている  $C_1 \sim C_{10}$  - アルキルまたは  $C_2 \sim C_{10}$  - アルケニル (とりわけ、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、異性体ペンチル類、異性体ヘキシル類) を表すか；

フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$  - アルキル、 $C_1 \sim C_4$  - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  - ハロアルキルチオ (各場合、フッ素、塩素および / もしくは臭素原子を 1 個から 9 個有する)、 $C_1 \sim C_4$  - アルキルカルボニルおよび  $C_1 \sim C_4$  - アルコキシカルボニルから成る群より選択された同じまたは異なる置換基により、各々、場合によっては 1 回から 3 回置換されている、 $C_3 \sim C_8$  - シクロアルキル、シクロプロピルメチル、シクロペンチ

10

20

30

40

50

ルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、テトラゾリル、フリル、フルフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テニル、ベンゾチエニル、チオラニル、ピロリル、インドリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、チアゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジル、ピラジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、トリアジニル、トリアゾリル、キノリニルまたはイソキノリニルを表し、

$R^6$  および  $R^7$  がさらに一緒に、同じまたは異なるメチル、エチル、*n*-プロピルまたは *i*-プロピル置換基により、各々、場合によっては1回または2回置換されているメチレンまたはエチレンを表すか、

$R^7$  および  $R^8$  がさらに、それらが結合している窒素原子と一緒に、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*i*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、*i*-ブトキシ、*s*-ブトキシ、*t*-ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、*i*-プロピルチオ、*n*-ブチルチオ、*i*-ブチルチオ、*s*-ブチルチオ、*t*-ブチルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ（各場合、フッ素、塩素および/または臭素原子を1個から9個有する）、ピペラジノラジカル（ $R^9$  により第二窒素原子が置換されている）から成る群より選択された同じまたは異なる置換基により場合によっては1回から4回置換されていてもよいピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペラジノ、ピロリジノ、オキサゾリジノ、チアゾリジノ、4H-1-オキサジニル、4H-1-チアジニル系からの5員～6員複素環を表し、ならびに

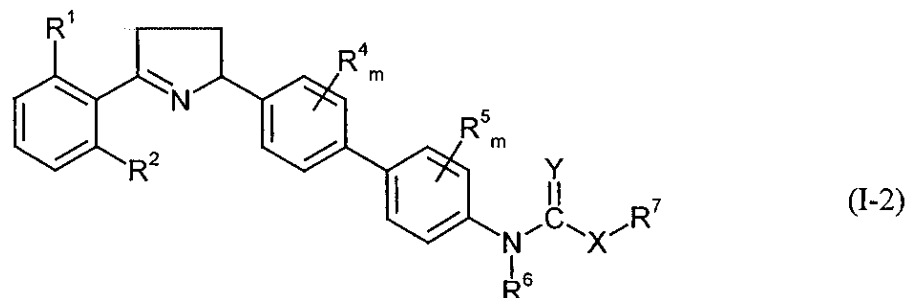
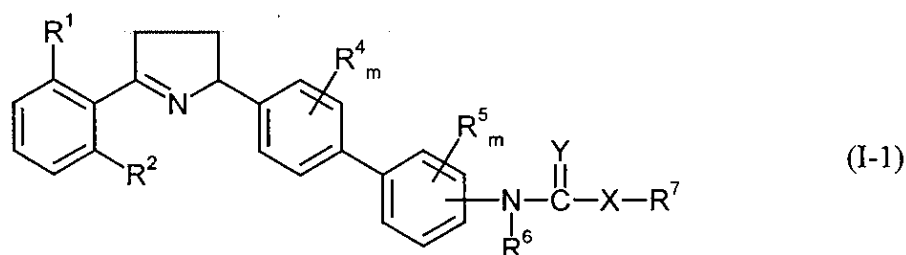
$R^9$  が、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、ビニルまたはアリルを表すものである。

【0022】

さらに特に非常に好ましい化合物は、式（I-1）および（I-2）：

【0023】

【化13】



（これらの各式中、

a) Y は、O（酸素）またはS（硫黄）を表し、且つ、

X は、O（酸素）、S（硫黄）または  $NR^8$  を表し、ならびに

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $m$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  は、上で与えた意味を有する) のものである。

【0024】

上記式 (I - 1) および (I - 2) において、ラジカル  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $m$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと述べた定義を、各々、好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。X および Y は、各場合、対応する箇所「a)」で説明した定義を、各場合、好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

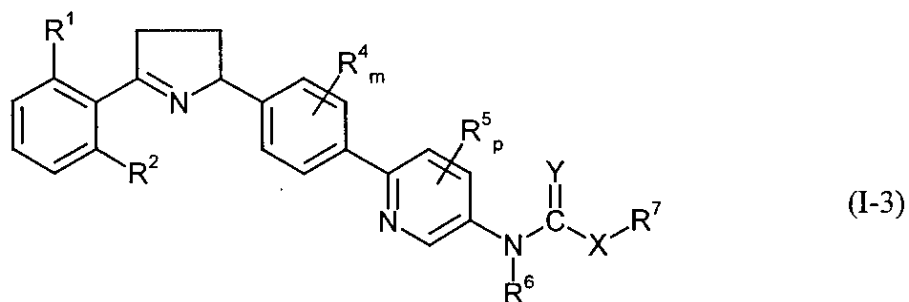
【0025】

さらに特に非常に好ましい化合物は、式 (I - 3) から (I - 8) :

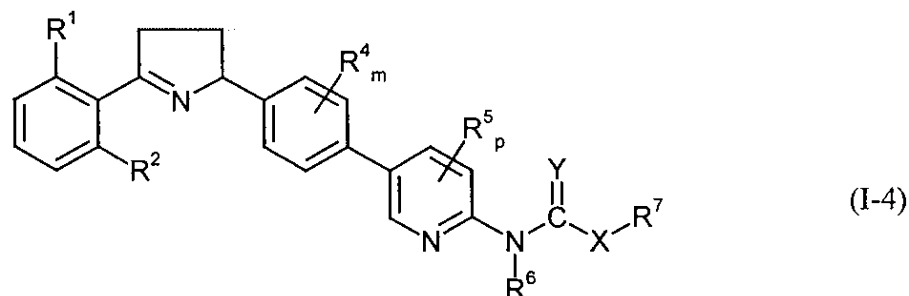
10

【0026】

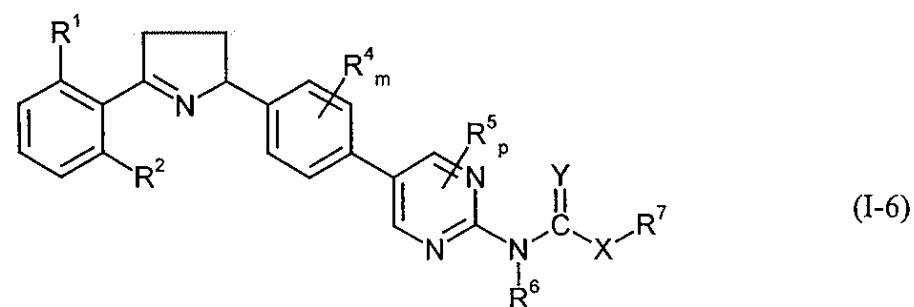
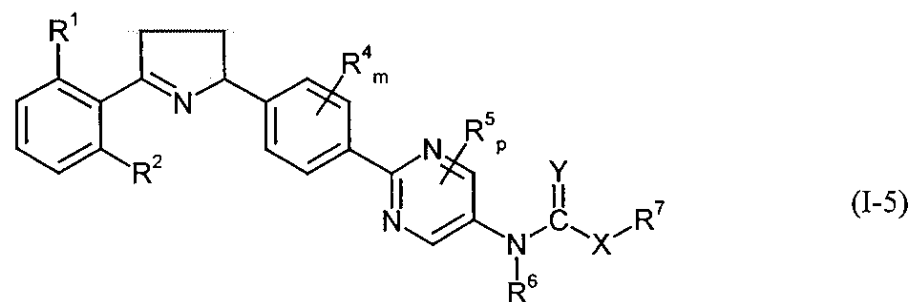
【化14】



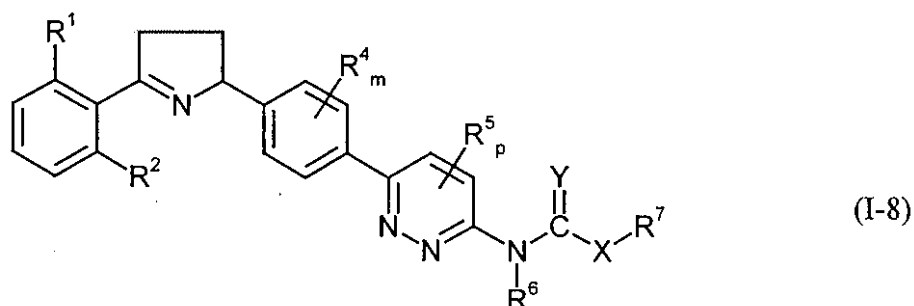
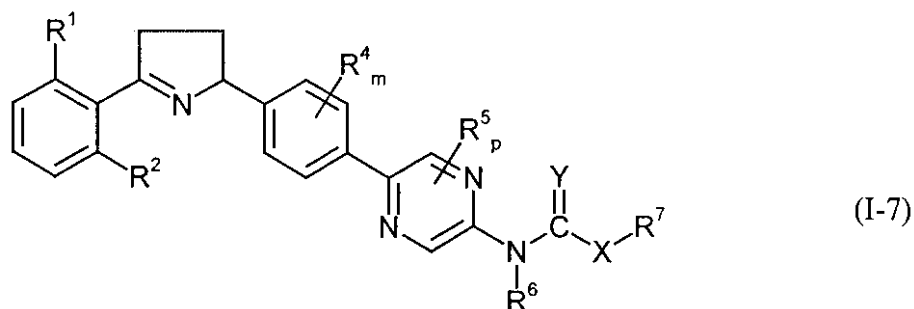
20



30



40



(これらの各式中、

p は、0、1 または 2 を表し、

b) Y は、O (酸素) または S (硫黄) を表し、且つ、

X は、S (硫黄) または N R<sup>8</sup> を表すか、

c) Y は、S (硫黄) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表すか、

d) Y は、O (酸素) を表し、且つ、

X は、O (酸素) を表し、ならびに

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、m、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、上で与えた意味を有する)

のものである。

【0027】

上記式 (I - 3) から (I - 8) において、ラジカル R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、m、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup> は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと述べた定義を、各々、好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。X および Y は、各場合、対応する箇所「a)」、「b)」、「c)」および「d)」で説明した定義を、各場合、好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。p は、好ましくは 0、1 または 2、特に好ましくは 0 または 1、特に非常に好ましくは 0 を表す。

【0028】

式 (I) のさらに好ましい化合物は、A が、フェニレン、好ましくは、1,4 - フェニレンを表すものである。

【0029】

式 (I) のさらに好ましい化合物は、A が、ピリジニレン、ピリミジニレン、ピラジニレンまたはピリダジニレン、好ましくは、2,5 - ピリジニレン、2,5 - ピリミジニレン、2,5 - ピラジニレンまたは 3,6 - ピリダジニレンを表すものである。

【0030】

式 (I) のさらに好ましい化合物は、Y が、O (酸素) を表すものである。

【0031】

式 (I) のさらに好ましい化合物は、X が、O (酸素) または N R<sup>8</sup> を表し、好ましくは、O (酸素) を表すものである。

【0032】

式 (I) のさらに好ましい化合物は、Y および X が、各々、O (酸素) を表すものであ

10

20

30

40

50

る。

【 0 0 3 3 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、Y が、O ( 酸素 ) を表し、且つ、X が、 $\text{NR}^8$  を表すものである。

【 0 0 3 4 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、A が、フェニレン、好ましくは、1, 4 - フェニレンを表し、Y が、O ( 酸素 ) または S ( 硫黄 )、好ましくは、O ( 酸素 ) を表し、且つ、X が、O ( 酸素 )、S ( 硫黄 ) または  $\text{NR}^8$ 、好ましくは、O ( 酸素 ) または  $\text{NR}^8$ 、特に好ましくは O ( 酸素 ) を表すものである。

【 0 0 3 5 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、 $\text{R}^1$  および  $\text{R}^2$  が、各々、フッ素を表すものである。

【 0 0 3 6 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、 $\text{R}^1$  が、メチルを表し、且つ、 $\text{R}^2$  が、水素を表すものである。

【 0 0 3 7 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、 $\text{R}^1$  が、塩素を表し、且つ、 $\text{R}^2$  が、水素を表すものである。

【 0 0 3 8 】

式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、 $\text{R}^1$  が、塩素を表し、且つ、 $\text{R}^2$  が、フッ素を表すものである。

【 0 0 3 9 】

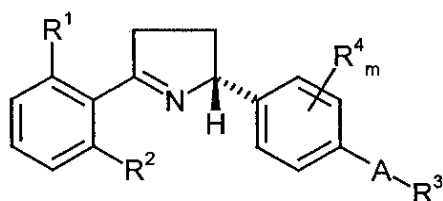
式 ( I ) のさらに好ましい化合物は、 $\text{R}^6$  が、水素を表すものである。

【 0 0 4 0 】

式 ( I - a ) :

【 0 0 4 1 】

【 化 1 5 】



(I-a)

( 式中、

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、A、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  および m は、上で与えた意味を有する ) のさらに好ましい化合物は、ピロリン環の 5 位に ( R ) 型立体配置を有するものである。上記式 ( I - a ) によると、2 H - ピロールの 2 位 ( ピロリンと命名される時は、5 位に相当する ) に R 型立体配置を有する化合物 ( I - 1 ) から ( I - 8 ) の化合物も存在する。

【 0 0 4 2 】

式 ( I - a ) の化合物は、例えば、キラル固定相を使用する対応するラセミ体のクロマトグラフなどによる、慣用の光学分割法によって得られる。ラセミ最終生成物またはラセミ中間体のいずれかをこの方法で二つのエナンチオマーに分離することができる。

【 0 0 4 3 】

単独での、または例えばアルコキシなどのヘテロ原子と結合した、アルキルなどの飽和炭化水素ラジカルは、可能ならば、各場合、直鎖であってもよいし、分枝鎖であってもよい。

【 0 0 4 4 】

しかし、上で一般にまたは好ましい範囲内に記載したラジカル定義および説明は、望みどおり互いに組合せることもできる。すなわち、それぞれの範囲と好ましい範囲の間の

10

20

30

40

50



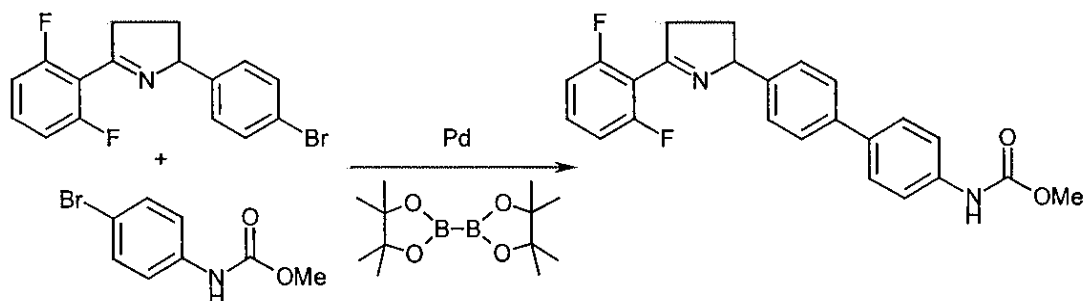
任意の組合せである。それらは、最終生成物にも、従って、前駆体および中間体にも当てはまる。

【 0 0 4 5 】

出発原料として 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - ( 4 - ブロモフェニル ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール、4 - ブロモフェニルカルバミン酸メチルおよび 4 , 4 ' , 4 ' , 5 , 5 , 5 ' , 5 ' - オクタメチル - 2 , 2 ' - ビス - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロランを使用し、且つ、パラジウム触媒を使用する本発明の方法 ( A ) の過程は、次の化学反応式によって説明することができる。

【 0 0 4 6 】

【 化 1 6 】



10

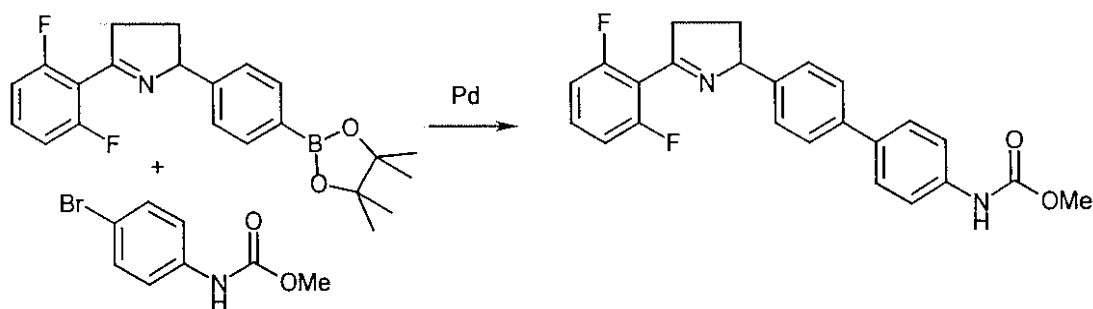
20

【 0 0 4 7 】

出発原料として 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - [ 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 ] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロールおよび 4 - ブロモフェニルカルバミン酸メチルを使用し、且つ、パラジウム触媒を使用する本発明の方法 ( B ) の過程は、次の化学反応式によって説明することができる。

【 0 0 4 8 】

【 化 1 7 】



30

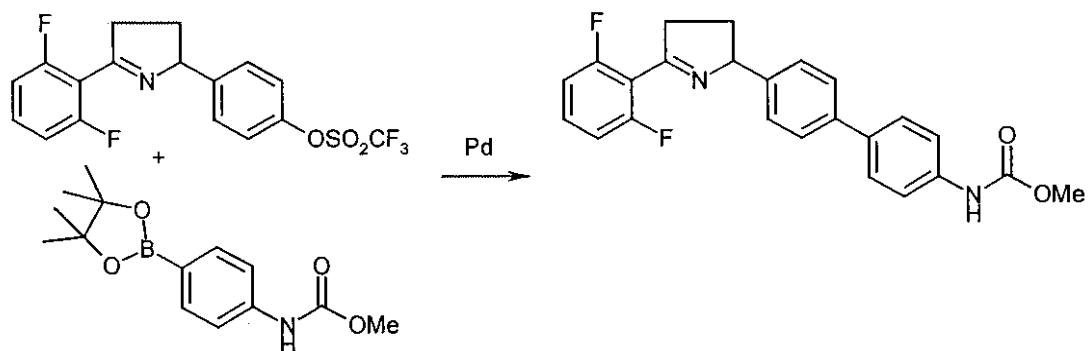
【 0 0 4 9 】

出発原料として 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - [ 4 - ( トリフルオロメチルスルホニルオキシ ) フェニル ] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロールおよび 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 ) フェニルカルバミン酸メチルを使用し、且つ、パラジウム触媒を使用する本発明の方法 ( C ) の過程は、次の化学反応式によって説明することができる。

【 0 0 5 0 】

40

## 【化 18】



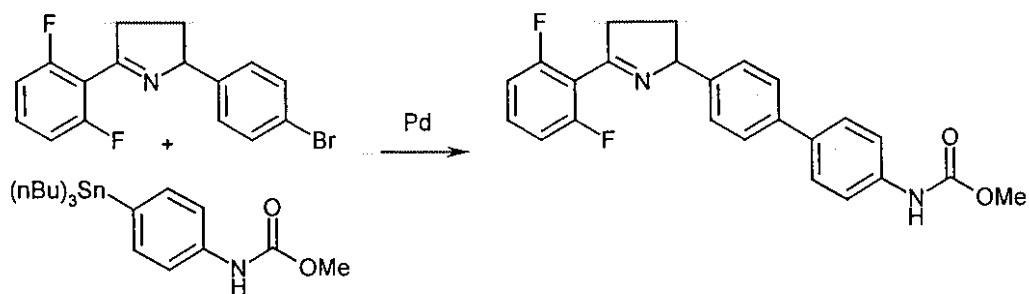
10

## 【0051】

出発原料として 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - ( 4 - プロモフェニル ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロールおよび 4 - ( トリブチルスタンニル ) フェニルカルバミン酸メチルを使用し、且つ、パラジウム触媒を使用する本発明の方法 ( D ) の過程は、次の化学反応式によって説明することができる。

## 【0052】

## 【化 19】



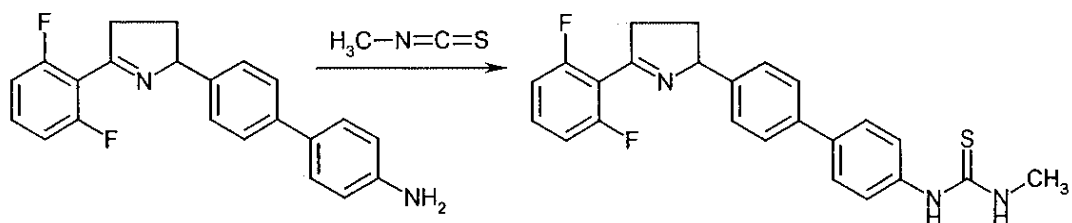
20

## 【0053】

出発原料として 4' - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル ] - 1 , 1' - ビフェニル - 4 - アミンおよび ( メチルイミノ ) ( チオキソ ) メタンを使用する本発明の方法 ( E ) の過程は、次の化学反応式によって説明することができる。

## 【0054】

## 【化 20】



40

## 【0055】

方法および中間体の説明

方法 ( A )

第一反応段階において、パラジウム触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には溶媒の存在下で式 ( II ) の化合物をジボロン酸エステルとカップリングさせる。中間体の単離は一切せず、同じ反応容器で、第二反応段階において、パラジウム触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には溶媒の

50

存在下で式 ( I I I ) の化合物をカップリングさせる ( 参照 : 例えば、T e t r a h e d r o n L e t t . 1 9 9 7 , 3 8 , 3 8 4 1 ) 。

【 0 0 5 6 】

本発明の方法 ( A ) は、異なる二つの形で行うことができる。式 ( I I ) の化合物を最初に充填することもできるし、式 ( I I I ) の化合物を最初に充填することもできる。方法 ( A ) は、下で説明する方法 ( B ) と方法 ( C ) のタンデム反応とみなすことができる。

【 0 0 5 7 】

上記式 ( I I ) は、方法 ( A ) を行うための出発原料として必要な <sup>1</sup> - ピロリンの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> および m は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた意味を好ましくは、特に好ましくは、および特に非常に好ましくは有する。Z は、好ましくは、臭素、ヨウ素、- O S O<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> または - O S O<sub>2</sub> ( C F<sub>2</sub> )<sub>3</sub> C F<sub>3</sub>、特に好ましくは、臭素、- O S O<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> または - O S O<sub>2</sub> ( C F<sub>2</sub> )<sub>3</sub> C F<sub>3</sub>、特に非常に好ましくは、臭素または - O S O<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> を表す。

【 0 0 5 8 】

式 ( I I ) の <sup>1</sup> - ピロリンは、既知の方法によって調製することができる ( 参照 : 国際公開公報第 9 8 / 2 2 4 3 8 号 ) 。式 ( I I ) の <sup>1</sup> - ピロリンは、下で説明する方法によって得ることもできる。

【 0 0 5 9 】

上記式 ( I I I ) は、本発明の方法 ( A ) を行うための出発原料として必要な ( 複素 ) 環の一般定義を提供するものである。この式において、Y<sup>1</sup> は、好ましくは、O ( 酸素 ) を表す。X<sup>1</sup> は、好ましくは、O ( 酸素 ) または N R<sup>8</sup> を表す。E は、好ましくは、臭素、塩素、ヨウ素または - O S O<sub>2</sub> C F<sub>3</sub>、特に好ましくは、臭素、塩素またはヨウ素、特に非常に好ましくは、臭素または塩素を表す。A、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた意味を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは有する。

【 0 0 6 0 】

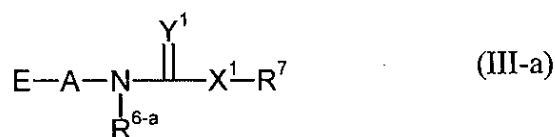
式 ( I I I ) の ( 複素 ) 環は、既知の場合もある。

【 0 0 6 1 】

式 ( I I I - a ) :

【 0 0 6 2 】

【 化 2 1 】



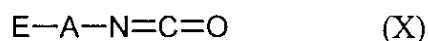
( この式中、E、A、Y<sup>1</sup>、X<sup>1</sup> および R<sup>7</sup> は、上で与えた意味を有し、R<sup>6-a</sup> は、水素を表す )

の ( 複素 ) 環は、例えば、

a) 式 ( X ) :

【 0 0 6 3 】

【 化 2 2 】



( この式中、E および A は、上で与えた意味を有する ) のイソシアネートを、式 ( X I ) :

【 0 0 6 4 】

## 【化 2 3】



(この式中、 $\text{X}^1$  および  $\text{R}^7$  は、上で与えた意味を有する)  
 のアルコールおよび/もしくはアミンと、または式 (X I I) :

【0065】

## 【化 2 4】



10

(この式中、

$\text{X}^1$  は、上で与えた意味を有し、

$\text{L}$  は、アルキルにより場合によっては 1 回以上置換されているアルキレンを表す)

の化合物と、場合によっては希釈剤 (例えば、トルエン、ジオキサン、ジメチルスルホキシド) の存在下で反応させること

によって調製することができる。

20

【0066】

上記式 (I I I - a) は、方法 (a) によって調製することができる (複素) 環の一般定義を提供するものである。この式において、 $\text{A}$  および  $\text{R}^7$  は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $\text{E}$ 、 $\text{Y}^1$  および  $\text{X}^1$  は、本発明の式 (I I I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $\text{R}^6$  は、好ましくは、水素を表す。

【0067】

上記式 (X) は、方法 (a) を行うための出発原料として必要なイソシアネートの一般定義を提供するものである。この式において、 $\text{A}$  は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $\text{E}$  は、本発明の式 (I I I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

30

【0068】

式 (X) のイソシアネートは、既知である。

【0069】

上記式 (X I) は、方法 (a) を行うための出発原料として必要なアルコールおよび/またはアミンの一般定義を提供するものである。この式において、 $\text{R}^7$  は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $\text{X}^1$  は、本発明の式 (I I I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

40

【0070】

式 (X I) のアルコールおよびアミンは、既知である。

【0071】

上記式 (X I I) は、方法 (a) を行うための出発原料としてさらに必要な化合物の一般定義を提供するものである。この式において、 $\text{X}^1$  は、本発明の式 (I I I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ま

50

しくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。Lは、好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルにより場合によっては1回から4回置換されている $C_2 \sim C_4$ -アルキレン、特に好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルにより場合によっては1回から3回置換されている $C_2 \sim C_3$ -アルキレン、特に非常に好ましくは、同じまたは異なるメチル、エチル、*n*-プロピルまたは*i*-プロピル置換基により、各々、場合によっては1回または2回置換されているメチレンまたはエチレンを表す。

【0072】

式(XII)の化合物は、既知である。

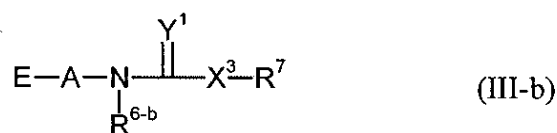
【0073】

式(III-b) :

10

【0074】

【化25】



(この式中、

E、A、 $\text{Y}^1$  および  $\text{R}^7$  は、上で与えた意味を有し、

$\text{X}^3$  は、O(酸素)を表し、

$\text{R}^{6-b}$  は、アルキルを表す)

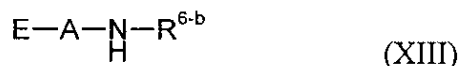
20

の(複素)環は、例えば、

b) 式(XIII) :

【0075】

【化26】



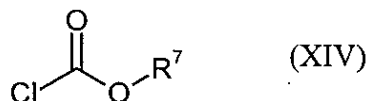
(この式中、E、Aおよび $\text{R}^{6-b}$ は、上で与えた意味を有する)

のアミンを、式(XIV) :

30

【0076】

【化27】



(この式中、 $\text{R}^7$ は、上で与えた意味を有する)

のクロロホルメートと、N,O-ビス(トリメチルシリル)アセトアミドの存在下、および適する場合には希釈剤(例えば、ジクロロメタン)の存在下で反応させることによって調製することができる(参照: Syn. Commun. 1985, 15, 1025-1031)。

40

【0077】

上記式(III-b)は、方法(b)によって調製することができる(複素)環の一般定義を提供するものである。この式において、Aは、本発明の式(I)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。Eは、本発明の式(III)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $\text{R}^{6-b}$ は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、特に好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、特に非常に好ましく

50

は、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチルまたは *t*-ブチルを表す。

【0078】

上記式 (X I I I) は、方法 (d) を行うための出発原料として必要なアミンの一般定義を提供するものである。この式において、E および A は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。R<sup>6-c</sup> は、好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>-アルキル、特に好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルキル、特に非常に好ましくは、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチルまたは *t*-ブチルを表す。

10

【0079】

式 (X I I I) のアミンは、既知である。

【0080】

上記式 (X I V) は、方法 (b) を行うための出発原料として必要なクロロホルメートの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>7</sup> は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

【0081】

式 (X I V) のクロロホルメートは、既知である。

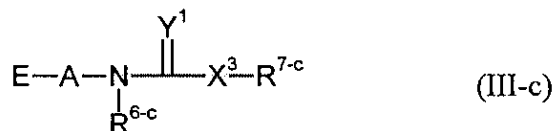
【0082】

式 (I I I - c) :

20

【0083】

【化28】



(この式中、

E、A および Y<sup>1</sup> は、上で与えた意味を有し、

X<sup>3</sup> は、O (酸素) を表し、

R<sup>6-c</sup> および R<sup>7-c</sup> は、アルキルにより場合によっては 1 回以上置換されているアルキレンを表す)

30

の (複素) 環は、例えば、

c) 式 (X) :

【0084】

【化29】



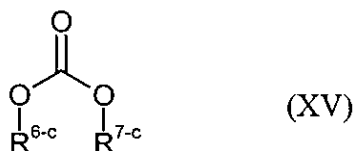
40

(この式中、E および A は、上で与えた意味を有する)

のイソシアネートを、式 (X V) :

【0085】

【化30】



(この式中、R<sup>6-c</sup> および R<sup>7-c</sup> は、上で与えた意味を有する)

50

のジオキソランと、適する場合には酸性結合剤（例えば、フッ化セシウム）の存在下、および適する場合には希釈剤（例えば、ジメチルスルホキシド）の存在下で反応させることによって調製することができる（参照：JP 2000-2902635）。

#### 【0086】

上記式（ⅠⅠⅠ-c）は、方法（c）によって調製することができる（複素）環の一般定義を提供するものである。この式において、Aは、本発明の式（Ⅰ）の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。Eは、本発明の式（ⅠⅠⅠ）の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。R<sup>6-c</sup> および R<sup>7-c</sup> は一緒に、好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルにより場合によっては1回から4回置換されているC<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキレン、特に好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキルにより場合によっては1回から3回置換されているC<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> - アルキレン、特に非常に好ましくは、メチル、エチル、n - プロピルまたはi - プロピルによって1回または2回置換されているメチレンまたはエチレンを表す。

10

#### 【0087】

方法（c）を行うための出発原料として必要な式（X）のイソシアネートは、方法（a）の説明に関連して既に説明した。

#### 【0088】

上記式（XV）は、方法（c）を行うための出発原料として必要なジオキソランの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>6-c</sup> および R<sup>7-c</sup> は、式（ⅠⅠⅠ-c）の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

20

#### 【0089】

式（XV）のジオキソランは、既知である。

#### 【0090】

本発明の方法（A）を行うために適するジボロン酸エステルは、4, 4', 4', 5, 5, 5', 5' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン、5, 5, 5', 5' - テトラメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン、4, 4, 4', 4', 6, 6' - ヘキサメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボリナンまたは2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ベンゾジオキサボロールである。4, 4, 4', 4', 5, 5, 5', 5' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン、5, 5, 5', 5' - テトラメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボリナンまたは4, 4, 4', 4', 6, 6' - ヘキサメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボリナンの使用が好ましく、4, 4, 4', 4', 5, 5, 5', 5' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボロランまたは5, 5, 5', 5' - テトラメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボリナンの使用が特に好ましく、4, 4, 4', 4', 5, 5, 5', 5' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボロランの使用が、特に非常に好ましい。

30

#### 【0091】

本発明の方法（A）を行う時、一般に、1 mol またはわずかに過剰のジボロン酸エステルおよび1 mol またはわずかに過剰の式（ⅠⅠⅠ）の化合物ならびに3%のパラジウム触媒を、式（ⅠⅠ）の化合物1 mol につき使用する。しかし、他の比率で前記反応成分を使用することもできる。式（ⅠⅠ）の化合物を最初に充填することもできるし、あるいは式（ⅠⅠⅠ）の化合物を最初に充填することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出する。有機相を洗浄し、乾燥させて、濾過し、濃縮する。適する場合には、クロマトグラフィーまたは再結晶などの慣用の方法を使用して残存しうる一切の不純物を残留物から除去する。

40

#### 【0092】

方法（B）

50

上記式 (I V) は、本発明の方法 (B) を行うための出発原料として必要な <sup>1</sup> - ピロリンの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup> および m は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた意味を好ましくは、特に好ましくはおよび特に非常に好ましくは有する。Z<sup>2</sup> は、好ましくは、(4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イル、(5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イル、(4, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルまたは 1, 3, 2 - ベンゾジオキサボロール - 2 - イル、特に好ましくは、4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イル、(5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルまたは (4, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イル、特に非常に好ましくは、(4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イルまたは (5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルを表す。

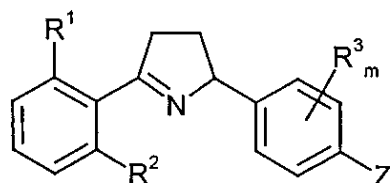
【0093】

式 (I V) の <sup>1</sup> - ピロリンは、

d) 式 (I I) :

【0094】

【化31】



(II)

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、m および Z<sup>1</sup> は、上で与えた意味を有する) の化合物を、ジボロン酸エステルと、触媒の存在下、適する場合には酸性結合剤の存在下、および適する場合には希釈剤の存在下で反応させることによって調製することができる (参照: J. Org. Chem. 1995, 60, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3447)。

【0095】

方法 (d) を行うために適するジボロン酸エステルは、本発明の方法 (A) の説明において既に述べた。

【0096】

本発明の方法 (B) を行うための出発原料として必要な式 (I I I) の複素環は、上の方法 (A) の説明において既に説明した。

【0097】

本発明の方法 (B) を行う時、一般に、1 mol またはわずかに過剰の式 (I I I) の化合物を式 (V) の化合物 1 mol につき使用する。しかし、他の比率で前記反応成分を使用することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を酢酸エチルに吸収させて、有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、濾過し、濃縮する。適する場合には、クロマトグラフィーまたは再結晶などの慣用の方法を使用して残存しうる一切の不純物を残留物から除去する。

【0098】

方法 (C)

本発明の方法 (C) を行うための出発原料として必要な式 (I I) の <sup>1</sup> - ピロリンは、方法 (A) の説明において既に説明した。

【0099】

上記式 (V) は、本発明の方法 (C) を行うための出発原料として必要なボロン酸誘導体の一般定義を提供するものである。この式において、Y<sup>1</sup> は、好ましくは、O (酸素) を表す。X<sup>1</sup> は、好ましくは、O (酸素) または NR<sup>8</sup> を表す。Z<sup>2</sup> は、好ましくは、(



4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イル、( 5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イル、( 4, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルまたは 1, 3, 2 - ベンゾジオキサボロール - 2 - イル、特に好ましくは、( 4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イル、( 5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルまたは ( 4, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イル、特に非常に好ましくは、( 4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン) - 2 - イルまたは ( 5, 5 - ジメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボリナン) - 2 - イルを表す。A、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

10

#### 【 0 1 0 0 】

式 ( V ) の化合物は、既知であり、または既知の方法によって調製することができる。

#### 【 0 1 0 1 】

本発明の方法 ( C ) を行う時、一般に、1 mol またはわずかに過剰の式 ( V ) の化合物を式 ( I I ) の化合物 1 mol につき使用する。しかし、他の比率で前記反応成分を使用することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を酢酸エチルに吸収させて、有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、濾過し、濃縮する。適する場合には、クロマトグラフィーまたは再結晶などの慣用の方法を使用して残存しうる一切の不純物を残留物から除去する。

20

#### 【 0 1 0 2 】

##### 方法 ( D )

上記式 ( I I - a ) は、本発明の方法 ( D ) を行うための出発原料として必要な <sup>1</sup> - ピロリンの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup> および m は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた意味を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは有する。Z<sup>3</sup> は、好ましくは、臭素またはヨウ素を表す。

#### 【 0 1 0 3 】

式 ( I I - a ) の <sup>1</sup> - ピロリンは、既知の方法によって調製することができる ( 参照 : 国際公開公報第 9 8 / 2 2 4 3 8 号 ) 。

30

#### 【 0 1 0 4 】

上記式 ( V I ) は、本発明の方法 ( D ) を行うための出発原料として必要な有機金属化合物の一般定義を提供するものである。この式において、Y<sup>1</sup> は、好ましくは、O ( 酸素 ) を表す。X<sup>1</sup> は、好ましくは、O ( 酸素 ) または N R<sup>8</sup> を表す。M は、好ましくは、Z n C l、S n ( M e )<sub>3</sub> または S n ( n - B u )<sub>3</sub> を表す。A、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

#### 【 0 1 0 5 】

式 ( V I ) の有機金属化合物は、既知である場合もあり、または既知の方法によって調製することができる。例えば、X が - O S O<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> を表す式 ( I I I ) の対応する化合物からインサイチュで式 ( V I ) の化合物を調製することができる ( 参照 : T e t r a h e d r o n L e t t . 1 9 9 5 , 3 6 , 9 0 8 5 ) 。

40

#### 【 0 1 0 6 】

本発明の方法 ( D ) を行う時、一般に、1 mol またはわずかに過剰の式 ( V I ) の化合物を式 ( I I - a ) の化合物 1 mol につき使用する。しかし、他の比率で前記反応成分を使用することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を酢酸エチルに吸収させて、有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、濾過し、濃縮する。適する場合には、クロマトグラフィーまたは再結晶などの慣用の方法を使用して残存しうる一切の不純物を残留物から除去する。

50

## 【 0 1 0 7 】

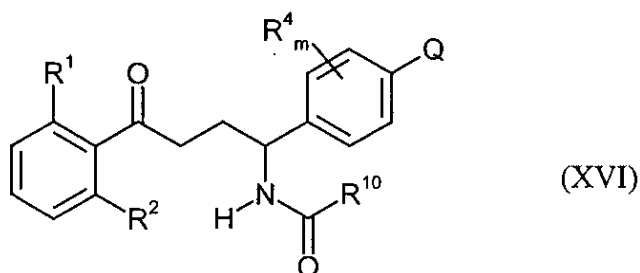
方法 ( A )、( B )、( C ) および ( D ) のための出発原料の調製

本発明の方法 ( A )、( B )、( C ) および ( D ) を行うための出発原料として必要な式 ( I I )、( I V ) および ( I I - a ) の <sup>1</sup> - ピロリンは、

e) 式 ( X V I ) :

## 【 0 1 0 8 】

## 【 化 3 2 】



10

( 式中、

Q は、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup> または Z<sup>3</sup> を表し、

R<sup>10</sup> は、アルキル、ハロアルキル、フェニルまたはベンジルを表し、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、m、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup> および Z<sup>3</sup> は、上で与えた意味を有する )

のアミドを、希釈剤の存在下で、N - 脱アシル化剤と反応させること  
によって調製することもできる。

20

## 【 0 1 0 9 】

上記式 ( X V I ) は、方法 ( e ) を行うための出発原料として必要なアミドの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup> および m は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。Q は、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup> または Z<sup>3</sup> を表すか、既に上で説明したこれらのラジカル of 好ましい、特に好ましい、および特に非常に好ましい定義を表す。R<sup>10</sup> は、好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> - ハロアルキル、フェニルまたはベンジル、特に好ましくは、メチル、エチル、フェニルまたはベンジル、特に非常に好ましくは、メチル、フェニルまたはベンジルを表す。

30

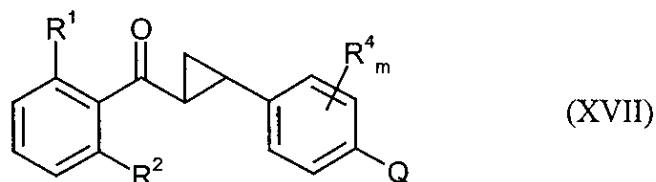
## 【 0 1 1 0 】

方法 ( e ) を行うための出発原料として必要な式 ( X V I ) のアミドは、

f) 式 ( X V I I ) :

## 【 0 1 1 1 】

## 【 化 3 3 】



40

( この式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、m および Q は、上で与えた意味を有する )  
のシクロプロパンを、式 ( X V I I I ) :

## 【 0 1 1 2 】

## 【 化 3 4 】



( この式中、R<sup>10</sup> は、上で与えた意味を有する )

50

のニトリル、およびプロトン酸またはテトラフルオロホウ酸トリメチルシリルと反応させること

によって調製することができる。

【0113】

上記式(XVII)は、方法(f)を行うための出発原料として必要なシクロプロパンの一般定義を提供するものである。この式において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、本発明の式(I)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいまたは特に非常に好ましいと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $Q$  は、 $Z^1$ 、 $Z^2$  または  $Z^3$  を表すか、既に上で説明したこれらのラジカルの好ましい、特に好ましい、および特に非常に好ましい定義を表す。

10

【0114】

上記式(XVIII)は、方法(f)を行うための出発原料として必要なニトリルの一般定義を提供するものである。この式において、 $R^{10}$  は、好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、フェニルまたはベンジル、特に好ましくは、メチル、エチル、フェニルまたはベンジル、特に非常に好ましくは、メチル、フェニルまたはベンジルを表す。

【0115】

方法(f)を行う際に適するプロトン酸には、一般にこの目的に使用することができるすべての酸が挙げられる。硫酸は、使用に好ましい可能性がある。

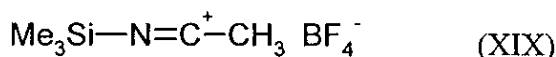
【0116】

20

方法(f)を行うためのテトラフルオロホウ酸トリメチルシリルとしては、式(XIX)：

【0117】

【化35】



の化合物が適する。上記式(XIX)の試薬は、既知である(参照：Tetrahedron Lett. 1984, 25, 577-578)。

【0118】

30

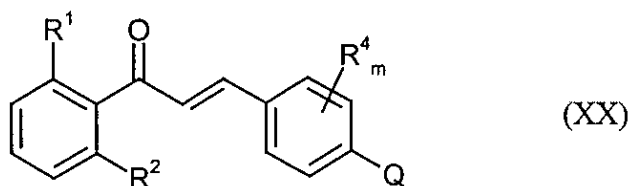
方法(f)を行うための反応温度は、比較的広い範囲で変化させることができる。-20 と +60 の間、好ましくは、-10 と 30 の間の温度での操作が標準的である。

【0119】

方法(f)を行うための出発原料として必要な式(XVII)のシクロプロパンは、g)式(XX)：

【0120】

【化36】



40

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $m$  および  $Q$  は、上で与えた意味を有する) のカルコンを、トリアルキルスルホキシニウムイリドと、塩基の存在下および適する場合には希釈剤の存在下で反応させることによって調製することができる。

【0121】

50

上記式 (X X) は、方法 (g) を行う際、出発原料として必要なカルコンの一般定義を提供するものである。この式において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および  $m$  は、本発明の式 (I) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいまたは特に非常に好ましいと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。 $Q$  は、 $Z^1$ 、 $Z^2$  または  $Z^3$  を表すか、既に上で説明したこれらのラジカルに好ましい、特に好ましい、および特に非常に好ましい定義を表す。

【0122】

方法 (g) を行うためのトリアルキルスルホキソニウムイリドとしては、トリメチルスルホキソニウムイリドの使用が好ましい。

【0123】

方法 (g) を行う際、塩基として、アルカリ金属の水素化物、アルコキシドおよび水酸化物を使用することができる。水酸化ナトリウム、カリウム 2 - メチル - 2 - プロポキシド、ナトリウムメトキシドまたは水酸化カリウムの使用が好ましく、水酸化ナトリウムの使用が特に好ましい。

【0124】

方法 (g) を行う際に適する希釈剤には、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、トルエンまたはジエチレングリコール、およびそれらの混合物が挙げられる。ジメチルスルホキシドの使用が好ましい (参照: Tetrahedron Asymmetry 1998, 9, 1035)。

【0125】

本発明の方法 (g) を行うための反応温度は、比較的広い範囲で変化させることができる。 $-20$  と  $+120$  の間、好ましくは、 $0$  と  $60$  の間、特に好ましくは、 $20$  と  $40$  の間の温度での操作が標準的である。

【0126】

本発明の方法 (g) を行うための出発原料として必要な式 (X X) のカルコンは、既知である。

【0127】

方法 (e) を行う際、プロトン酸 (参照: J. Org. Chem. 1978, 43, 4593)、無機塩基 (参照: J. Chem. Soc. 1964, 4142)、ヒドラジン (参照: J. Org. Chem. 1978, 43, 3711)、または酵素での生体内変換 (参照: Appl. Microbiol. Biotechnol. 1997, 47, 650) を利用し、式 (XVI) のアミドをその反応中に  $N$  - 脱アシル化して、式 (II)、(IV) および (II - a) のピロリンを得る。アミドを脱アシル化する他の慣用の方法は、T. W. Greene, P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis (第3版、New York、Wiley 1999、553 ~ 555 頁) に記載されている。

【0128】

$N$  - 脱アシル化剤としては、プロトン酸または有機酸の使用が好ましく、塩酸水溶液、臭化水素酸水溶液またはトリフルオロ酢酸の使用が特に好ましく、塩酸水溶液の使用が特に非常に好ましく；無機塩基の使用が好ましく、水酸化バリウム [ $Ba(OH)_2$ ] および水酸化ナトリウム ( $NaOH$ ) の使用が特に好ましく、ならびに生体内変換の利用が好ましく、アシラーゼを使用する生体内変換の利用が特に好ましい。

【0129】

生体内変換による  $N$  - 脱アシル化の場合、式 (II)、(IV) および (II - a) の化合物は、二つのエナンチオマーのうち一方が過剰に得られる。

【0130】

方法 (e) を行う際に適する希釈剤には、水またはアルコールおよびこれらの混合物が挙げられる。水、メタノールもしくはエタノール、またはこれら 3 つの希釈剤のうちの 2 つもしくは 3 つの混合物の使用が好ましい。

【0131】

10

20

30

40

50

方法(e)を行う際の反応温度は、比較的広い範囲で変化させることができる。20と200の間、好ましくは、60と140の間、特に好ましくは、80と120の間の温度での操作が標準的である。酵素としてアシラーゼを使用してN-脱アシル化を行う場合、20と60の間、好ましくは、20と40の間での操作が標準的である。

#### 【0132】

方法(e)を行う際、式(XVI)のアミドの10%濃度(重量/容積)アルコール溶液1容量部に付き、2容量部のプロトン酸を使用するのが標準的である。しかし、前記反応成分について他の比率を選択することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を水酸化ナトリウム溶液で中和し、その後、酢酸エチルで抽出して、有機相を乾燥させ、濾過して、濃縮する。

10

#### 【0133】

##### 方法(E)

上記式(VII)は、本発明の方法(E)を行う際に出発原料として必要な<sup>1</sup>-ピロリンの一般定義を提供するものである。この式において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、A、R<sup>4</sup>およびmは、本発明の式(I)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

#### 【0134】

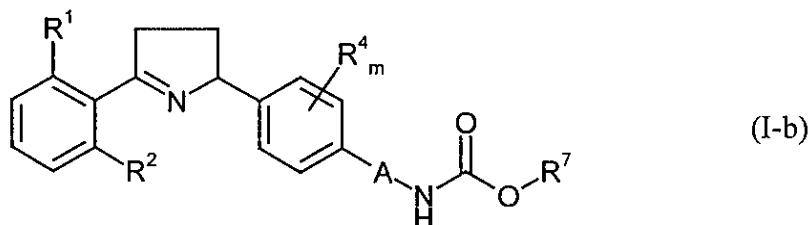
式(VII)の<sup>1</sup>-ピロリンは、新規である。それらは、

20

h)式(I-b)：

#### 【0135】

##### 【化37】



30

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、A、R<sup>4</sup>、mおよびR<sup>7</sup>は、上で与えた意味を有する)の<sup>1</sup>-ピロリンを、無機酸(例えば、塩酸、硫酸)または塩基(例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム)と、適する場合には希釈剤(例えば、メタノール、エタノールなどのアルコール、もしくは水、またはこれらの混合物)の存在下で反応させることによって調製することができる。

#### 【0136】

方法(h)を行う際、出発原料として必要な式(I-b)の<sup>1</sup>-ピロリンは、本発明の式(I)の化合物の亜群である。式(I-b)において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、A、R<sup>4</sup>、mおよびR<sup>7</sup>は、本発明の式(I)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。式(I-b)の<sup>1</sup>-ピロリンは、本発明の方法(A)、(B)、(C)または(D)のうちの一つによって調製することができる。

40

#### 【0137】

上記式(VIII)は、本発明の方法(E)を行う際の出発原料として必要なイソ(チオ)シアネートの一般定義を提供するものである。この式において、YおよびR<sup>7</sup>は、本発明の式(I)の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。

#### 【0138】

式(VIII)のイソ(チオ)シアネートは、既知であり、および/または既知の方法によって調製することができる。

50

## 【 0 1 3 9 】

上記式 ( I X ) は、本発明の方法 ( E ) を行う際の出発原料として必要な ( チオ ) シアネートの一般定義を提供するものである。この式において、 Y および  $R^7$  は、本発明の式 ( I ) の物質の説明に関連してこれらのラジカルに好ましい、特に好ましいなどと既に述べた定義を好ましくは、特に好ましくは、または特に非常に好ましくは表す。  $X^2$  は、好ましくは、 O ( 酸素 ) または S ( 硫黄 ) を表す。

## 【 0 1 4 0 】

式 ( I X ) の ( チオ ) シアネートは、既知であり、および / または既知の方法によって調製することができる。

## 【 0 1 4 1 】

本発明の方法 ( E ) を行う際、一般に、 1 m o l もしくはわずかに過剰の式 ( V I I I ) の化合物および / または 1 m o l もしくはわずかに過剰の式 ( I X ) の化合物を、式 ( V I I ) の化合物 1 m o l につき使用する。しかし、他の比率で前記反応成分を使用することもできる。処理は、慣用の方法によって行う。一般に、反応混合物を酢酸エチルに吸収させて、有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、濾過し、濃縮する。適する場合には、クロマトグラフィーまたは再結晶などの慣用の方法を使用して残存しうる一切の不純物を残留物から除去する。

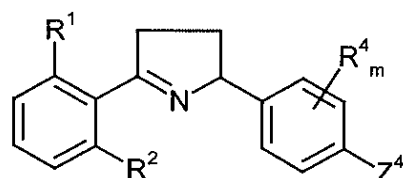
## 【 0 1 4 2 】

式 ( I - a ) のキラル化合物

式 ( I - a ) のキラル化合物を調製するために、例えば、式 ( I I - b ) :

## 【 0 1 4 3 】

## 【 化 3 8 】



(II-b)

( 式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  および m は、上で与えた意味を有し、

$Z^4$  は、塩素、臭素またはヨウ素を表す )

の  $^1$  - ピロリンを光学分割に付することができる。このために、例えば、分取クロマトグラフィー法、好ましくは、高速液体クロマトグラフィー ( H P L C ) 法を利用する。この場合、キラル固定シリカゲル相を使用する。トリス ( 3 , 5 - ジメチルフェニルカルバメート ) - セルロース変性シリカゲルは、式 ( I I - b ) の化合物を二つのエナンチオマーに分離するために特に適することがわかった。この分離用材料は、市販されている。しかし、他の固定相を使用することもできる。適する固定相は、すべての慣用の不活性有機溶媒およびこれらの混合物である。石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサンなどの場合によってはハロゲン化されている脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；メタノール、エタノール、プロパノールなどのアルコール；アセトニトリルなどニトリル；酢酸メチルまたは酢酸エチルなどのエステルの使用が好ましい。ヘキサンまたはヘプタンなどの脂肪族炭化水素、メタノールまたはプロパノールなどのアルコールの使用は、特に好ましく、n - ヘプタンおよびイソプロパノールまたはこれらの混合物の使用は、特に非常に好ましい。一般に、この分離は、 10 と 60 の間の温度、好ましくは、 10 と 40 の間の温度、特に好ましくは、室温で行う。このようにして得られた ( R ) 型エナンチオマーを、その後、方法 ( A )、( C ) または ( D ) のための出発原料として使用する。

## 【 0 1 4 4 】

本発明の方法 ( A )、( B )、( C ) および ( D ) を行う際には、各場合、パラジウム触媒を利用し、その部分に、さらなる配位子が付加されているもの、されていないものを使用することができる。使用する触媒は、好ましくは、  $PdCl_2(dppf)[dpp]$

10

20

30

40

50

$f = 1, 1'$  - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン]、 $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ 、 $PdCl_2(CH_3CN)_2$ 、 $Pd_2(dba)_3$  [ $dba$  = ジベンジリデンアセトン] または  $Pd(OAc)_2$ 、特に好ましくは、 $PdCl_2(dppf)$ 、 $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$  または  $Pd(OAc)_2$ 、特に非常に好ましくは、 $PdCl_2(dppf)$  または  $PdCl_2(PPh_3)_2$  である。

#### 【0145】

適する配位子は、トリアリールホスフィン、トリアルキルホスフィンまたはアルシンである。 $dppf$ 、 $PPh_3$ 、 $P(t-Bu)_3$ 、 $Pcy_3$  または  $AsPh_3$  の使用が好ましく、 $dppf$  の使用は、特に好ましい。

#### 【0146】

本発明の方法 (A)、(B) および (C) を行うために適する希釈剤は、各場合、すべての慣用の不活性有機溶媒である。石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンなどの、場合によってはハロゲン化されている脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、メチル *t*-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタンまたはアニソールなどのエーテル；アセトニトリル、プロピオニトリル、*n*-もしくはイソブチロニトリルまたはベンゾニトリルなどのニトリル；*N,N*-ジメチルホルムアミド、*N,N*-ジメチルアセトアミド、*N*-メチルホルムアニリド、*N*-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルなどのエステル；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド；あるいはスルホランなどのスルホンの使用が好ましい。アセトン、ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、エタノール、トルエン、または適する場合には前述の希釈剤と水の混合物の使用が、特に好ましい。

#### 【0147】

本発明の方法 (D) および (E) を行うために適する希釈剤は、各場合、すべての慣用の不活性有機溶媒である。石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンなどの、場合によってはハロゲン化されている脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、メチル *t*-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 2-ジエトキシエタンまたはアニソールなどのエーテルの使用が好ましい。本発明の方法 (D) を行う際、ジオキサン、テトラヒドロフランまたはトルエンの使用は、特に好ましい。

#### 【0148】

本発明の方法 (A)、(B)、(C) および (D) を行うために適する酸性結合剤は、各場合、そうした反応に慣用のすべての無機および有機塩基である。水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムなどのアルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、または他に、水酸化アンモニウム；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムなどのアルカリ金属炭酸塩；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムなどのアルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩；アルカリ金属フッ化物；およびまた、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン、ピリジン、*N*-メチルピペリジン、*N,N*-ジメチルアミノピリジン、ジアザピシクロオクタン (DABCO)、ジアザピシクロノネン (DBN) またはジアザピシクロウンデセン (DBU) などの第三アミンの使用が好ましい。しかし、酸性結合剤を添加せずに操作することもでき、または過剰のアミン成分を使用して、同時に酸性結合剤として作用させることもできる。水酸化バリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、リン

10

20

30

40

50

酸三カリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、酢酸カリウム、トリエチルアミン、カリウム *t* - ブトキシド、フッ化セシウムまたはフッ化カリウムの使用が特に好ましい。

【0149】

本発明の方法 (E) を行うために適する酸性結合剤は、各場合、そうした反応に慣用のすべての無機および有機塩基である。炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムなどのアルカリ金属炭酸塩、およびまた、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N - ジメチルアニリン、ピリジン、N - メチルピペリジン、N, N - ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン (DABCO)、ジアザビスクロノネン (DBN) またはジアザビスクロウンデセン (DBU) などの第三アミンの使用が好ましい。しかし、酸性結合剤を添加せずに操作することもできる。

10

【0150】

本発明の方法 (A)、(B) および (C) を行う際の反応温度は、各場合、比較的広い範囲で変化させることができる。一般に、反応は、0 と 140 の間、好ましくは、20 と 120 の間、特に好ましくは、60 と 100 の間の温度で行う。

【0151】

本発明の方法 (D) を行う際の反応温度は、各場合、比較的広い範囲で変化させることができる。一般に、反応は、0 と 140 の間、好ましくは、20 と 120 の間の温度で行う。

【0152】

20

本発明の方法 (E) を行う際の反応温度は、各場合、比較的広い範囲で変化させることができる。一般に、反応は、0 と 100 の間、好ましくは、20 と 50 の間の温度で行う。

【0153】

本発明のすべての方法は、一般には大気圧下で行う。しかし、各場合、高圧または減圧下で操作することもできる。

【0154】

本発明の活性化化合物は、農業において、林業において、貯蔵製品および材料の保護において、ならびに衛生部門において遭遇する動物有害生物、特に、昆虫、クモ形類および線虫の防除に適し、且つ、良好な植物許容度および温血動物に対して好ましい毒性を有する。これらは、好ましくは、植物保護薬として利用することができる。これらは、正常な感受性および耐性の種に対して有効であり、ならびに発育のすべての段階またはいくつかの段階に対して有効である。上述の有害生物には、以下のものが挙げられる。

30

【0155】

等脚目 (Isopoda) の種類から、例えば、オニスカス・アセルス (Oniscus asellus)、オカダンゴムシ (Armadillidium vulgare)、およびボルセリオ・スカバー (Porcellio scaber)。

【0156】

倍脚目 (Diplopoda) の種類から、例えば、ブラニウルス・グットラタス (Blaniulus guttulatus)。

40

【0157】

唇脚目 (Chilopoda) の種類から、例えば、ゲオフィルス・カルポファグス (Geophilus carpophagus)、およびスクティゲラ属種 (Scutigera spp.)。

【0158】

結合目 (Symphyla) の種類から、例えば、スクティゲレラ・イマキュラタ (Scutigerebella immaculata)。

【0159】

総尾目 (Thysanura) の種類から、例えば、レプシマ・サカリナ (Lepisma saccharina)。

50



## 【0160】

粘管目 (*Collembola*) の種類から、例えば、オニチウルス・アルマツス (*Onychiuus armatus*)。

## 【0161】

直翅目 (*Orthoptera*) の種類から、例えば、アチータ・ドメスチクス (*Achetia domesticus*)、ケラ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria migratorioides*)、メラノプルス種 (*Melanoplus* spp.)、およびシストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*)。

## 【0162】

ゴキブリ類 (*Blattaria*) の種類から、例えば、トウキョウゴキブリ (*Blattella orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、ロイコファエ・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、チャパネ・ゴキブリ (*Blattella germanica*)。

## 【0163】

ハサミムシ類 (*Dermaptera*) の種類から、例えば、ホルフィキュラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)。

## 【0164】

等翅目 (*Isoptera*) の種類から、例えば、ヤマトシロアリ種 (*Reticulitermes* spp.)。

## 【0165】

シラミ類 (*Phthiraptera*) の種類から、ヒトキモノジラミ (*Pediculus humanus corporis*)、ブタジラミ属種 (*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ属種 (*Linognathus* spp.)、ケモノハジラミ属種 (*Trichodectes* spp.) およびダマリニア属種 (*Damalinea* spp.)。

## 【0166】

総翅目 (*Thysanoptera*) の種類から、例えば、クリバネアザミウマ (*Heliothrips femoralis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*) およびフランクリニエラ・オクシデンタリス (*Frankliniella accidentalis*)。

## 【0167】

異翅目 (*Heteroptera*) の種類から、例えば、チャイロカメムシ (*Eurygaster* spp.)、ジスデルクス・インテルメジウス (*Dysdercus intermedius*)、ピエスマ・クワドラタ (*Piesma quadrata*)、ナンキンムシ (*Cimex lectularius*)、ロドニウス・プロリクス (*Rhodnius prolixus*)、およびサシガメ属種 (*Triatoma* spp.)。

## 【0168】

同翅目 (*Homoptera*) から、例えば、アレウロデス・ブラシカエ (*Aleurodes brassicae*)、ワタコナジラミ (*Bemisia tabaci*)、トリアレウロデス・バポラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、リンゴ・ワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus arundinis*)、ブドウシラミ (*Phylloxera vastatrix*)、ペムフィガス属種 (*Pemphigus* spp.)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum avenae*)、コブアブラムシ属種 (*Myzus* spp.)、ホップアブラムシ (*Phorod*

10

20

30

40

50

on humuli)、ムギクビレアブラムシ(Rhopalosiphum padi)、ヒメヨコバイ属種(Empoasca spp.)、ユースセリス・ビロバツス(Euscelis bilobatus)、ツماغロヨコバイ(Nephrotettix cincticeps)、ミズキカタカイガラムシ(Lecanium corni)、オリーブカタカイガラムシ(Saissetia oleae)、ヒメトビウンカ(Laodelphax striatellus)、トビロウンカ(Nilaparvata lugens)、アカマルカイガラムシ(Aonidiella aurantii)、シマロルカイガラムシ(Aspidiotus hederiae)、プシュードコッカス属種(Pseudococcus spp.)、およびキジラミ属種(Psylla spp.)。

10

## 【0169】

鱗翅目(Lepidoptera)の種類から、例えば、ワタアカムシ(Pectinophora gossypiella)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、ケトマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、リソコレチス・ブランカルデラ(Lithocolletis blancardella)、ヒポノミュウタ・パデラ(Hypnomyeta padella)、コナガ(Plutella xylostella)、ウメケムシ(Malacosoma neustria)、クワノキンムケシ(Euproctis chrysorrhoea)、マイマイガ属種(Lymantria spp.)、ブッカラトリックス・スルベリエラ(Buccatrix thurberiella)、ミカンハモグリガ(Phyllocnistis citrella)、ヤガ属種(Agrotis spp.)、ユークソア属種(Euxoa spp.)、フェルチア属種(Feltia spp.)、エアリアス・インスラナ(Earias insulana)、ヘリオチス属種(Heliothis spp.)、ヨトウムシ(Mamestra brassicae)、パノリス(Panolis flammea)、ヒロイチモジョトウ属種(Spodoptera spp.)、トリコブルシア・ニ(Trichoplusia ni)、カルボカプサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonella)、アセビ属種(Pieris spp.)、ニカメイガ属種(Chilo spp.)、アワノメイガ(Pyrausta nubilalis)、スジコナマダラメイガ(Ephesia kuehniella)、ハチミツガ(Galleria mellonella)、ティネオラ・ビセリエラ(Tineola bisselliella)、ティネア・ペリオネラ(Tinea pellionella)、ホフマノフィラ・プッシュードスプレテラ(Hofmannophila pseudospretella)、カコエシア・ポダナ(Cacoecia podana)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、クリストネウラ・フェミフェラナ(Choristoneura fumiferana)、クリシア・アンビグエラ(Clysia ambiguelia)、チアハマキ(Homona magnanima)、トルトリクス・ビリダナ(Tortrix viridana)、シナファロセルス属種(Cnaphalocerus spp.)、イネクビボソハムシ(Oulema oryzae)。

20

30

## 【0170】

鞘翅目(Coleoptera)の種類から、例えば、アノビウム・プンクタツム(Anobium punctatum)、コナナガシンクイムシ(Rhizopertha dominica)、ブルキジウス・オブテクタス(Bruchidius obtectus)、インゲンマメゾウムシ(Acanthoscelides obtectus)、ヒロトルベス・バジュルス(Hylotrupes bajulus)、アゲラスチカ・アルニ(Agelastica alni)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(Leptinotarsa decemlineata)、ファエドン・コクレアリア(Phaedon cochleariae)、ジアブロチカ属種(Diabrotica spp.)、プシリオデス・クリソセファラ(Psylliodes chrysocephalus)、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna varivestis)

40

50

)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、ノコギリヒラムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、ハナゾウムシ属種 (*Anthonomus* spp.)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、パシヨウゾウムシ (*Cosmopolites sordidus*)、シュートリンクス・アシミリス (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、カツオブシムシ属種 (*Dermestes* spp.)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、ヒラタキクイムシ属種 (*Lyctus* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、ヒョウホンムシ属種 (*Ptinus* spp.)、ニップツス・ホロレウカス (*Niptus hololeucus*)、セマルヒョウホンムシ (*Gibbium psylloides*)、コクヌストモドキ属種 (*Tribolium* spp.)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コメデルス属種 (*Agriotes* spp.)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、メロロサ・メロロンサ (*Melolontha melolontha*)、アムフィマロン・ゾルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、コステリトラ・ザアランジカ (*Costelytra zealandica*) およびイネゾウリムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)。

10

## 【0171】

20

膜翅目 (*Hymenoptera*) の種類から、例えば、マツハバチ属種 (*Diprion* spp.)、ホブロカムバ属種 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ属種 (*Monomorium pharaonis*)、およびスズメバチ属種 (*Vespa* spp.)。

## 【0172】

双翅目 (*Diptera*) の種類から、例えば、ヤブカ属種 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.)、イエカ属種 (*Culex* spp.)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、イエバエ属種 (*Musca* spp.)、ヒメイエバエ属種 (*Fannia* spp.)、オオクロバエ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、キンバエ属種 (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ属種 (*Chrysomya* spp.)、ウサギヒフバエ属種 (*Cuterebra* spp.)、ウマバエ属種 (*Gastrophilus* spp.)、ウマシラミバエ属種 (*Hyppobosca* spp.)、サシバエ属種 (*Stomoxys* spp.)、ヒツジバエ属種 (*Oestrus* spp.)、ヒフバエ属種 (*Hypoderma* spp.)、アブ属種 (*Tabanus* spp.)、タニア属種 (*Tannia* spp.)、ケバエ (*Biblio hortulanus*)、オスシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、クロキンバエ属種 (*Phorbia* spp.)、アカザモグリハナバエ (*Pegomya hyoscyami*)、チチュウカイバエ (*Ceratitis capitata*)、ミバエオレアエ (*Dacus oleae*)、ガガンボ・バルドーサ (*Tipula paludosa*)、ハイレマイア属種 (*Hylemyia* spp.)、およびリリノマイザ属種 (*Lirinomyza* spp.)。

30

40

## 【0173】

ノミ目 (*Siphonaptera*) の種類から、例えば、ケオブスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、およびナガノミ属種 (*Ceratophyllus* spp.)。

## 【0174】

クモ形綱 (*Arachnida*) の種類から、例えば、コガネサソリ (*Scorpio maurus*)、クロゴケグモ (*Latrodectus mactans*)、アシブトコナダニ (*Acarus siro*)、ナガヒメダニ属種 (*Argas* spp.)、

50

カズキダニ属種 (*Ornithodoros* spp.)、ニワトリダニ (*Dermanyssus gallinae*)、エリオフィエス・リビス (*Eriophyes ribis*)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta oleivora*)、ウシマダニ属種 (*Boophilus* spp.)、コイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.)、キララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.)、イボマダニ属種 (*Hyalomma* spp.)、マダニ属種 (*Ixodes* spp.)、キコセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptes* spp.)、シヨクヒヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ホコリダニ属種 (*Tarsonemus* spp.)、クローバハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ミカンリンゴハダニ属種 (*Panonychus* spp.)、ナミハダニ属種 (*Tetranychus* spp.)、ヘミタルソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、ブレビパルプス (*Brevipalpus* spp.)。

#### 【0175】

植物寄生線虫には、例えば、ネグサレセンチュウ属種 (*Pratylenchus* spp.)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*)、ミカンネセンチュウ (*Thylenchulus semipenetrans*)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、ネコブセンチュウ属種 (*Meloidogyne* spp.)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、ドジョウセンチュウ属種 (*Longidorus* spp.)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、トリコドラス属種 (*Trichodorus* spp.)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.) が挙げられる。

#### 【0176】

特に、本発明の式 (I) の化合物は、イモムシ、甲虫類の幼虫、ハダニ、アブラムシおよびハモグリバエに対して卓越した活性を有する。

#### 【0177】

適する場合には、本発明の化合物は、一定の濃度または塗布率で、除草薬または殺微生物薬、例えば、殺真菌薬、抗真菌薬および殺菌薬として使用することもできる。適する場合には、本発明の化合物は、他の活性化合物を合成するための中間体または前駆体として利用することもできる。

#### 【0178】

すべての植物および植物の部分を本発明に従って処理することができる。植物は、望ましいおよび望ましくない野生植物または農作物植物 (天然農作物植物を含む) などのすべての植物および植物群を本文脈では意味するものとして理解いただきたい。農作物植物は、従来の植物繁殖法および至適化法によって、または生物工学的的方法もしくは組換え法によって、またはこれらの方法の併用によって得ることができる植物であり、トランスジェニック植物を含むとともに、植物育種家の権利によって保護可能なもしくは保護可能でない植物栽培品種を含む。植物の部分とは、苗条、葉、花および根などの植物の地上および地下のすべての部分および器官を意味するものとして理解いただきたい。その例には、葉、針、茎、幹、花、子実体、果実、種子、根、塊茎および根茎を挙げることができる。植物の部分には、収穫物、ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば、挿し木、塊茎、根茎、短葡枝および種子も含まれる。

#### 【0179】

本活性化合物での本発明による植物および植物の部分の処理は、直接行うことができ、または慣用の処理法、例えば、浸漬、吹付け、蒸発、噴霧、散布、塗布により、および繁殖材料の場合、特に、種子の場合には、一層以上のコーティングを施すことにもより、本化合物を植物および植物の部分の周囲、環境または貯蔵空間に対して作用させることによって行うことができる。

10

20

30

40

50

## 【0180】

本発明の活性化合物は、溶液、エマルジョン、水和剤、懸濁液、粉末、微粉、ペースト、可溶性粉末、顆粒、懸濁液 - エマルジョン濃縮物、活性化合物に含浸させた天然および合成物質、ならびに高分子物質中のマイクロカプセルに加工することができる。

## 【0181】

これらの調合物は、既知の方法で、例えば、界面活性剤、すなわち乳化剤および/または分散剤、および/または発泡剤を場合によっては使用して、本発明の活性化合物を増量剤、すなわち液体溶媒、および/または固体担体と混合することによって生成される。

## 【0182】

使用される増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することも可能である。本質的に、適する液体溶媒は、芳香族化合物（キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンなど）、塩素化芳香族化合物および塩素化脂肪族炭化水素（クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンなど）、脂肪族炭化水素（シクロヘキサンまたはパラフィン、例えば、石油留分、鉱物油および植物油など）、アルコール（ブタノールまたはグリコールなど）ならびにまたそれらのエーテルおよびエステル、ケトン（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンなど）、強極性溶媒（ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなど）、ならびにまた水である。

10

## 【0183】

適する固体担体は、例えば、アンモニウム塩および粉碎天然鉱物（カオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アパタルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土など）および粉碎合成鉱物（高分散シリカ、アルミナおよびシリケートなど）であり；顆粒に適する固体担体は、例えば、破碎し、分別した天然石（方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトなど）、ならびにまた無機および有機ミールの合成顆粒、ならびに有機材料（おがくず、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸およびタバコの茎など）の顆粒であり；

20

適する乳化剤および/または発泡剤は、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテルなどの非イオン性およびアニオン性乳化剤、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリアルスルホネート、およびまた蛋白水解物であり；

適する分散剤は、例えば、リグノ亜硫酸排液およびメチルセルロースである。

30

## 【0184】

カルボキシメチルセルロース、ならびに粉末、顆粒またはラテックスの形態の天然および合成ポリマー（アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなど）、ならびに天然リン脂質（セファリンおよびレシチンなど）、および合成リン脂質のような粘着付与剤を本調合物に使用することができる。他の添加剤としては、鉱物油および植物油が可能である。

## 【0185】

無機顔料（例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびブルシアンブルー）、および有機染料（アリザリン染料、アゾ染料および金属種フタロシアニン染料など）、および微量栄養素（鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩など）などの着色剤を使用することができる。

40

## 【0186】

本調合物は、本活性化合物を一般には0.1重量%と95重量%の間、好ましくは0.5重量%と90重量%の間含む。

## 【0187】

本発明の活性化合物は、慣用の市販形で使用することができ、または殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌薬、殺ダニ薬、殺線虫薬、殺真菌薬、成長調節物質または除草薬などの他の活性化合物との混合物としてそれらの調合物の形態で使用することができる。前記殺虫剤には、なかでも、例えば、リン酸エステル、カルバメート、カルボキシレート、塩素化炭化水素、フェニル尿素、および微生物によって生産された物質が挙げられる。

50

## 【 0 1 8 8 】

特に有利な共同成分は、例えば、以下のものである：

殺真菌薬：

アルジモルフ、アムプロピルホス、アムプロピルホス - カリウム、アンドプリム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、

ベナラキシル、ベノダニル、ベノミル、ベンザマクリル、ベンザマクリル - イソブチル、ピアラホス、ピナバクリル、ピフェニル、ピタータノール、プラスチシジン - S、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、多硫化カルシウム、カプシマイシン、ダイホルタン、カプタン、カルベンダジム、カルボキシシン、カルボン、キノメチオネート、クロベンチアゾン、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロサロニル、クロゾリネート、クロジラコム、クフラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、シプロフラム、

デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノキャップ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリムホス、ジチアノン、ドデモルフ、ドジン、ドラゾキシロン、

エジフェンホス、エボキシコナゾール、エタコナゾール、エチリモール、エトリジアゾール、

ファモキサドン、フェナバニル、フェナリモール、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェニトロパン、フェンピクロニル、フェンプロビジン、フェンプロビモルフ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルメトバー、フルオロマイド、フルキンコナゾール、フルルプリミドール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルトリアホル、ホルベット、ホセチル - アルミニウム、ホセチル - ナトリウム、フサライド、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フルカルボニル、フルコナゾール、フルコナゾール - c i s、フルメシクロクス、グアザチン、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、

イマザリル、イミベンコナゾール、イミノオクタジン、イミノオクタジンアルベシレート、イミノクタジントリアセテート、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブロベンホス ( I B P )、イブロジオン、イルママイシン、イソプロチオラン、イソバレジオン、

カスガマイシン、クレソキシム - メチル、銅調製物 ( 水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシシン - 銅およびボルドー合剤など )、

マンコッパー、マンゼブ、マネブ、メフェリムゾン、メパニピリム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトメクラム、メトスルホバクス、ミルジオマイシン、ミクロブタニル、マイクロゾリン、

ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロサル - イソプロピル、ヌアリモール、オフラス、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシリン酸、オキシカルボキシム、オキシフェンチン、

パクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ホスジフェン、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシシン、ポリオキシソリム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロバモカルブ、プロパノシン - ナトリウム、プロピコナゾール、プロピネブ、ピラゾホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、ピロキシフル、

キンコナゾール、キントゼン ( P C N B )、

硫黄および硫黄調製物、

テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトシクラシス、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チシオフエン、チフルザミド、チオファネート - メチル、チラム、チオキシミド、トルクロホス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、

ユニコナゾール、

10

20

30

40

50

バリダマイシン A、ピンクロゾリン、ピンコナゾール、  
 ザリルアミド、ジネブ、ジラム、ならびにまた  
 Dagger G、OK<sup>®</sup> 8705、OK<sup>®</sup> 8801、  
 - (1, 1 - ジメチルエチル) - - (2 - フェノキシエチル) - 1 H - 1, 2, 4  
 - トリアゾール - 1 - エタノール、  
 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - - フルオロ - - プロピル - 1 H - 1, 2, 4  
 - トリアゾール - 1 - エタノール、  
 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - - メトキシ - - メチル - 1 H - 1, 2, 4 -  
 トリアゾール - 1 - エタノール、  
 - (5 - メチル - 1, 3 - ジオキサン - 5 - イル) - - [[ 4 - (トリフルオロメ 10  
 チル) - フェニル] - メチレン] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、  
 (5 RS, 6 RS) - 6 - ヒドロキシ - 2, 2, 7, 7 - テトラメチル - 5 - (1 H -  
 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 3 - オクタノン、  
 (E) - - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - フェノキシ - フェニルアセトアミ  
 ド、  
 { 2 - メチル - 1 - [[ [ 1 - (4 - メチルフェニル) - エチル] - アミノ] - カルボ  
 ニル] - プロピル} - カルバミン酸 1 - イソプロピル、  
 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イ  
 ル) - エタノン - O - (フェニルメチル) - オキシム、  
 1 - (2 - メチル - 1 - ナフタレニル) - 1 H - ピロール - 2, 5 - ジオン、 20  
 1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - (2 - プロペニル) - 2, 5 - ピロリジンジ  
 オン、  
 1 - [(ジヨードメチル) - スルホニル] - 4 - メチル - ベンゼン、  
 1 - [[ 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル] - メ  
 チル - 1 H - イミダゾール、  
 1 - [[ 2 - (4 - クロロフェニル) - 3 - フェニルオキシラニル] - メチル] - 1 H  
 - 1, 2, 4 - トリアゾール、  
 1 - [1 - [2 - [(2, 4 - ジクロロフェニル) - メトキシ] - フェニル] - エテニ  
 ル] - 1 H - イミダゾール、  
 1 - メチル - 5 - ノニル - 2 - (フェニルメチル) - 3 - ピロリジノール、 30  
 2', 6' - ジブromo - 2 - メチル - 4' - トリフルオロメトキシ - 4' - トリフルオ  
 ロ - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキサニリド、  
 2, 2 - ジクロロ - N - [1 - (4 - クロロフェニル) - エチル] - 1 - エチル - 3 -  
 メチル - シクロプロパンカルボキサミド；  
 2, 6 - ジクロロ - 5 - (メチルチオ) - 4 - ピリミジニル - チオシアネート、  
 2, 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、  
 2, 6 - ジクロロ - N - [[ 4 - (トリフルオロメチル) - フェニル] - メチル] - ベ  
 ンズアミド、  
 2 - (2, 3, 3 - トリヨード - 2 - プロペニル) - 2 H - テトラゾール、  
 2 - [(1 - メチルエチル) - スルホニル] - 5 - (トリクロロメチル) - 1, 3, 4 40  
 - チアジアゾール、  
 2 - [[ 6 - デオキシ 4 - O - (4 - O - メチル - - D - グリコピラノシル) - -  
 D - グリコピラノシル] - アミノ] - 4 - メトキシ - 1 H - ピロロ [2, 3 - d] ピリミ  
 ジン - 5 - カルボニトリル、  
 2 - アミノブタン、  
 2 - ブromo - 2 - (ブromoメチル) - ペンタンジニトリル、  
 2 - クロロ - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4  
 - イル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、  
 2 - クロロ - N - (2, 6 - ジメチルフェニル) - N - (イソチオシアナトメチル) -  
 アセトアミド、

- 2 - フェニルフェノール (OPP)、  
 3, 4 - ジクロロ - 1 - [ 4 - (ジフルオロメトキシ) - フェニル ] - 1H - ピロール  
 - 2, 5 - ジオン、  
 3, 5 - ジクロロ - N - [ シアノ ( 1 - メチル - 2 - プロピニル ) - オキシ ] - メチル  
 ] - ベンズアミド、  
 3 - ( 1, 1 - ジメチルプロピル - 1 - オキソ - 1H - インデン - 2 - カルボニトリル  
 、  
 3 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - エトキシ - 3 - イソキサゾリジニル ] - ピリ  
 ジン、  
 4 - クロロ - 2 - シアノ - N, N - ジメチル - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - 1H - イ 10  
 ミダゾール - 1 - スルホンアミド、  
 4 - メチル - テトラゾロ [ 1, 5 - a ] キナゾキリン - 5 ( 4H ) - オン、  
 8 - ( 1, 1 - ジメチルエチル ) - N - エチル - N - プロピル - 1, 4 - ジオキサスピ  
 ロ [ 4, 5 ] デカン - 2 - メタンアミン、  
 硫酸 8 - ヒドロキシキノリン、  
 9H - キサンテン - 2 - [ (フェニルアミノ) - カルボニル ] - 9 - カルボン酸ヒドラ  
 ジド、  
 ビス - ( 1 - メチルエチル ) - 3 - メチル - 4 - [ ( 3 - メチルベンゾイル ) - オキシ  
 ] - 2, 5 - チオフェンジカルボキシレート、  
 cis - 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - 20  
 イル ) - シクロヘプタノール、  
 塩酸 cis - 4 - [ 3 - [ 4 - ( 1, 1 - ジメチルプロピル ) - フェニル - 2 - メチル  
 プロピル ] - 2, 6 - ジメチル - モルホリン、  
 [ ( 4 - クロロフェニル ) - アゾ ] - シアノ酢酸エチル、  
 重炭酸カリウム、  
 メタンテトラチオール・ナトリウム塩、  
 1 - ( 2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル ) - 1H - イ  
 ミダゾール - 5 - カルボン酸メチル、  
 N - ( 2, 6 - ジメチルフェニル ) - N - ( 5 - イソキサゾリルカルボニル ) - DL - 30  
 アラニン酸メチル、  
 N - ( クロロアセチル ) - N - ( 2, 6 - ジメチルフェニル ) - DL - アラニン酸メチ  
 ル、  
 N - ( 2, 3 - ジクロロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 - メチル - シクロヘキサノ  
 ルボキサミド；  
 N - ( 2, 6 - ジメチルフェニル ) - 2 - メトキシ - N - ( テトラヒドロ - 2 - オキソ  
 - 3 - フラニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 2, 6 - ジメチルフェニル ) - 2 - メトキシ - N - ( テトラヒドロ - 2 - オキソ  
 - 3 - チエニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル ) - 4 - メチル - 3 - ニトロ - ベンゼンスルホ  
 ンアミド、 40  
 N - ( 4 - シクロヘキシルフェニル ) - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジ  
 ンアミン、  
 N - ( 4 - ヘキシルフェニル ) - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジンアミ  
 ン、  
 N - ( 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル ) - 2 - メトキシ - N - ( 2 - オキソ - 3 - オ  
 キサゾリジニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 6 - メトキシ - 3 - ピリジニル ) - シクロプロパンカルボキサミド、  
 N - [ 2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - [ (クロロアセチル) - アミノ ] - エチル ] - ベ  
 ンズアミド、  
 N - [ 3 - クロロ - 4, 5 - ビス - ( 2 - プロピニルオキシ ) - フェニル ] - N' - メ 50



トキシ - メタンイミドアミド、

N - ホルミル - N - ヒドロキシ - DL - アラニン - ナトリウム塩、

[ 2 - ( ジプロピルアミノ ) - 2 - オキソエチル ] - エチルホスロアミドチオ酸 O , O - ジエチル、

フェニルプロピルホスホロアミドチオ酸 O - メチル S - フェニル、

1 , 2 , 3 - ベンゾチアジアゾール - 7 - カルボチオ酸 S - メチル、

スピロ [ 2 H ] - 1 - ベンゾピラン - 2 , 1 ' ( 3 ' H ) - イソベンゾフラン ] - 3 ' - オン、

殺菌薬：

プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル 10  
、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベ  
ナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅および他の銅調製物。

【 0 1 8 9 】

殺虫薬 / ダニ駆除薬 / 殺線虫薬：

アバメクチン、アセフェート、アセトアミプリド、アクリナトリン、アラニカルブ、アル  
ジカルブ、アルドキシカルブ、アルファシベルメトリン、アルファメトリン、アミトラ  
ズ、アベルメクチン、AZ 60541、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス A  
、アジンホス M、アゾシクロチン、

乳化病菌 ( *Bacillus popilliae* )、バシラス・スフェリカス ( *Bacillus sphaericus* )、枯草菌 ( *Bacillus subtilis* )、バシラス・スリンジエンシス ( *Bacillus thuringiensis* )、バ  
キウロウイルス、ボーバリア・バッシアーナ ( *Beauvaria bassiana* )、ボーバリア・テネーラ ( *Beauvaria tenella* )、ベンジオカルブ、  
ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、ベータシフルトリン、ピフェナゼ  
ート、ピフェントリン、バイオエタノメトリン、バイオパーメトリン、BPMC、プロモ  
ホス A、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブチルピ  
リダベン、 20

カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カル  
タップ、クロエトカルブ、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンピン  
ホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス M、クロバ  
ポルトリン、cis - レスメトリン、cis - パーメトリン、クロシトリン、クロエトカル  
ブ、クロフェンテジン、シアノホス、シクロブレン、シクロプロトリン、シフルトリン  
、シハロトリン、シヘキサチン、シパーメトリン、シロマジン、 30

デルタメトリン、デメトン M、デメトン S、デメトン - S - メチル、ジアフェンチウロ  
ン、ジアジノン、ジクロルボス、ジフルベンズウロン、ジメトエート、ジメチルピンホス  
、ジオフェノラン、ジスルホトン、ドクサット - ナトリウム、ドフェナビン、

エフルシラネート、エマメクチン、エムペントリン、エンドスルファン、ハエカビ属種  
( *Entomophthora* spp. )、エブリノメクチン、エスフェンバレレート  
、エチオフェンカルブ、エチオン、エトプロホス、エトフェンプロックス、エトキサゾー  
ル、エトリムホス、 40

フェナミホス、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチ  
オカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、  
フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンバレレート、フィプロニル、フルアズ  
ロン、フルプロシトリネート、フルシクロキユロン、フルシトリネート、フルフェノキユ  
ロン、フルテンジン、フルバリネート、ホノホス、ホスメチラン、ホスチアゼート、フブ  
フェンプロックス、フラチオカルブ、

顆粒症ウイルス、

ハロフェノジド、HCH、ヘプテノホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒド  
ロブレン、

イミダクロピリド、イサゾホス、イソフェンホス、イソオキサチオン、イベルメクチン 50

、  
核多角体病ウイルス、  
ラムダ - シハロトリン、ルフェヌロン、  
マラチオン、メカルバム、メタアルデヒド、メタアミドホス、メサルヒジウム アニソ  
プリエ ( *Metharhizium anisopliae* )、メサルヒジウム フラボ  
ビリデ ( *Metharhizium flavoviride* )、メチダチオン、メチオ  
カルブ、メトミル、メトキシフェノジド、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス  
、ミルベメクチン、モノクロトホス、  
ナレド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、  
オメトエート、オキサミル、オキシデメトンM、  
ベシロマイセス・フモソルセウス ( *Paecilomyces fumosoroseus* )、パラチオンA、パラチオンM、パーメトリン、フェントエート、ホレート、ホサ  
ロン、ホスメト、ホスファミドン、ホキシム、ピリミカルブ、ピリミホスA、ピリミホス  
M、プロフェノホス、プロメカルブ、プロボスキル、プロチオホス、プロトエート、ピメ  
トロジン、ピラクロホス、ピレスメトリン、ジョチュウギク、ピリダベン、ピリダチオン  
、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、  
キナルホス、  
リバピリン、  
サリチオン、セブホス、セラメクチン、シラフルオフエン、スピノサド、スルホテブ、  
スルプロホス、  
タウ - フルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリミホス、テフル  
ベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミビンホス、ターブホス、テトラクロルピンホ  
ス、シータ - シペルメトリン、チアメトキサム、チアプロニル、チアトリホス、シュウ酸  
水素チオシクラム、チオジカルブ、チオフアノックス、サーリンジエシン、トラロシトリ  
ン、トラロメトリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、トリアズロン、ト  
リクロフェニジン、トリクロルホン、トリフルムロン、トリメタカルブ、  
バミドチオン、バニリプロール、バーティシリウム・レカニイ ( *Verticillium lecanii* )、  
Y I 5 3 0 2、  
ゼータ - シペルメトリン、ゾラプロホス、  
( 1 R - cis ) - [ 5 - ( フェニルメチル ) - 3 - フラニル ] - メチル - 3 - 「 ( ジ  
ヒドロ - 2 - オキソ - 3 ( 2 H ) - フラニリデン ) - メチル ] - 2 , 2 - ジメチルシクロ  
プロパンカルボキシレート、  
( 3 - フェノキシフェニル ) - メチル - 2 , 2 , 3 , 3 - テトラメチルシクロプロパン  
カルボキシレート、  
1 - [ ( 2 - クロロ - 5 - チアゾリル ) メチル ] テトラヒドロ - 3 , 5 - ジメチル - N  
- ニトロ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 ( 1 H ) - イミン、  
2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 4 - [ 4 ' ( 1 , 1 - ジメチルエチル )  
フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - オキサゾール、  
2 - ( アセチルオキシ ) - 3 - ドデシル - 1 , 4 - ナフタレンジオン、  
2 - クロロ - N - [ [ [ 4 - ( 1 - フェニルエトキシ ) - フェニル ] - アミノ ] - カル  
ボニル ] - ベンズアミド、  
2 - クロロ - N - [ [ [ 4 - ( 2 , 2 - ジクロロ - 1 , 1 - ジフルオロエトキシ ) - フ  
ェニル ] - アミノ ] - カルボニル ] - ベンズアミド、  
プロピルカルバミン酸 3 - メチルフェニル、  
4 - [ 4 - ( 4 - エトキシフェニル ) - 4 - メチルフェニル ] - 1 - フルオロ - 2 - フ  
ェノキシ - ベンゼン、  
4 - クロロ - 2 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 5 - [ [ 2 - ( 2 , 6 - ジメチル - 4  
- フェノキシフェノキシ ) エチル ] チオ ] - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン、  
4 - クロロ - 2 - ( 2 - クロロ - 2 - メチルプロピル ) - 5 - [ ( 6 - ヨード - 3 - ピ

10

20

30

40

50

リジニル)メトキシ] - 3 (2H) - ピリダジノン、  
 4 - クロロ - 5 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル)メトキシ] - 2 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 3 (2H) - ピリダジノン、  
 バチルス - スリンジエンシス (*Bacillus thuringiensis*) EG - 2348 株、  
 [2 - ベンゾイル - 1 - (1, 1 - ジメチルエチル) - ヒドラジノ安息香酸、  
 酪酸 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - オキソ - 1 - オキサスピロ [4.5] デカ - 3 - エン - 4 - イル  
 [3 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル)メチル] - 2 - チアゾリジニリデン] - シンナミド、  
 ジヒドロ - 2 - (ニトロメチレン) - 2H - 1, 3 - チアジン - 3 (4H) - カルボキシアリデヒド、  
 [2 - [[1, 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 1 - (フェニルメチル) - 4 - ピリダジニル]オキシ]エチル]カルバミン酸エチル、  
 N - (3, 4, 4 - トリフルオロ - 1 - オキソ - 3 - ブテニル) - グリシン、  
 N - (4 - クロロフェニル) - 3 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 4 - フェニル - 1H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド、  
 N - [(2 - クロロ - 5 - チアゾリル)メチル] - N' - メチル - N'' - ニトロ - グアニジン、  
 N - メチル - N' - (1 - メチル - 2 - プロペニル) - 1, 2 - ヒドラジンジカルボチオアミド、  
 N - メチル - N' - 2 - プロペニル - 1, 2 - ヒドラジンジカルボチオアミド、  
 [2 - (ジプロピルアミノ) - 2 - オキソエチル] - エチルホスホルアミドチオ酸 O, O - ジエチル。

# 【0190】

除草剤、肥料および成長調節剤などの他の既知活性化合物と混合することも可能である。

# 【0191】

殺虫剤として使用する際、本発明の活性化合物は、さらに、それらの市販調合物の状態で存在しうり、また、相乗物質との混合物として、これらの調合物から調製された使用形態で存在しうる。相乗物質とは、本発明の活性化合物の作用を増大させる化合物であるが、添加される相乗物質自体が活性である必要はない。

# 【0192】

市販の調合物から調製された使用形態の活性化合物の含量は、広い範囲で変化させることができる。前記使用形態の活性化合物の濃度は、活性化合物 0.0000001 重量% から 95 重量%、好ましくは、0.0001 重量% と 1 重量% の間でありうる。

# 【0193】

本化合物は、その使用形態に適する慣用の方法で使用される。

# 【0194】

衛生有害生物および貯蔵製品の有害生物に対して使用される際、本活性化合物は、木材およびクレーに対する卓越した残留効果、ならびに石灰処理基板上のアルカリに対する良好な安定性によって特徴付けられる。

# 【0195】

すでに上で述べたように、本発明に従ってすべての植物および植物の部分进行处理することができる。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または交配もしくはプロトプラスト融合などの通常の生物学的繁殖によって得られるもの、およびそれらの部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、適する場合には通常法との併用で、遺伝子工学によって得られるトランスジェニック植物および植物栽培品種 (*Genetically Modified Organisms*) ならびにそれらの部分が処理される。用語「部分」または「植物の部分」は、上で説明した。

10

20

30

40

50

## 【 0 1 9 6 】

特に好ましくは、前記植物栽培品種の植物（各場合、市販されているまたは使用されている）は、本発明に従って処理される。

## 【 0 1 9 7 】

植物種または植物栽培品種、それらの所在地および成長条件（土壌、天候、生育期、食物）によっては、本発明による処理によって超加成（「相乗」）作用が生じることもある。従って、例えば、本発明に従って使用される物質および組成物の塗布率低減および／または活性領域の拡大および／または活性の増大、良好な植物成長、高温または低温に対する耐性増強、早魃に対するまたは水もしくは土壌の塩分に対する耐性増強、開花機能向上、より容易な収穫、成熟促進、より高い収穫量、収穫物のより良好な品質および／またはより高い栄養価、収穫物のより良好な貯蔵安定性および／または加工性が可能であり、これは、実際に予想した効果を超えている。

10

## 【 0 1 9 8 】

本発明に従って処理することができる好ましいトランスジェニック植物または植物栽培変種（すなわち、遺伝子工学によって得られたもの）は、遺伝学的修飾においてこれらの植物に特に有利で有用な特性（「形質」）を付与する遺伝物質を受けたすべての植物を包含する。こうした特性の例は、より良好な植物成長、高温または低温に対する耐性増強、早魃に対するまたは水もしくは土壌の塩分に対する耐性増強、開花機能向上、より容易な収穫、成熟促進、より高い収穫率、種格物のより良好な品質および／またはより高い栄養価、より良好な貯蔵安定性および／または加工性である。こうした特性のさらに、また特に重要視される例は、昆虫、ダニ類、植物寄生病原性真菌、細菌および／またはウイルスなどの動物および有害微生物に対するさらに良好な植物防御であり、ならびに一定の除草活性化化合物に対する植物の耐性増強でもある。トランスジェニック植物の例には、穀類（小麦、米）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、ナタネなどの重要な農作物植物、およびまた果実植物（果実リンゴ、ナシ、柑橘類およびブドウのつるを伴う）を挙げることができ、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿およびナタネは、特に重要視される。植物において生成される毒による、特に、バシラス・スリンジエンシスからの遺伝物質（例えば、遺伝子 *Cry I A (a)*、*Cry I A (b)*、*Cry I A (c)*、*Cry I I A*、*Cry I I I A*、*Cry I I I B 2*、*Cry 9 c*、*Cry 2 A b*、*Cry 3 B b* および *Cry I F* ならびにそれらの組み合わせによる）によって生成される毒による昆虫に対する植物の防御増強は、特に重要視される形質である（以後、「*B t* 植物」と呼ぶ）。一定の除草活性化化合物、例えば、イミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサートまたはホスフィノトリシン（例えば、「*P A T*」遺伝子）に対する植物の耐性増強は、さらに特に重要視される形質である。トランスジェニック植物では、該望ましい形質を付与する遺伝子が、互いに組み合わさった状態で存在することもありうる。「*B t* 植物」の例には、商品名 *Y I E L D G A R D*（登録商標）（例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、*K n o c k O u t*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*S a t r L i n k*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、*B o l l g a r d*（登録商標）（綿）、*N u c o t n*（登録商標）（綿）および *N e w L e a f*（登録商標）（ジャガイモ）で販売されているトウモロコシ変種、綿変種、大豆変種およびジャガイモ変種を挙げることができる。除草薬耐性植物の例には、商品名 *R o u n d u p R e a d y*（登録商標）（グリホサートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、*L i b e r t y L i n k*（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ）、*I M I*（登録商標）（イミダゾリノンに対する耐性）および *S T S*（登録商標）（スルホニル尿素に対する耐性、例えば、トウモロコシ）で販売されているトウモロコシ変種、綿変種および大豆変種を挙げることができる。除草薬耐性植物（除草薬耐性のための通常の方法で繁殖させた植物）には、商品名 *C l e a r f i e l d*（登録商標）（例えば、トウモロコシ）で販売されている変種を挙げることができる。勿論、これらの言明は、これらを有する植物栽培品種、または将来開発されるおよび／または市販される、さらに開発された遺伝形質を有する植物栽培変種にも適用される。

20

30

40

50

## 【0199】

列挙した植物は、本発明に従って、特に有利な方法で、本発明の一般式(I)の化合物または活性化化合物混合物を使用して処理することができる。本活性化化合物または混合物に好ましい上述の範囲は、これらの植物の処理にもあてあまる。本文中で特に言及している化合物または混合物での植物の処理は、特に重要視される。

## 【0200】

本発明の活性化化合物は、植物の有害生物、衛生有害生物および貯蔵製品有害生物に対してばかりでなく、獣医薬分野におけるマダニ類、ヒメダニ類、カイセンダニ類、ハダニ類、ハエ類(咬むタイプおよび舐めるタイプ)、寄生バエの幼虫、シラミ、ケジラミ、バジラミおよびノミなどの動物寄生虫(外部寄生虫)に対しても作用する。これらの寄生虫は、以下を含む。

10

## 【0201】

シラミ目(Anoplurida)の種類から、例えば、ブタジラミ属種(Haematopinus spp.)、ケモノホソジラミ属種(Linognathus spp.)、シラミ属種(Pediculus spp.)、ケジラミ属種(Phthirus spp.)およびソレノポテス属種(Solenopotes spp.)。

## 【0202】

ハジラミ目(Mallophagida)ならびにその亜目アンブリセリナ(Amblycerina)およびイスクノセリナ(Iscnocerina)の種類から、例えば、ケモノタンカクハジラミ属種(Trimenopon spp.)、タンカクハジラミ属種(Menopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ボビコーラ属種(Bovicola spp.)、ウエルネッキエラ属種(Wernickeiella spp.)、レピケノトロン属種(Lepikenotron spp.)、ダマリニア属種(Damalinia spp.)、ケモノハジラミ属種(Trichodectes spp.)およびフェリコラ属種(Felicola spp.)。

20

## 【0203】

双翅目(Diptera)ならびにその亜目糸角類および単角類の種類から、例えば、ヤブカ属種(Adeds spp.)、ハマダラカ属種(Anopheles spp.)、イエカ属種(Culex spp.)、ブユ属種(Simulium spp.)、ユーシムリウム属種(Eusimulium spp.)、サンチョウバエ属種(Phlebotomus spp.)、ルツオミヤ属種(Lutzomyia spp.)、サシバエ属種(Culicoides spp.)、メクラアブ属種(Chrysops spp.)、ヒボミトラ属種(Hybomitra spp.)、キイロアブ属種(Atylotus spp.)、アブ属種(Tabanus spp.)、ゴマアブ属種(Haematopota spp.)、フィリポミア属種(Philipomyia spp.)、ミツバチシラミバエ属種(Braula spp.)、イエバエ属種(Musca spp.)、ヒドロテア属種(Hydrotaea spp.)、サシバエ属種(Stomoxys spp.)、ヘマトビア属種(Haematobia spp.)、モレリア属種(Morellia spp.)、ヒメイエバエ属種(Fannia spp.)、ツェツェバエ属種(Glossina spp.)、オオクロバエ属種(Calliphora spp.)、キンバエ属種(Lucilia spp.)、オビキンバエ属種(Chrysomyia spp.)、ヴォールファールトクニバエ属種(Wohlfahrtia spp.)、肉バエ属種(Sarcophaga spp.)、ヒツジバエ属種(Oestrus spp.)、ヒフバエ属種(Hypoderma spp.)、ウマバエ属種(Gasterophilus spp.)、シラミバエ属種(Hippobosca spp.)、リポプテナ属種(Lipoptena spp.)およびヒツジシラミバエ属種(Melophagus spp.)。

30

40

## 【0204】

ノミ目(Siphonapterida)の種類から、例えば、ヒトノミ属種(Pul

50

ex spp. )、イヌノミ属種 (Cetenocephalides spp. )、ケ  
オブスネズミノミ属種 (Xenopsylla spp. )、およびナガノミ属種 (Ce  
ratophyllus spp. )。

#### 【0205】

異翅目 (Heteropterida) の種類から、例えば、トコジラミ属種 (Cim  
ex spp. )、サシガメ属種 (Triatoma spp. )、ドロニウス属種 (R  
hodnius spp. )、およびパンストロギルス属種 (Panstrogylus  
spp. )。

#### 【0206】

ゴキブリ (Blattarida) 目から、例えば、トウキョウゴキブリ (Blatt  
a orientalis)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americ  
ana)、チャバネ・ゴキブリ (Blattella germanica)、およびス  
ペラ属種 (Spellla spp. )。

#### 【0207】

ダニ目 (Acaria) の下位分類 (コナダニ科 (Acarida) ) ならびに後 (M  
eta - ) および中気門亜目 (Mesostigmata) の種類から、例えば、ナガヒ  
メダニ属種 (Argas spp. )、カズキダニ属種 (Ornithodoros s  
pp. )、オトビウス属種 (Otobius spp. )、マダニ属種 (Ixodes  
spp. )、キララマダニ属種 (Amblyomma spp. )、ウシマダニ属種 (B  
oophilus spp. )、カクマダニ属種 (Dermacentor spp. )  
、チマダニ属種 (Haemaphysalis spp. )、イボマダニ属種 (Hyal  
omma spp. )、コイタマダニ属種 (Rhipicephalus spp. )、  
デルマニッスス属種 (Dermanyssus spp. )、方形条虫属種 (Raill  
ietia spp. )、ハイダニ属種 (Pneumonyssus spp. )、ス  
テルノストーマ種 (Sternostoma spp. ) およびヘギイタダニ種 (Var  
roa spp. )。

#### 【0208】

アクチネジダ (Actinedida) (前気門類 (Prostigmata) ) およ  
びカイチュウ目 (Ascaridida) (無気門亜目 (Astigmata) ) の種類  
から、例えば、アカラピス種 (Acarapis spp. )、ツメダニ種 (Cheyl  
etiella spp. )、オルニトチェイレティア種 (Ornithocheyle  
tia spp. )、ミオビア種 (Myobia spp. )、ヒツジツメダニ属種 (P  
sorergates spp. )、ニキビダニ属種 (Demodex spp. )、ツ  
ツガムシ属種 (Trombicula spp. )、リストロフォルス種 (Listro  
phorus spp. )、コナダニ属種 (Acarus spp. )、チロファグス属  
種 (Tyrophagus spp. )、ゴミコナダニ種 (Caloglyphus s  
pp. )、ヒポデクテス種 (Hypodectes spp. )、プテロリクス種 (Pt  
erolichus spp. )、キュウセンヒゼンダニ属種 (Psoroptes s  
pp. )、シヨクヒヒゼンダニ属種 (Chorioptes spp. )、ミミヒゼンダ  
ニ属種 (Otodectes spp. )、サルコプテス属種 (Sarcoptes s  
pp. )、シヨウヒゼンダニ属種 (Notoedres spp. )、クネミドコプテス  
属種 (Knemidokoptes spp. )、シトジテス種 (Cytodites  
spp. )、およびラミノシオプテス種 (Laminosioptes spp. )。

#### 【0209】

それらは、例えばアムブリオンマ - ヘブレウム (Amblyomma - hebreum  
) などのダニの発育段階に対して、および例えばヒツジキンバエ (Lucilia cu  
prina) などの寄生バエに対して、および例えばネコノミ (Ctenocephal  
ides felis) などのノミに対して卓越した活性を例えば有する。

#### 【0210】

本発明の式 (I) の活性化合物は、例えば、畜牛、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、

10

20

30

40

50

ラクダ、水牛、ウサギ、ニワトリ、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウおよびハチなどの農産家畜、ならびに例えば、イヌ、ネコ、かごの鳥および水槽の魚などの他のペット、ならびにまた、例えば、ハムスター、モルモット、ラットおよびマウスなどのいわゆる試験動物に寄生する節足動物の防除にも適する。これら節足動物を防除することによって、死亡および生産性低下（肉、ミルク、ウール、皮、卵、蜂蜜などにについて）の事例は、減少されるはずであるので、本発明の活性化合物の使用によってさらに経済的で容易な畜産が可能である。

#### 【0211】

本発明の活性化合物は、獣医学分野において、例えば、錠剤、カプセル、水薬、頓服水剤、顆粒、ペースト、ボラス、それらのフィードスルー法および坐薬の形態での経腸投与による；例えば、注射（筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射およびこれらに類するもの）、移植によるものなどの非経口投与による；経鼻投与による；例えば、浸漬または沐浴、吹き付け、浴びせかけおよびスポット塗布、洗浄およびパウダリングの形態での皮膚使用による；ならびにまた、首輪、耳標、尾標、四肢バンド、端綱、標識装置およびこれらに類するものなどの本活性化合物を含む成形品を利用する、既知の方法で使用される。

10

#### 【0212】

畜牛、家禽、ペットおよびこれらに類するものに試用する際、本発明の式（I）の活性化合物は、本発明の活性化合物を1重量%から80重量%の量で含む調合物（例えば、粉末、エマルジョン、易流動性組成物）として、直接または100倍から10000倍希釈した後、使用することができ、またはケミカルバスとして使用することができる。

20

#### 【0213】

本発明の化合物は、工業材料を破壊する昆虫に対して強い殺虫作用を有することがさらに判明した。

#### 【0214】

例として、また、好ましいものとして以下の昆虫を挙げることができる（しかし、限定ではない）：

甲虫類：

ヒロトルペス・バジュラス (*Hylotrupes bajulus*)、クロロフォルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・パンクタタム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロサム (*Xestrobium rufovillosum*)、プチリヌス・ペクチコルニス (*Ptilinus pecticornis*)、デンドロブリウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、プリオビウム・カルピニ (*Priobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、リクタス・プランドリシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクタス・ブベスセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクオル (*Trogoxylon aequale*)、ミンテス・ルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キクイムシ属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンズ (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルネウス (*Heterobostrychus burunneus*)、シノキシロン種 (*Sinoxylon spec.*)、チビタケナガシンクイ (*Dinoderus minutus*) など。

30

40

#### 【0215】

膜翅目 (*Hymenoptera*)：

コルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas*)

50

t a i g n u s )、ウロセルス・アウグル ( U r o c e r u s a u g u r ) など。

【 0 2 1 6 】

シロアリ：

カロテルメス・フラヴィコリス ( K a l o t e r m e s f l a v i c o l l i s )、  
クリプトテルメス・ブレビス ( C r y p t o t e r m e s b r e v i s )、ヘテロテル  
メス・インジコラ ( H e t e r o t e r m e s i n d i c o l a )、レチクリテルメス  
・フラビペス ( R e t i c u l i t e r m e s f l a v i p e s )、レチクリテルメス  
・サントネンシス ( R e t i c u l i t e r m e s s a n t o n e n s i s )、レチク  
リテルメス・ルシフガス ( R e t i c u l i t e r m e s l u c i f u g u s )、ムカ  
シシロアリ ( M a s t o t e r m e s d a r w i n i e n s i s )、ネバダオオシロア  
リ ( Z o o t e r m o p s i s n e v a d e n s i s )、イエシロアリ ( C o p t o t  
e r m e s f o r m o s a n u s ) など。

10

【 0 2 1 7 】

シミ：

レピスマ・サッカリナ ( L e p i s m a s a c c a r i n a ) など。

【 0 2 1 8 】

本件での工業材料とは、好ましくはプラスチック、接着剤、サイズ剤、紙および厚紙、  
革、木材および木材加工製品、ならびにコーティング組成物などの非生体材料とご理解いた  
だきたい。

【 0 2 1 9 】

20

木材および木材加工製品は、保護しなければならない材料、特に好ましくは、昆虫がた  
かることから保護しなければならない材料である。

【 0 2 2 0 】

本発明の薬剤またはそれらを含む混合物によって保護することができる木材および木材  
加工製品は、例えば、

建築材、木製の梁、鉄道枕木、橋部材、船の栈橋、木製の乗物、箱、パレット、コンテ  
ナ、電信柱、木製の羽目板、木製の窓枠およびドア、合板、ボール紙、建具、または家屋  
建築もしくは建築用建具に相当一般的に使用されている木製製品  
を意味するものとご理解いただきたい。

【 0 2 2 1 】

30

本発明の活性化合物は、濃縮物の形態、または粉末、顆粒、溶液、懸濁液、エマルジョ  
ンもしくはペーストなどの一般慣用調合物の形態などで使用することができる。

【 0 2 2 2 】

上述の調合物は、例えば、本発明の活性化合物を、少なくとも一つの溶媒もしくは希釈  
剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤もしくは固定剤、撥水剤、適する場合には乾燥  
剤およびUV安定剤、ならびに適する場合には染料および顔料、ならびにまた他の加工助  
剤と混合することによる、それ自体既知の方法で調製することができる。

【 0 2 2 3 】

木材および木材由来の材木製品の保護に使用される殺虫組成物または濃縮物は、本発明  
の活性化合物を 0 . 0 0 0 1 重量% から 9 5 重量%、特に 0 . 0 0 1 重量% から 6 0 重量  
% の濃度で含む。

40

【 0 2 2 4 】

使用される組成物の量または濃度は、昆虫の性質および発生ならびに培地に依存する。  
使用される最適量は、一連の試験によってそれぞれの場合における使用について決定す  
ることができる。しかし、一般に、保護すべき材料を基準にして 0 . 0 0 0 1 重量% から  
2 0 重量%、好ましくは 0 . 0 0 1 重量% から 1 0 重量% の活性化合物を使用すれば十分  
である。

【 0 2 2 5 】

使用される溶媒および／または希釈剤は、有機化学溶媒または溶媒混合物、および／ま  
たは低揮発度の油性もしくは油様有機化学溶媒または溶媒混合物、および／または極性有

50



機化学溶媒または溶媒混合物、および／または水、および適する場合には乳化剤および／または湿潤剤である。

【0226】

好ましく使用される有機化学溶媒は、35より上の気化指数および30より高い、好ましくは45より高い引火点を有する油性または油様溶媒である。低揮発度の油性または油様水不溶性溶媒などとして使用される物質は、適切な鉱物油もしくはそれらの芳香族性留分、または鉱物油、好ましくはホワイトスピリット、石油および／またはアルキルベンゼン、を含有する溶媒混合物である。

【0227】

有利には、170 から220 の沸点範囲を有する鉱物油、170 から220 の沸点範囲を有するホワイトスピリット、250 から350 の沸点範囲を有するスピンドル油、および160 から280 の沸点範囲を有する芳香族化合物、テルピン油およびこれらに類するものが使用される。

10

【0228】

好ましい実施形態では、180 から210 の沸点範囲を有する液体脂肪族炭化水素または180 から220 の沸点範囲を有する芳香族炭化水素と脂肪族炭化水素の高沸点混合物および／またはスピンドル油および／またはモノクロロナフタレン、好ましくはモノクロロナフタレンが使用される。

【0229】

35より上の気化指数および30より高い、好ましくは45より高い引火点を有する低揮発度の油性または油様溶媒の代わりに、高または中揮発度の有機化学溶媒を一部使用することがことができるが、但し、その溶媒混合物が、同様に、35より上の気化指数および30より高い、好ましくは45より高い引火点を有すること、ならびに殺虫薬／殺真菌薬混合物が、この溶媒混合物に可溶性であるか乳化性であることを条件とする。

20

【0230】

好ましい実施形態によると、一部の有機化学溶媒もしくは溶媒混合物の代わりに、脂肪族極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物が使用される。例えば、グリコールエーテル、エステルまたはこれらに類するものなどのヒドロキシル基および／またはエステル基および／またはエーテル基を有する脂肪族有機化学溶媒が、好ましくは使用される。

【0231】

本発明に関連して使用される有機化学結合剤は、それ自体既知である合成樹脂および／または結合乾性油であり、水で希釈可能であり、および／または使用される有機化学溶媒に可溶性もしくは分散性または乳化性であり、特に、アクリル酸樹脂、ビニル樹脂（例えば、ポリ酢酸ビニル）、ポリエステル樹脂、重縮合もしくは重付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂もしくは変性アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂（インデン-クマロン樹脂など）、シリコーン樹脂、乾性植物油、および／または乾性油から成るか、それらを含む結合剤、および／または天然および／または合成樹脂に基づく物理的に乾燥させた結合剤である。

30

【0232】

結合剤として使用される合成樹脂は、エマルジョン、分散液または溶液の形態で使うことができる。ビチューメンまたは瀝青質も10重量%以下の量で結合剤として使うことができる。それ自体既知である染料、顔料、撥水剤、臭気修正剤および抑制剤または防食剤ならびにこれらに類するものを追加的に使うことができる。

40

【0233】

本発明によると、組成物または濃縮物が、有機化学結合剤として、少なくとも一つのアルキド樹脂もしくは変性アルキド樹脂および／または乾性植物油を含むことは、好ましい。45重量%より多い、好ましくは50重量%から68重量%の油含有率を有するアルキド樹脂が、本発明に従って好ましくは使用される。

【0234】

上述のすべてまたは一部の結合剤の代わりに、固定剤（混合物）または可塑剤（混合物

50

）を使用することができる。これらの添加剤は、活性化合物の蒸発および結晶化または沈殿を防止するためのものである。これらは、（使用される結合剤 100%を基準にして）0.01%から30%の結合剤の代わりに使用することができる。

【0235】

可塑剤は、フタル酸ジブチル、フタル酸ジオクチルまたはフタル酸ベンジルブチルなどのフタル酸エステル、リン酸トリブチルなどのリン酸エステル、アジピン酸ジ-（2-エチルヘキシル）などのアジピン酸エステル、ステアリン酸ブチルまたはステアリン酸アミルなどのステアリン酸エステル、オレイン酸ブチルなどのオレイン酸エステル、グリセロールエーテルまたは高分子量グリコールエーテル、グリセロールエステルおよびp-トルエンスルホン酸エステルの化学種から作り出される。

10

【0236】

固定剤は、例えば、ビニルメチルエーテルなどのポリビニルアルキルエーテル、またはベンゾフェノンもしくはエチレンベンゾフェノンなどのケトンに化学的に基づく。

【0237】

特に、水、適する場合には一つ以上の上述の有機化学溶媒または希釈剤、乳化剤および分散剤との混合物としての水も、可能な溶媒または希釈剤である。

【0238】

大きな工業規模での含浸法、例えば、真空法、二重真空法または加圧法によって、木材の特に有効な保護が達成される。

【0239】

すぐ使用できる組成物は、適する場合には他の殺虫薬、およびまた適する場合には一つ以上の殺真菌薬を含むことができる。

20

【0240】

可能な追加混合の相手は、好ましくは、国際公開公報第94/29268号に挙げられている殺虫薬および殺真菌薬である。この文献に挙げられている化合物は、本出願の明確な成分である。

【0241】

特に好ましい混合の相手には、クロルピリホス、ホキシム、シラフルオフィン、アルファメトリン、シフルトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、ペルメトリン、イミダクロピリド、NI-25、フルフェノキシ尿素、ヘキサフルムロン、トランスフルスリン、チアクロブリド、メトキシフェノジドおよびトリフルムロンなどの殺虫薬、ならびにまた、エポキシコナゾール、ヘキサコナゾール、アザコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、シブロコナゾール、メトコナゾール、イマザリル、ジクロルフルアニド、トリルフルアニド、カルバミン酸3-ヨード-2-プロピニル-ブチル、N-オクチル-イソチアゾリン-3-オンおよび4,5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンなどの殺真菌薬を挙げることができる。

30

【0242】

同時に、本発明の化合物は、船体、スクリーン、ネット、建築物、係船システムおよび信号システムなどの塩水または淡水と接触する物を汚損から保護するために使用することができる。

40

【0243】

カンザシゴカイ（*Serpulidae*）などの固着貧毛綱（*Oligochaeta*）による汚損、および様々なエボシガイ類（*Lepas*）およびミョウガガイ類（*Scalpellum*）の種などのレダモルファ（*Ledamorph*）群（エボシガイ）からの貝殻および種による汚損、またはフジツボ属（*Balanus*）種もしくはカメノテ（*Pollicipes*）種などのフジツボ類（*Balanomorph*）群（フジツボ）からの種による汚損は、船の摩擦抵抗を増大させ、結果として、より高いエネルギー消費およびさらに頻繁な乾ドッグでの滞在により運転コストを著しく上昇させる。

【0244】

藻類、例えば、シオミドロ種（*Ectocarpus* sp.）およびイギス種（*Ce*

50

ramium sp.) による汚損に加えて、総称蔓脚類 (Cirripedia) (蔓脚類甲殻類) に入る固着切甲類 (Entomostraca) 群による汚損は、特に重要である。

#### 【0245】

驚くべきことに、本発明の化合物は、単独で、または他の活性化合物との併用で、顕著な防汚作用を有することが今般判明した。

#### 【0246】

本発明の化合物を単独で使用するによって、または他の活性化合物と併用することによって、例えば、硫化ビス(トリアルキルスズ)、ラウリン酸トリ-n-ブチルスズ、塩化トリ-n-ブチルスズ、酸化銅(I)、塩化トリエチルスズ、トリ-n-ブチル(2-フェニル-4-クロロフェノキシ)スズ、酸化トリブチルスズ、二硫化モリブデン、酸化アンチモン、高分子量チタン酸ブチル、フェニル(ビスピリジン)-ビスマスクロリド、フッ化トリ-n-ブチルスズ、エチレンビスチオカルバミン酸マンガン、ジメチルジチオカルバミン酸亜鉛、エチレンビスチオカルバミン酸亜鉛、2-ピリジンチオール1-オキシドの亜鉛塩および銅塩、エチレン-ビスチオカルバミン酸ビスジメチルジチカルバモイル亜鉛、酸化亜鉛、エチレン-ビスジカルバミン酸銅(I)、チオシアン酸銅、ナフテン酸銅およびハロゲン化トリブチルスズなどの重金属の使用を不要にすることができ、またはこれらの化合物の濃度を実質的に低下させることができる。

#### 【0247】

適する場合には、すぐ使用できる防汚塗料は、他の活性化合物、好ましくは殺藻薬、殺真菌薬、除草薬、軟体動物駆除剤、または他の防汚活性化合物をさらに含むことができる。

#### 【0248】

本発明の防汚組成物との併用に好ましく適する成分は、以下のとおりである。

#### 【0249】

殺藻薬：

2-t-ブチルアミノ-4-シクロプロピルアミノ-6-メチルチオ-1,3,5-トリアジン、ジクロロフェン、ジウロン、エンドサール、フェンチンアセテート、イソプロツロン、メタベンズチアズロン、オキシフルオルフェン、キノクラミンおよびテルブトリンなど；

殺真菌薬：

ベンゾ[b]チオフェンカルボン酸シクロヘキシルアミドS, S-ジオキシド、ジクロロフルアニド、フルオルホルベット、ブチルカルバミン酸3-ヨード-2-プロピニル、トリルフルアニド、ならびにアナコナゾール、シプロコナゾール、エポキシコナゾール、ヘキサコナゾール、メトコナゾール、プロピコナゾールおよびテブコナゾールなどのアゾールなど；

軟体動物駆除剤：

フェンチンアセテート、メタアルデヒド、メチオカルブ、ニクロサミド、チオジカルブおよびトリメタカルブなど；または

通常の防汚活性化合物：

4,5-ジクロロ-2-オクチル-4-イソチアゾリン-3-オン、ジヨードメチルパラトリルスルホン、2-(N,N-ジメチルチオカルバモイルチオ)-5-ニトロチアジール、2-ピリジンチオール1-オキシドのカリウム、銅、ナトリウムおよび亜鉛塩、ピリジン-トリフェニルボラン、テトラブチルジスタノキサン、2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)-ピリジン、2,4,5,6-テトラクロロイソフタロニトリル、二硫化テトラメチルチウラム、および2,4,6-トリクロロフェニルマレイミドなど。

#### 【0250】

使用される防汚組成物は、本発明の化合物の本発明の活性化合物を0.001重量%から50重量%、特に、0.01重量%から20重量%の濃度で含む。

## 【0251】

さらに、本発明の防汚組成物は、例えば、Ungerer, Chem, Ind. 1985, 37, 730-732およびWilliams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973に記載されているものなどの慣用の成分を含む。

## 【0252】

殺藻活性化合物、殺真菌活性化合物、軟体動物駆除活性化合物および本発明の殺虫活性化合物に加えて、防汚塗料は、特に、結合剤を含む。

## 【0253】

認知されている結合剤の例は、溶媒系中のポリ塩化ビニル、溶媒系中の塩素化ゴム、溶媒系、特に水性系中のアクリル酸樹脂、水性分散系の形態または有機溶媒系の形態での塩化ビニル/酢酸ビニルコポリマー系、ブタジエン/スチレン/アクリロニトリルゴム、アマニ油などの乾性油、タールまたはピチューメンとの組合せで樹脂エステルまたは変性硬化樹脂、アスファルト化合物およびエポキシ化合物、少量の塩素ゴム、塩素化ポリプロピレンおよびビニル樹脂である。

## 【0254】

適する場合には、塗料は、塩水に好ましくは不溶性である無機顔料、有機顔料または着色剤も含む。塗料は、活性化合物の制御放出を可能ならしめるように松やになどの材料をさらに含むことができる。さらに、塗料は、可塑剤、流体学的性質に影響を及ぼす変性剤、および他の通常の成分を含むことができる。本発明の化合物または上述の混合物は、自己研磨防汚系に配合することもできる。

## 【0255】

本発明の活性化合物は、例えば住居、工場のホール、オフィス、車室およびこれらに類するものなどの閉鎖された空間において見出される動物有害生物、特に、昆虫、くも形類およびダニ類の防御にも適する。これらの有害生物を防御するための家庭用殺虫剤製品において、本化合物は、単独で 사용할 ことができ、または他の活性化合物および助剤と併用することができる。本化合物は、感受性および抵抗性の種に対して、およびすべての発育段階に対して有効である。こうした有害生物には、以下のものが挙げられる。

## 【0256】

サソリ類 (Scorpionidea) の種類から、例えば、ブザス・オクチタヌス (Butus occitanus)。

## 【0257】

ダニ目 (Acarina) の種類から、例えば、ナガヒメダニ (Argas persicus)、鳩扁ダニ (Argas reflexus)、ブリオビア種 (Bryobia spp.)、ニワトリダニ (Dermanyssus gallinae)、グリシファグス・ドメスチクス (Glyciphagus domesticus)、オルニトドルス・モウバタ (Ornithodoros moubat)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)、アメリカツツガムシ (Trombicula alfreddugesi)、ニュートロムビクラ・オータムナリス (Neutrombicula autumnalis)、ヤケヒョウダニ (Dermatophagoides pteronyssinus)、およびコナヒョウダニ (Dermatophagoides farinae)。

## 【0258】

真正クモ目 (Araneae) の種類から、例えば、オオツチグモ科 (Aviculariidae)、および真正クモ科 (Araneidae)。

## 【0259】

メクラグモ類 (Opiliones) の種類から、例えば、プセウドスコルピオンズ・シェリファー (Pseudoscorpiones chelifera)、プセウドスコルピオンズ・シェイリジウム (Pseudoscorpiones cheiridium)、およびオピリオンズ・ファランギウム (Opiliones phalangium)。

mu)。

【0260】

等脚目 (Isopoda) の種類から、例えば、オニスカス・アセルス (Oniscus asellus)、およびワラジムシ (Porcellio scaber)。

【0261】

倍脚目 (Diplopoda) の種類から、例えば、ブラニウルス・グットラタス (Blaniulus guttulatus)、およびポリデスミス種 (Polydesmus spp.)。

【0262】

唇脚目 (Chilopoda) の種類から、例えば、ジムカデ属種 (Geophilus spp.)。 10

【0263】

シミ亜目 (Zygenotoma) の種類から、例えば、ヤマトシミ種 (Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サッカリナ (Lepisma saccharina)、およびレピスモデス・インキリヌス (Lepismodes inquilinus)。

【0264】

ゴキブリ目 (Blattaria) の種類から、例えば、トウキョウゴキブリ (Blattella orientalis)、チャバネ・ゴキブリ (Blattella germanica)、オキナワチャバネゴキブリ (Blattella asahinai)、ロイコフアエ・マデラエ (Leucophaea maderae)、パンクロラ種 (Panchlora spp.)、ウツゴキブリ種 (Parcoblatta spp.)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (Periplaneta australasiae)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、トビイロゴキブリ (Periplaneta brunnea)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa)、およびスーベラ・ロンギパルパ (Supella longipalpa)。 20

【0265】

ミズギクカメムシ類 (Saltatoria) の種類から、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (Acheta domesticus)。 30

【0266】

ハサミムシ類 (Dermaptera) の種類から、例えば、ヨーロッパクギヌキハサミムシ (Forficula auricularia)。

【0267】

等翅目 (Isoptera) の種類から、例えば、レイビシロアリ種 (Kaloterмес spp.)、およびヤマトシロアリ種 (Reticulitermes spp.)。

チャタテムシ類 (Psocoptera) の種類から、例えば、レピナタス種 (Lepinatus spp.)、およびコナチャタテ科種 (Liposcelis spp.)。 40

【0268】

鞘翅目 (Coleoptera) の種類から、例えば、アントレヌス種 (Anthrenus spp.)、アタゲヌス種 (Attagenus spp.)、カツオブシムシ種 (Dermestes spp.)、コヒメコクヌスモドキ (Latheticus orizae)、ネクロビア種 (Necrobia spp.)、ヒョウホンムシ種 (Ptinus spp.)、コナナガシンクイ (Rhizopertha dominica)、グラナリアコクゾウムシ (Sitophilus granarius)、ココクゾウ (Sitophilus oryzae)、コクゾウ (Sitophilus zeamais)、およびジンサンシバンムシ (Stegobium paniceum)。

【0269】

双翅目 (Diptera) の種類から、例えば、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、エーデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、ハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.)、オオクロバエ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、アカイエカ (*Culex pipiens*)、キューレックス・タルサーリス (*Culex tarsalis*)、ショウジョウバエ属種 (*Drosophila* spp.)、小イエバエ (*Fannia canicularis*)、イエバエ (*Musca domestica*)、サンショウバエ属種 (*Phlebotomus* spp.)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、ブユ属種 (*Simulium* spp.) サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、およびガガンボ・パルドーサ (*Tipula paludosa*)。

10

## 【0270】

鱗翅目 (Lepidoptera) の種類から、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、ハチミツガ (*Galleria mellonella*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、ティネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、ティネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、およびコイガ (*Tineola bisselliella*)。

20

## 【0271】

ノミ目 (Siphonaptera) の種類から、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、スナノミ (*Tunga penetrans*)、およびケオブスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)。

## 【0272】

膜翅目 (Hymenoptera) の種類から、例えば、カムポノタス・ヘルクレアヌス (*Camponotus herculeanus*)、クロクサアリ (*Lasius fuliginosus*)、トビイロケアリ (*Lasius niger*)、アメイロケアリ (*Lasius umbratus*)、イエヒメアリ属 (*Monomorium* p 30  
*pharaonis*)、パラベスブラ種 (*Paravespula* spp.)、およびテトラモリウム・カエスピタム (*Tetramorium caespitum*)。

## 【0273】

シラミ目 (Anoplura) の種類から、例えば、ヒト頭ジラミ (*Pediculus humanus capitis*)、ヒトキモノジラミ (*Pediculus humanus corporis*)、および恥毛ジラミ (*Phthirus pubis*)

異翅目 (Heteroptera) の種類から、例えば、ネッタイナンキンムシ (*Cimex hemipterus*)、ナンキンムシ (*Cimex lectularius*)、ロドニウス・プロリクス (*Rhodnius prolixus*)、およびトリアトーマ・インフェスタンス (*Triatoma infestans*)。

40

## 【0274】

家庭用殺虫薬の分野において、これらは、単独で使用されるか、またはリン酸エステル、カルバメート、ピレトロイド、成長調節剤などの他の適する活性化合物、もしくは他の既知の種類の殺虫薬からの活性化合物と併用される。

## 【0275】

これらは、エアロゾル、非圧縮スプレー製品、例えば、ポンプ式スプレーおよびアトマイザースプレー、自動煙霧システム、煙霧器、フォーム、ゲル、セルローズまたはポリマー製の蒸発装置用錠剤を使用する蒸発装置製品、液体蒸発装置、ゲルおよび膜型蒸発装置、プロペラ駆動蒸発装置、エネルギー不要または受動蒸発システム、防虫紙、防虫バッグ 50

、および防虫ゲルとして使用され、顆粒または微粉として、塗布用の餌中または餌場内で使用される。

【0276】

本発明の物質の調製および使用を以下の実施例に示す。

【発明を実施するための最良の形態】

【0277】

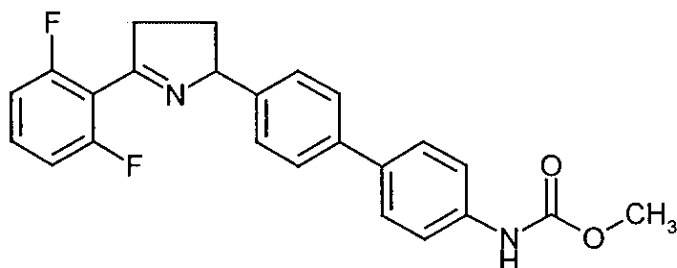
調製例

【実施例1】

【0278】

【化39】

10



5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 2 - [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] - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - ピロール (0.96 g、2.50 mmol) を 10 mL の N, N - ジメチルアセトアミドに溶解する。4 - プロモフェニルカルバミン酸メチル (III - 1) (0.69 g、3.00 mmol)、PdCl<sub>2</sub> [dppf] (0.05 g、0.07 mmol) および 3.75 mL の炭酸ナトリウム溶液 (2 M) を順次添加し、その後、その混合物を 80 °C で 16 時間加熱する。それを室温に冷却して、水 / 酢酸エチルで抽出し、有機相を分離して取り出し、硫酸マグネシウムで乾燥させて、濾過し、減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル 91 : 9 80 : 20、各々、容積 / 容積) によって精製する。

20

【0279】

これによって、0.35 g (理論値の 32%) の 4' - [5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - ピロール - 2 - イル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イルカルバミン酸メチルを得る。

30

【0280】

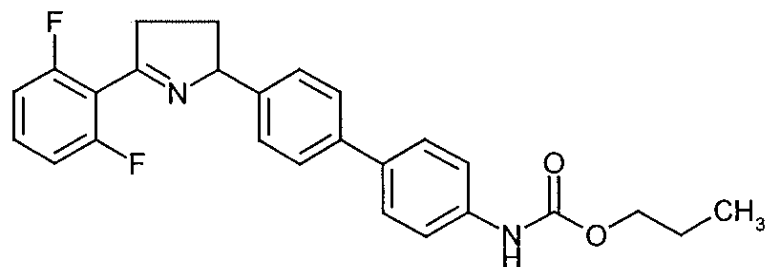
HPLC : log P (pH 2.3) = 2.31 (純度 : 93%)  
log P (pH 7.5) = 3.52

【実施例2】

【0281】

【化40】

40



5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 2 - [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] - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - ピロ

50

ール (0.96 g、2.50 mmol) および 4 - プロモフェニルカルバミン酸 n - プロピル (III - 2) (0.77 g、3.00 mmol) を 10 mL の 1, 2 - ジメトキシエタンに溶解する。PdCl<sub>2</sub> [dppf] (0.05 g、0.07 mmol) および 3.75 mL の炭酸ナトリウム溶液 (2 M) を順次添加し、その後、その混合物を 80 で 16 時間加熱する。それを室温に冷却して、水 / 酢酸エチルで抽出し、有機相を分離して取り出し、硫酸マグネシウムで乾燥させて、濾過し、減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル 20 : 1 6 : 1 2 : 1、各々、容積 / 容積) によって精製する。

【0282】

これによって、0.28 g (理論値の 25%) の 4' - [5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イルカルバミン酸 n - プロピルを得る。

10

【0283】

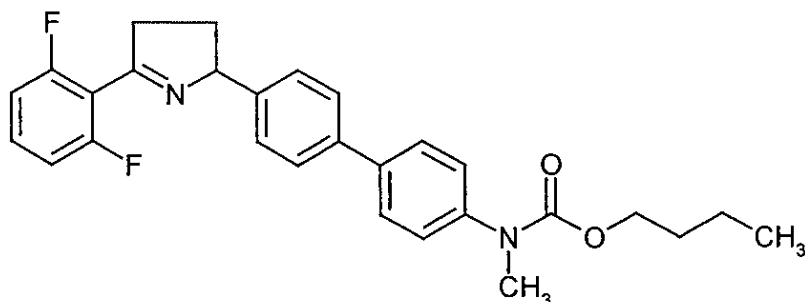
HPLC : log P (pH 2.3) = 3.02 (純度 : 98%)

log P (pH 7.5) = 4.24

【実施例 3】

【0284】

【化 4 1】



20

5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 2 - [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] - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール (0.96 g、2.50 mmol) を 20 mL の N, N - ジメチルアセトアミドに溶解する。4 - プロモフェニル (メチル) カルバミン酸 n - ブチル (III - 3) (0.86 g、3.00 mmol)、PdCl<sub>2</sub> [dppf] (0.05 g、0.07 mmol) および 3.75 mL の炭酸ナトリウム溶液 (2 M) を順次添加し、その後、その混合物を 90 で 16 時間加熱する。それを室温に冷却し、その反応混合物を減圧下で濃縮する。残留物を酢酸エチルに吸収させ、水で洗浄する。有機相を分離して取り出し、硫酸マグネシウムで乾燥させて、濾過し、減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル 10 : 1 6 : 1、各々、容積 / 容積) によって精製する。

30

【0285】

これによって、0.48 g (理論値の 41%) の 4' - [5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イル (メチル) カルバミン酸 n - ブチルを得る。

40

【0286】

HPLC : log P (pH 2.3) = 3.76 (純度 : 98%)

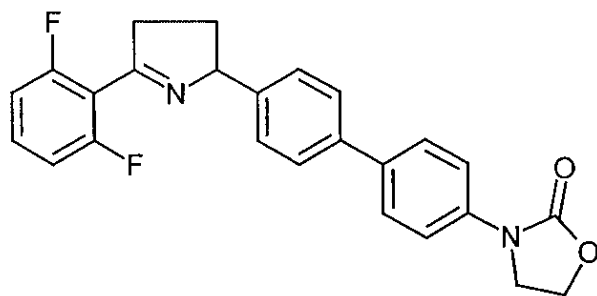
log P (pH 7.5) = 4.92

【実施例 4】

【0287】



## 【化 4 2】



5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - [ 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 ] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール ( 0 . 9 6 g 、 2 . 5 0 m m o l ) を 2 0 m L の N , N - ジメチルアセトアミドに溶解する。3 - ( 4 - ブロモフェニル ) - 1 , 3 - オキサゾリジン - 2 - オン ( I I I - 4 ) ( 0 . 7 3 g 、 3 . 0 0 m m o l ) 、  $PdCl_2 [dppf]$  ( 0 . 0 5 g 、 0 . 0 7 m m o l ) および 3 . 7 5 m L の炭酸ナトリウム溶液 ( 2 M ) を順次添加し、その後、その混合物を 9 0 で 1 6 時間加熱する。それを室温に冷却して、水を添加し、沈殿を吸引濾過して除去する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / アセトン 2 0 : 1 1 0 : 1 、 各々、容積 / 容積 ) によって精製する。

## 【 0 2 8 8 】

これによって、0 . 7 5 g ( 理論値の 6 6 % ) の 3 - { 4 ' - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } - 1 , 3 - オキサゾリジン - 2 - オンを得る。

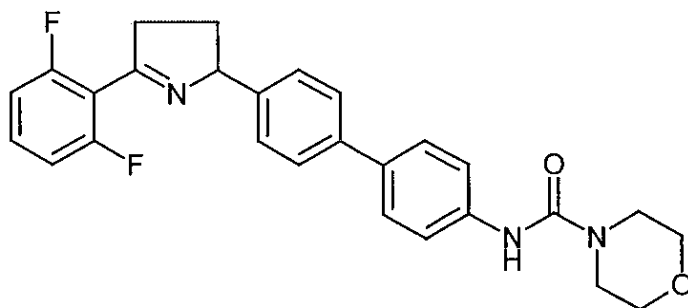
## 【 0 2 8 9 】

HPLC :  $\log P (pH 2.3) = 2.13$  ( 純度 : 9 2 % )  
 $\log P (pH 7.5) = 3.28$

## 【実施例 5】

## 【 0 2 9 0 】

## 【化 4 3】



5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 2 - [ 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 ] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール ( 0 . 9 6 g 、 2 . 5 0 m m o l ) および N - ( 4 - ブロモフェニル ) - 4 - モルホリン - カルボキサミド ( I I I - 5 ) ( 0 . 8 6 g 、 3 . 0 0 m m o l ) を 1 0 m L の 1 , 2 - ジメトキシエタンに溶解する。 $PdCl_2 [dppf]$  ( 0 . 0 5 g 、 0 . 0 7 m m o l ) および 3 . 7 5 m L の炭酸ナトリウム溶液 ( 2 M ) を順次添加し、その後、その混合物を 8 0 で 1 6 時間加熱する。それを室温に冷却して、水 / 酢酸エチルで抽出し、有機相を分離して取り出し、硫酸マグネシウムで乾燥させて、濾過し、減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / 酢酸エチル 2 : 1 1 : 1 、 各々、容積 / 容積 ) によって精製する。

## 【 0 2 9 1 】

これによって、0 . 3 5 g ( 理論値の 3 0 % ) の N - { 4 ' - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフル

オロフェニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イル} - 4 - モルホリンカルボキサミドを得る。

【0292】

HPLC:  $\log P(\text{pH } 2.3) = 1.87$  (純度: 100%)

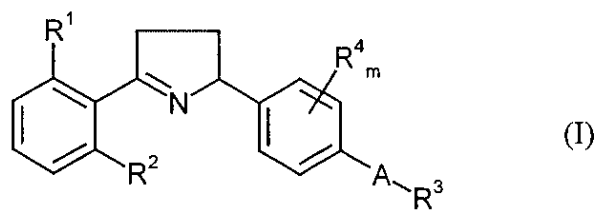
$\log P(\text{pH } 7.5) = 2.96$

【0293】

上記実施例 1 から 5 と類似に、また、それらの一般調製の詳細に従って、次の表に示す式 (I) の化合物を得る。

【0294】

【表 1】



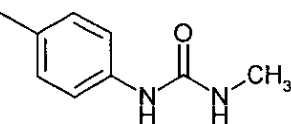
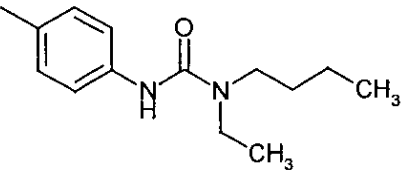
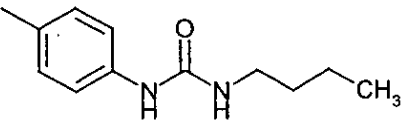
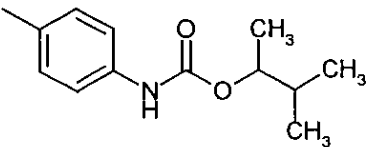
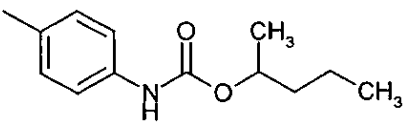
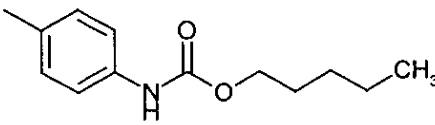
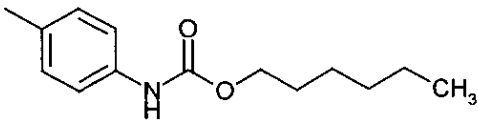
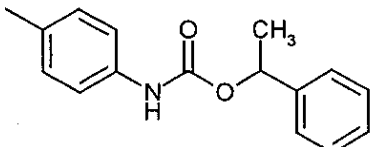
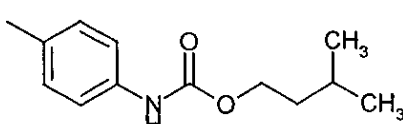
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> <sub>m</sub>	-A-R <sup>3</sup>	log P
6	F	F	—		2.62a) 3.85b)
7	F	F	—		3.00a) 4.19b)
8	F	F	—		3.32a) 4.54b)
9	F	F	—		3.44a) 4.60b)
10	F	F	—		3.88a) 1.68b)
11	F	F	—		2.11a)
12	F	F	—		2.53a) 3.71b)

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> <sub>m</sub>	-A-R <sup>3</sup>	log P
13	F	F	—		1.71 <sup>a)</sup> 2.78 <sup>b)</sup>
14	F	F	—		3.18 <sup>a)</sup> 4.36 <sup>b)</sup>
15	F	F	—		2.48 <sup>a)</sup> 3.47 <sup>b)</sup>
16	F	F	—		3.82 <sup>a)</sup> 4.77 <sup>b)</sup>
17	F	F	—		4.82 <sup>b)</sup>
18	F	F	—		3.87 <sup>a)</sup> 4.89 <sup>b)</sup>
19	F	F	—		4.46 <sup>a)</sup> 5.26 <sup>b)</sup>
20	F	F	—		3.63 <sup>a)</sup>
21	F	F	—		3.72 <sup>a)</sup>

10

20

30

40

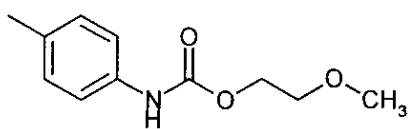
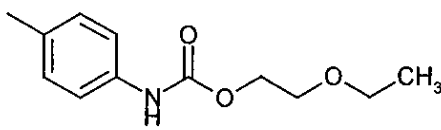
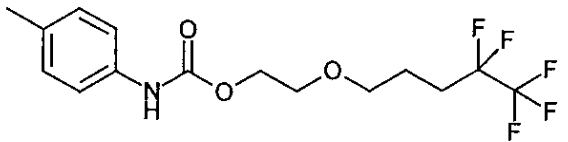
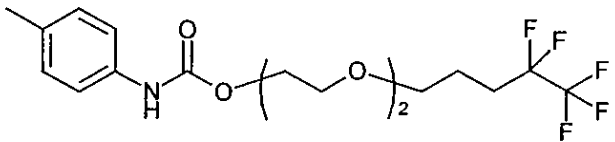
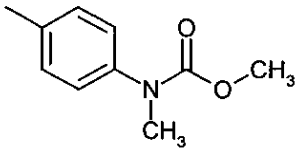
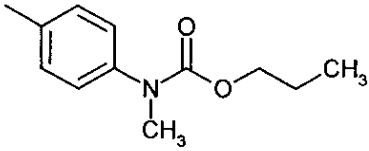
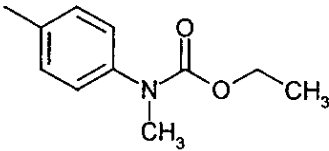
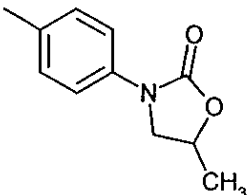
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> <sub>m</sub>	-A-R <sup>3</sup>	log P
22	F	F	—		2.71a) 3.98b)
23	F	F	—		3.76a)
24	F	F	—		3.76a)
25	F	F	—		3.62a) 4.64b)
26	F	F	—		3.01a) 4.10b)
27	F	F	—		3.28a) 4.36b)
28	F	F	—		5.13a) 5.97b)
29	F	F	—		1.74a) 5.52b)
30	F	F	—		1.37a)

10

20

30

40

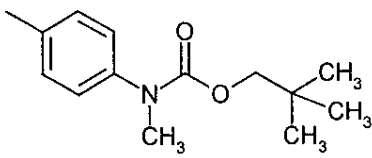
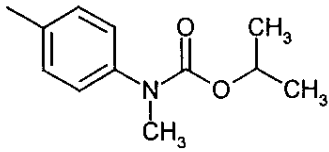
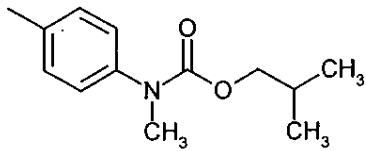
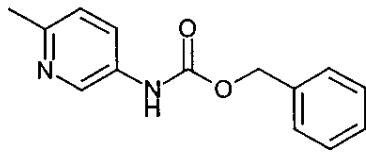
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> <sub>m</sub>	-A-R <sup>3</sup>	log P
31	F	F	—		2.24a) 3.45b)
32	F	F	—		2.52a) 3.75b)
33	F	F	—		3.82a)
34	F	F	—		3.70a) 4.73b)
35	F	F	—		2.58a) 3.79b)
36	F	F	—		3.32a) 4.52b)
37	F	F	—		2.92a) 4.16b)
38	F	F	—		2.40a)

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> <sub>m</sub>	-A-R <sup>3</sup>	log P
39	F	F	—		4.11a) 5.19b)
40	F	F	—		3.30a) 4.50b)
41	F	F	—		3.79a) 4.89b)
42	F	F	—		2.54a) 3.88b)

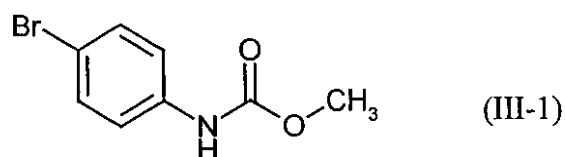
## 【 0 2 9 5 】

式 ( I I I ) の出発原料の調製

( 実施例 ( I I I - 1 ) )

## 【 0 2 9 6 】

## 【 化 4 4 】



トルエン 15 mL 中のイソシアン酸 4 - ブロモフェニル ( 3 . 2 6 g 、 1 6 . 4 6 mmol ) の溶液を室温でメタノール 1 mL およびトルエン 20 mL に一滴ずつ添加し、その混合物を室温でさらに 1 6 時間攪拌する。その反応混合物を減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / 酢酸エチル 2 : 1 、容積 / 容積 ) によって精製する。

## 【 0 2 9 7 】

これによって、3 . 6 5 g ( 理論値の 8 8 % ) の 4 - ブロモフェニルカルバミン酸メチルを得る。

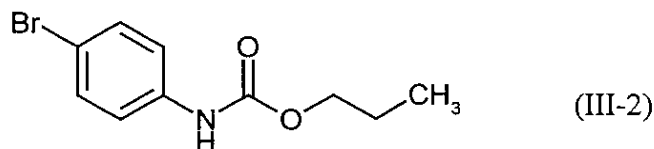
HPLC : log P ( pH 2 . 3 ) = 2 . 2 7 ( 純度 : 9 2 % )

## 【 0 2 9 8 】

( 実施例 ( I I I - 2 ) )

## 【 0 2 9 9 】

## 【化 4 5】



n - プロパノール 1 . 8 5 m L をアルゴン雰囲気下で 1 0 m L のトルエンに導入する。イソシアン酸 4 - ブロモフェニル ( 3 . 2 6 g 、 1 6 . 4 6 m m o l ) を室温で少しずつ添加し、その反応混合物を室温でさらに 1 6 時間攪拌する。その反応混合物を減圧下で濃縮する。その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / 酢酸エチル 2 : 1 、容積 / 容積 ) によって精製する。

10

## 【 0 3 0 0 】

これによって、 4 . 1 3 g ( 理論値の 9 5 % ) の 4 - ブロモフェニルカルバミン酸 n - プロピルを得る。

H P L C : l o g P ( p H 2 . 3 ) = 3 . 1 2 ( 純度 : 9 8 % )

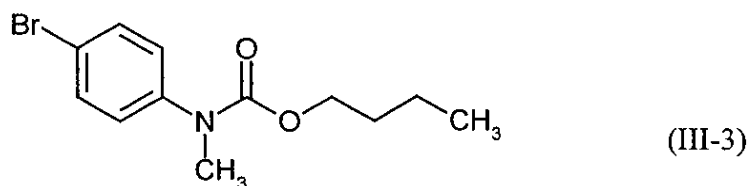
## 【 0 3 0 1 】

( 実施例 ( I I I - 3 ) )

## 【 0 3 0 2 】

## 【化 4 6】

20



N - ( 4 - ブロモフェニル ) - N - メチルアミン ( 1 . 5 0 g 、 8 . 0 6 m m o l ) をアルゴン雰囲気下で 1 5 m L のジクロロメタンに導入し、その後、N , O - ビス ( トリメチルシリル ) - アセトアミド ( 1 . 9 7 g 、 9 . 7 6 m m o l ) を添加し、その混合物を室温で 1 時間攪拌する。その後、それを 0 に冷却し、クロロギ酸ブチル ( 1 . 2 3 m L 、 9 . 6 7 m m o l ) を一滴ずつ添加する。その混合物を室温に温めて、この温度でさらに 1 6 時間攪拌する。それを再び 0 に冷却し、リン酸二水素カリウム / リン酸水素二ナトリウム緩衝液 ( p H 7 ) で反応を停止させて、ジクロロメタンで抽出し、有機相を分離して取り出し、塩化ナトリウム飽和溶液で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過して、減圧下で濃縮する。

30

## 【 0 3 0 3 】

これによって、 1 . 1 3 g ( 理論値の 9 8 % ) の 4 - ブロモフェニル ( メチル ) カルバミン酸 n - ブチルを得る。

H P L C : l o g P ( p H 2 . 3 ) = 3 . 8 8 ( 純度 : 9 6 % )

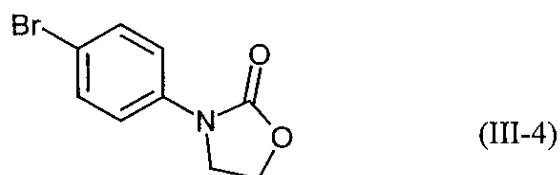
## 【 0 3 0 4 】

( 実施例 ( I I I - 4 ) )

## 【 0 3 0 5 】

## 【化 4 7】

40



イソシアン酸 4 - ブロモフェニル ( 2 . 0 0 g 、 1 0 . 1 0 m m o l ) をアルゴン雰囲気

50



気下で15 mLのジメチルスルホキシドに導入し、その後、ジオキサラン-2-オン(0.89 g、10.10 mmol)およびフッ化セシウム(0.15 g、1.01 mmol)を添加すると、白色の沈殿が生成される。その混合物を140℃、アルゴン下で2時間攪拌する。その反応混合物を冷却して、氷水に注入し、生成された沈殿を吸引濾過して取り出し、乾燥させ、イソプロパノールから再結晶させる。

【0306】

これによって、1.55 g(理論値の61%)の3-(4-ブロモフェニル)-1,3-オキサゾリジン-2-オンを得る。

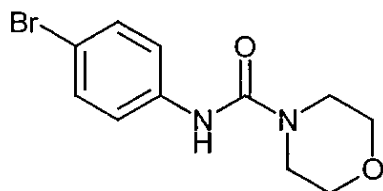
HPLC: log P(pH 2.3) = 2.02(純度: 96%)

【0307】

(実施例(III-5))

【0308】

【化48】



(III-5)

1.96 mLのモルホリンをアルゴン雰囲気下で15 mLのジオキサランに導入する。室温で、イソシアン酸4-ブロモフェニル(2.97 g、15.00 mmol)を少しずつ添加し、その反応混合物を室温でさらに16時間攪拌する。その後、その粗製生成物を吸引濾過して取り出し、シリカゲルクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル 2:1、容積/容積)によって単離する。

【0309】

これによって、3.13 g(理論値の66%)のN-(4-ブロモフェニル)-4-モルホリンカルボキサミドを得る。

HPLC: log P(pH 2.3) = 1.75(純度: 91%)

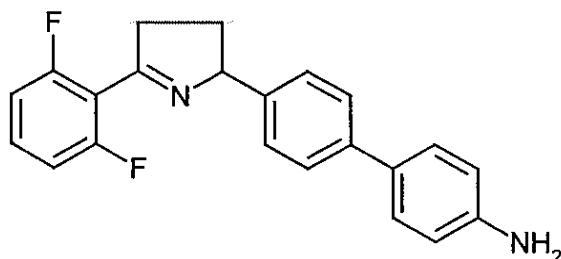
【0310】

式(VII)の出発原料の調製

(実施例(VII-1))

【0311】

【化49】



(VII-1)

4'-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-2-イル]-1,1'-ビフェニル-4-イルカルバミン酸メチル(実施例1)(0.23 g、0.53 mmol)を2 mLのエタノールに溶解する。水酸化カリウム(0.03 g、0.53 mmol)を添加した後、その混合物を16時間還流させながら攪拌する。沈殿を吸引濾過して取り出し、その粗製生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル 2:1、容積/容積)によって精製する。

【0312】

これによって、0.13 g(理論値の69%)の4'-[5-(2,6-ジフルオロフ

10

20

30

40

50

エニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピロール - 2 - イル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イルアミンを得る。

【0313】

HPLC:  $\log P(\text{pH } 2.3) = 1.25$  (純度: 97%)

上の表および調製例に記載の  $\log P$  値は、EEC 通達 79/831 添付書類 V. A 8 に従って、逆相カラム (C18) を使用する HPLC (高速液体クロマトグラフィー) により決定した。温度: 43。

【0314】

pH 2.3 の酸性範囲では、0.1% リン酸水溶液および移動相としてアセトニトリル (アセトニトリル 10% からアセトニトリル 90% の直線傾斜) を使用して、決定を行う 10。対応する結果には、表の中で、「a)」印が付いている。

【0315】

pH 7.5 の中性範囲では、0.01 モルのリン酸緩衝水溶液および移動相としてアセトニトリル (アセトニトリル 10% からアセトニトリル 90% の直線傾斜) を使用して決定を行う。対応する結果には、表の中で、「b)」印が付いている。

【0316】

較正は、既知  $\log P$  値 (2 つの連続するアルカンの間での一次補正を用い、保持時間を基に決定された  $\log P$  値) を有する非分枝鎖アルカン - 2 - オン (炭素原子を 3 ~ 16 個有するもの) を使用して行う。

【0317】

使用例

(実施例 A)

オオタバコガ (*Heliothis virescens*) 試験

溶媒: ジメチルホルムアミド 7 重量部

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル 2 重量部

活性化化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

【0318】

所望の濃度の活性化化合物の調製物に浸漬することによって、大豆苗条 (ダイズ (*Glycine max*)) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、オオタバコガ (*Heliothis virescens*) のイモムシとともに置く。 30

【0319】

望ましい時間が経過した後、殺虫 (単位: %) を判定する。100% は、すべてのイモムシが死んだことを意味し、0% は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

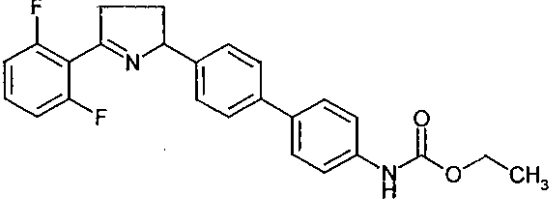
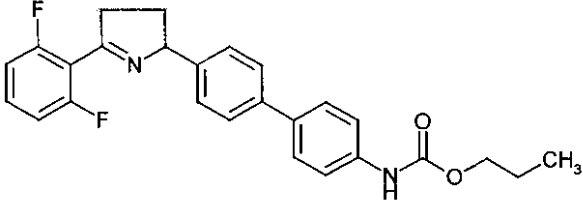
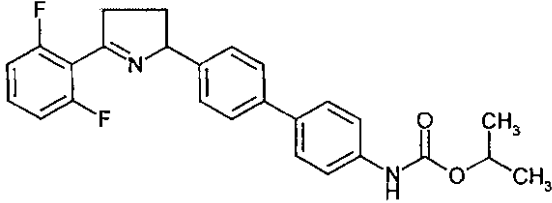
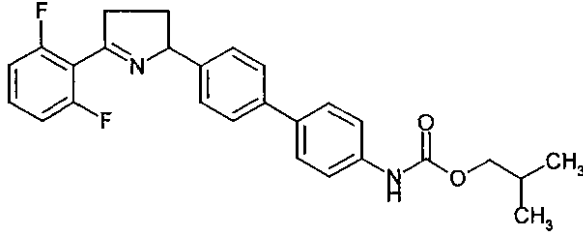
【0320】

この試験において、100 ppm の活性化化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物 2 および 6 ~ 8 は、少なくとも 95% という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表 A から詳細にわかる。

【0321】

【表 2】

表A  
植物を損傷させる昆虫  
オオタバコガ (*Heliothis virescens*) 試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)	
	(6) 100	100	10
	(2) 100	100	20
	(7) 100	100	
	(8) 100	100	30

## 【 0 3 2 2 】

( 実施例 B )

ハイドン ( *Phaedon* ) 幼虫試験

溶媒 : ジメチルホルムアミド 7 重量部

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル 2 重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

## 【 0 3 2 3 】

所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することによって、キャベツの葉 ( *Brassica oleracea* ) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、カラシナにつく甲虫 ( ハイドン・コクレアリア ( *Phaedon cochleariae* ) ) の幼虫とともに置く。

## 【 0 3 2 4 】

望ましい時間が経過した後、殺虫 ( 単位 : % ) を判定する。100 % は、すべての甲虫の幼虫が死んだことを意味し、0 % は、どの甲虫の幼虫も死んでいないことを意味する。

40

50

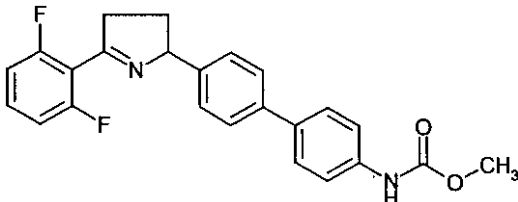
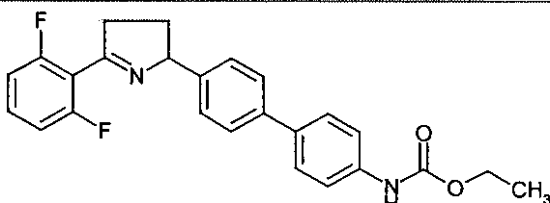
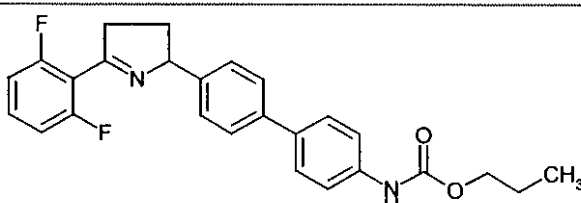
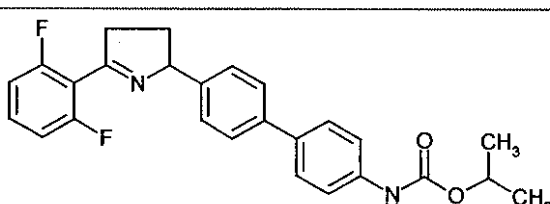
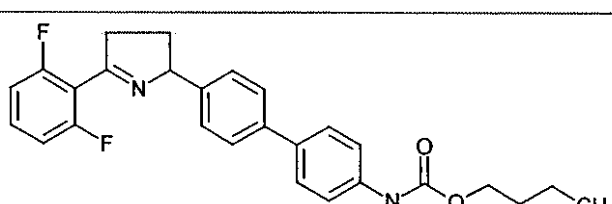
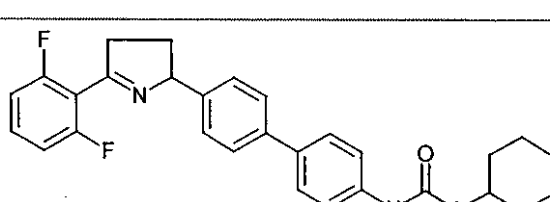
## 【 0 3 2 5 】

この試験において、1 0 0 p p mの活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物 1、2、6、7、1 6、1 8 ~ 2 1、2 4、2 5、2 7、2 9、3 2、3 5、3 7 は、少なくとも 8 5 %という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表 B から詳細にわかる。

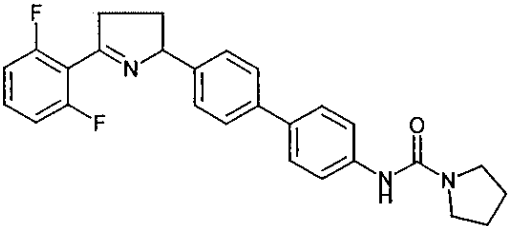
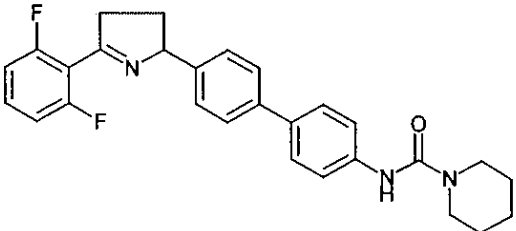
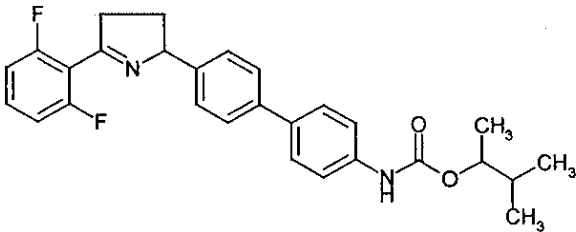
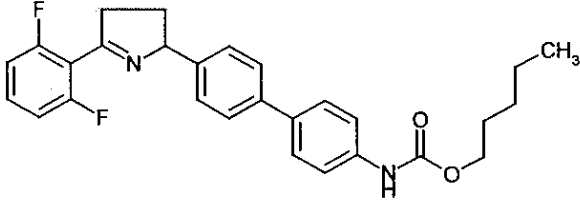
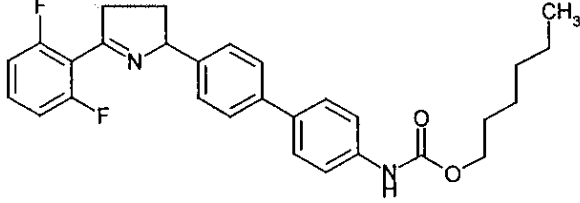
## 【 0 3 2 6 】

【表 3】

表B  
植物を損傷させる昆虫  
ハイドン（Phaedon）幼虫試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位：ppm)	7 日後の殺虫率 (単位：%)	
	(1) 100	100	10
	(6) 100	100	20
	(2) 100	100	
	(7) 100	100	30
	(9) 100	100	
	(10) 100	100	40

表B  
植物を損傷させる昆虫  
ハイドン (Phaedon) 幼虫試験

活性化化合物	活性化化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)
	(11) 100	100
	(12) 100	100
	(16) 100	100
	(18) 100	100
	(19) 100	100

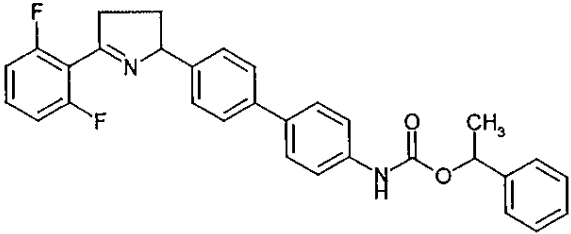
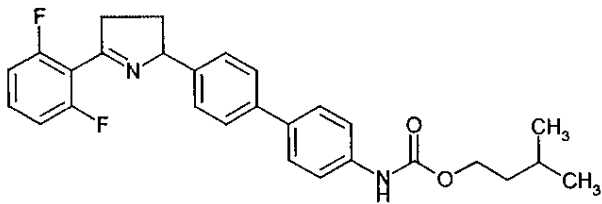
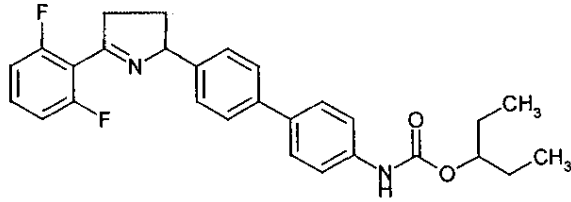
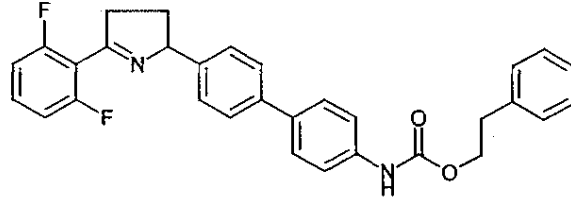
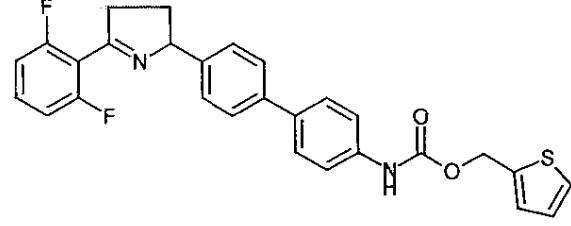
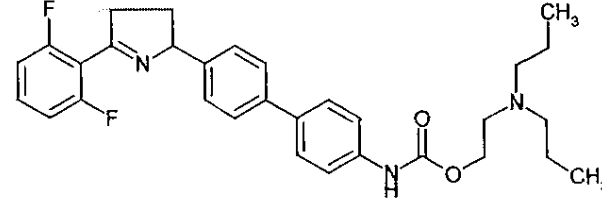
10

20

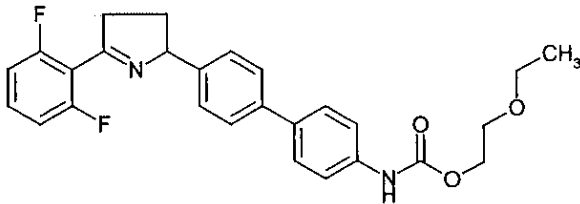
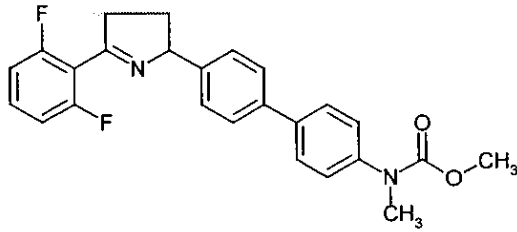
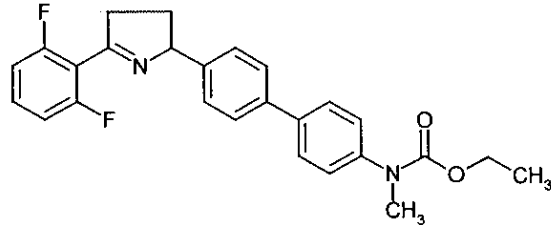
30

40

表B  
植物を損傷させる昆虫  
ハイドン (Phaedon) 幼虫試験

活性化化合物	活性化化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)	
 (20)	100	100	10
 (21)	100	100	20
 (24)	100	100	
 (25)	100	100	30
 (27)	100	100	40
 (29)	100	100	

表B  
植物を損傷させる昆虫  
ハイドン (Phaedon) 幼虫試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)
 (32)	100	100
 (35)	100	100
 (37)	100	90

## 【0327】

(実施例C)

コナガ (Plutera) 試験、感受性系統

溶媒: ジメチルホルムアミド 7重量部

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル 2重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

## 【0328】

所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することによって、キャベツの葉 (キャベツ (Brassica oleracea)) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、コナガ (コナガ (Plutella xylostella)、感受性系統) のイモムシとともに置く。

## 【0329】

望ましい時間が経過した後、殺虫 (単位: %) を判定する。100%は、すべてのイモムシが死んだことを意味し、0%は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

## 【0330】

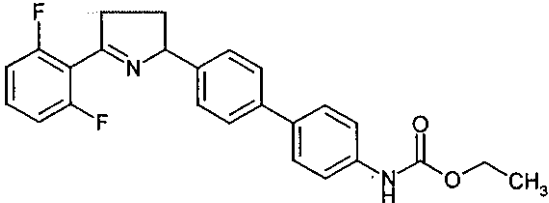
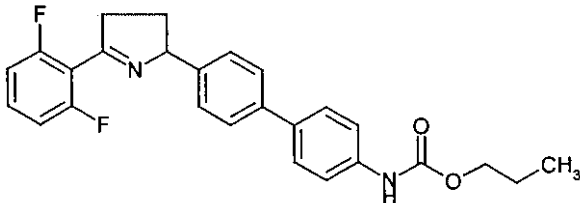
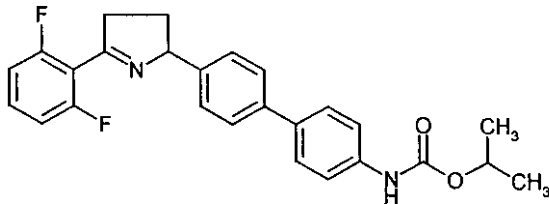
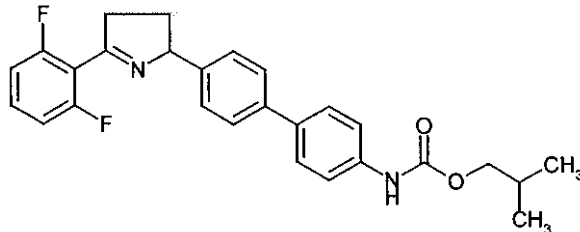
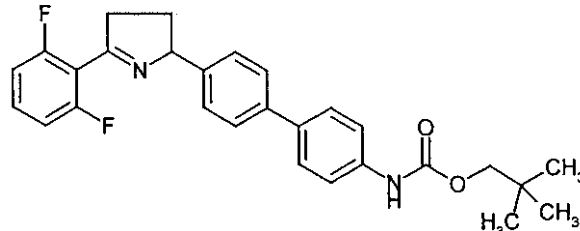
この試験において、100ppmの活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物2、6~8および23は、少なくとも95%という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表Cから詳細にわかる。

## 【0331】



【表 4】

表 C  
植物を損傷させる昆虫  
コナガ (Plutella) 試験、感受性系統

活性化化合物	活性化化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)	
	(6) 100	100	10
	(2) 100	100	20
	(7) 100	100	
	(8) 100	100	30
	(23) 100	100	40

## 【 0 3 3 2 】

(実施例 D)

コナガ (Plutera) 試験、耐性系統

溶媒 : ジメチルホルムアミド 7 重量部

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル 2 重量部

活性化化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

## 【 0 3 3 3 】

所望の濃度の活性化化合物の調製物に浸漬することによって、キャベツの葉 (キャベツ (

50

B r a s s i c a o l e r a c e a ) ) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、コナガ (コナガ ( P l u t e l l a x y l o s t e l l a ) 、耐性系統) のイモムシとともに置く。

【 0 3 3 4 】

望ましい時間が経過した後、殺虫 (単位: %) を判定する。100% は、すべてのイモムシが死んだことを意味し、0% は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

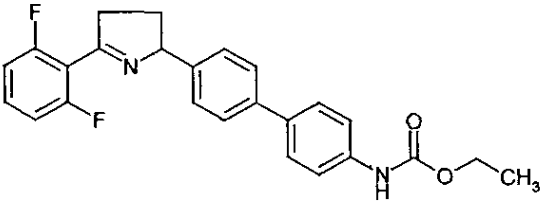
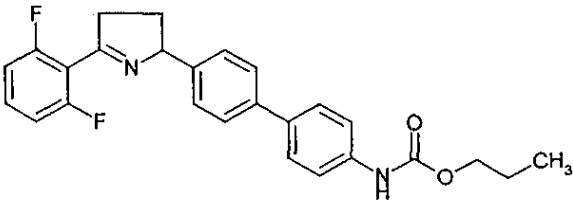
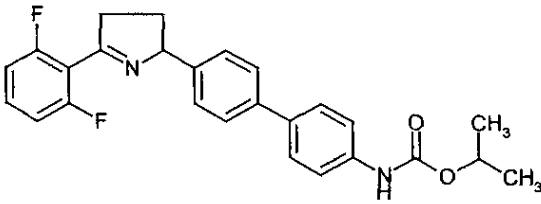
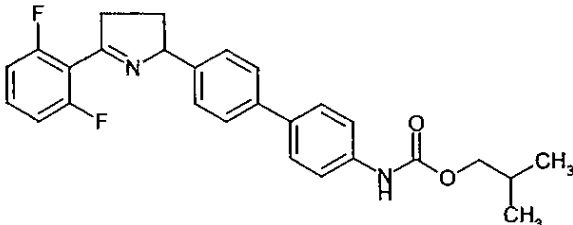
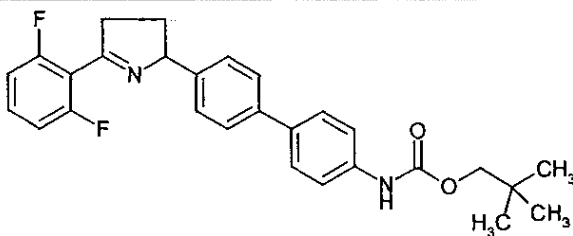
【 0 3 3 5 】

この試験において、100ppm の活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物 2、6 ~ 8 および 23 は、少なくとも 95% という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表 D から詳細にわかる。

【 0 3 3 6 】

【表 5】

表D  
植物を損傷させる昆虫  
コナガ (Plutella) 試験、耐性系統

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7 日後の殺虫率 (単位: %)	
 (6)	100	100	10
 (2)	100	100	20
 (7)	100	100	30
 (8)	100	100	40
 (23)	100	100	

## 【0337】

(実施例 E)

シロイモチジヨトウ (Spodoptera exigua) 試験

溶媒: ジメチルホルムアミド 7 重量部

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル 2 重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

## 【0338】

所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することによって、キャベツの葉 (キャベツ (

50

*Brassica oleracea*)) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、ヨトウムシ (シロイモチジヨトウ (*Spodoptera exigua*)) のイモムシとともに置く。

【0339】

望ましい時間が経過した後、殺虫 (単位: %) を判定する。100% は、すべてのイモムシが死んだことを意味し、0% は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

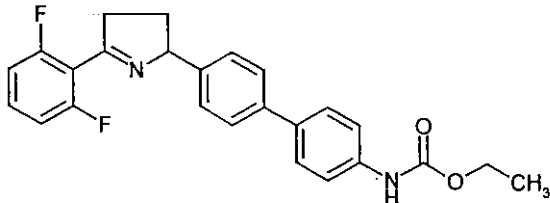
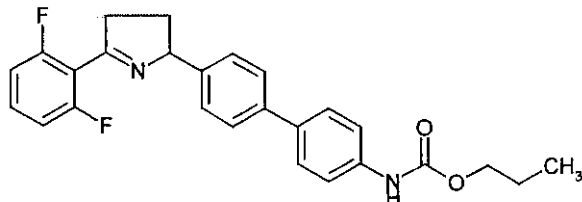
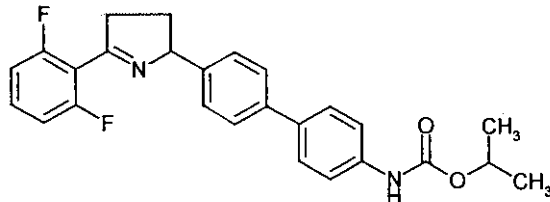
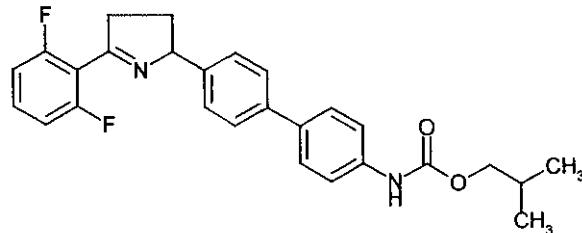
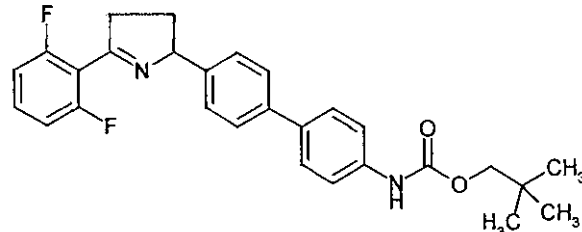
【0340】

この試験において、100 ppm の活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物 2、6 ~ 8 および 23 は、少なくとも 95% という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表 E から詳細にわかる。

【0341】

【表 6】

表E  
植物を損傷させる昆虫  
シロイモチジヨトウ ( *Spodoptera exigua* ) 試験、耐性系統

活性化合物	test	活性化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)	
	(6)	100	100	10
	(2)	100	100	20
	(7)	100	100	
	(8)	100	100	30
	(23)	100	100	40

【 0 3 4 2 】

( 実施例 F )

ヨトウガ ( *Spodoptera frugiperda* ) 試験

溶媒 : ジメチルホルムアミド 7 重量部

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル 2 重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

【 0 3 4 3 】

所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することによって、キャベツの葉（キャベツ（*Brassica oleracea*））を処理し、葉がなお湿潤している状態で、ヨトウムシ（ヨトウガ（*Spodoptera frugiperda*））のイモムシとともに置く。

【0344】

望ましい時間が経過した後、殺虫（単位：％）を判定する。100％は、すべての幼虫イモムシが死んだことを意味し、0％は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

【0345】

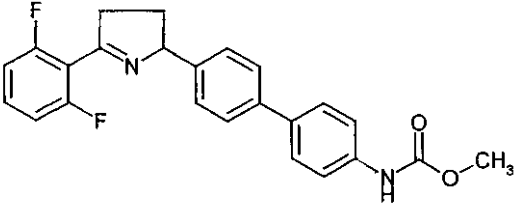
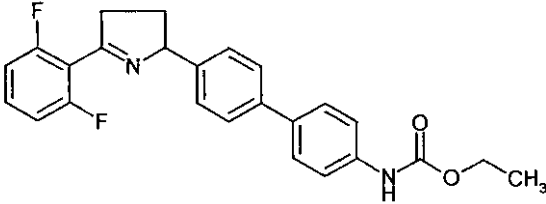
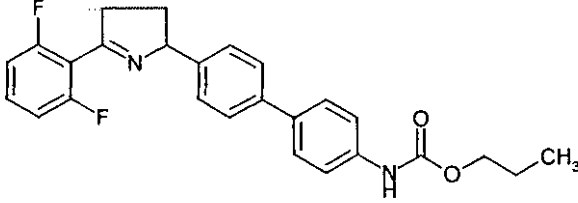
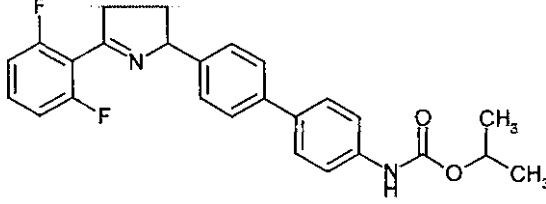
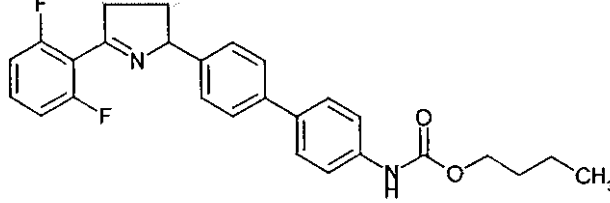
この試験において、100ppmの活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物1、2、4～7、9、10、12、14、17、18、20～23、25～28、30、31、33、34および37は、少なくとも95％という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表Fから詳細にわかる。

10

【0346】

【表 7】

表 F  
植物を損傷させる昆虫  
ヨトウガ ( *Spodoptera frugiperda* ) 試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位 : ppm)	7 日後の殺虫率 (単位 : %)
 (1)	100	100
 (6)	100	100
 (2)	100	100
 (7)	100	100
 (9)	100	100

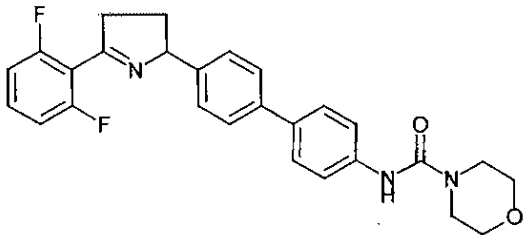
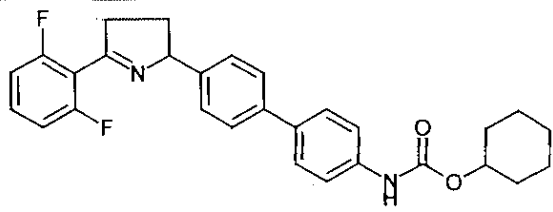
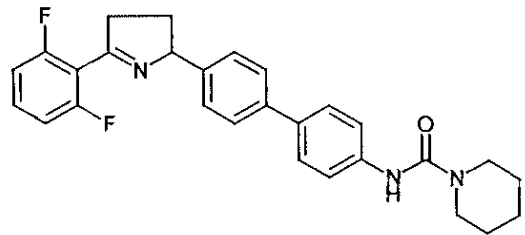
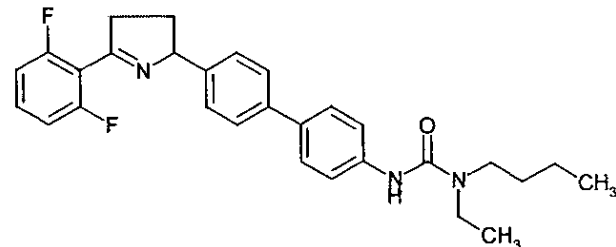
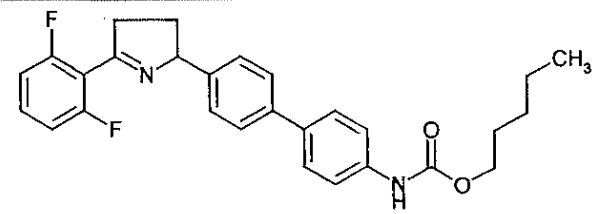
10

20

30

40

表F  
植物を損傷させる昆虫  
ヨトウガ (*Spodoptera frugiperda*) 試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)	
 (5)	100	100	10
 (10)	100	100	20
 (12)	100	100	30
 (14)	100	100	40
 (18)	100	100	



表F  
植物を損傷させる昆虫  
ヨトウガ (*Spodoptera frugiperda*) 試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)
 (20)	100	100
 (21)	100	100
 (22)	100	100
 (23)	100	100
 (25)	100	100

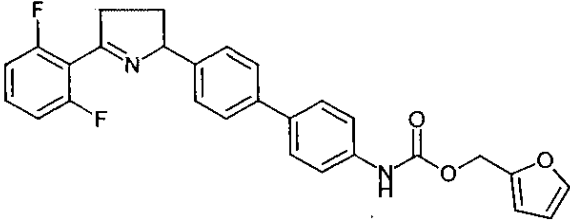
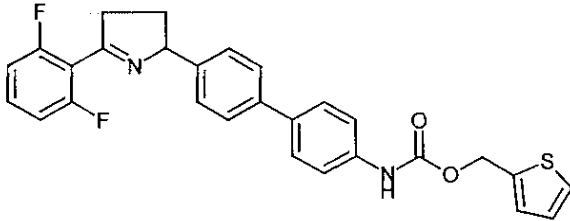
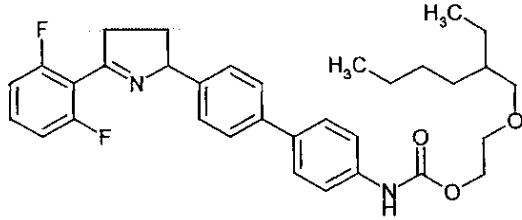
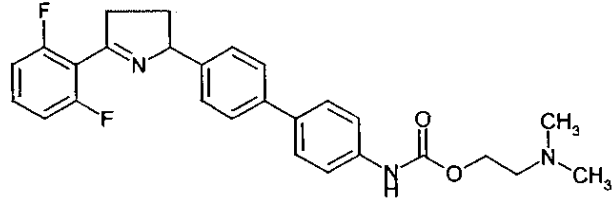
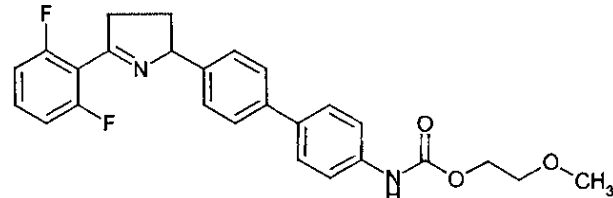
10

20

30

40

表F  
植物を損傷させる昆虫  
ヨトウガ (*Spodoptera frugiperda*) 試験

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)
 <p>(26)</p>	100	100
 <p>(27)</p>	100	100
 <p>(28)</p>	100	100
 <p>(30)</p>	100	100
 <p>(31)</p>	100	100

10

20

30

40



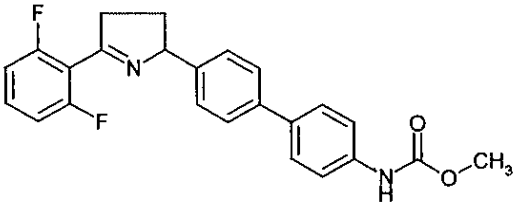
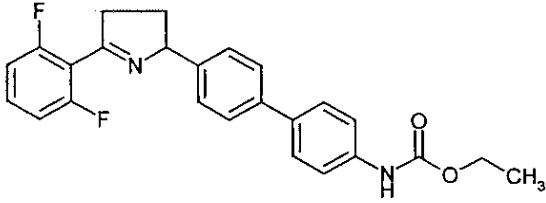
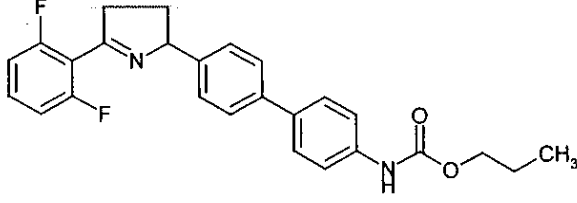
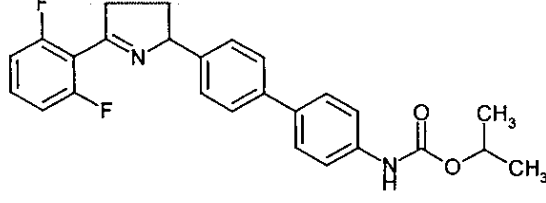
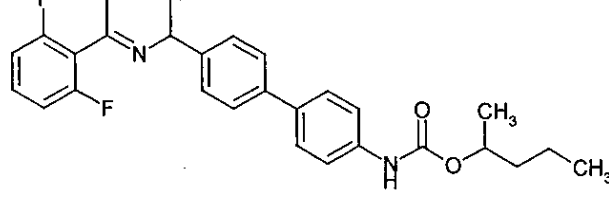
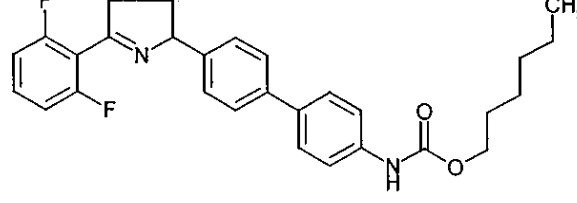
## 【 0 3 5 0 】

この試験において、100 ppmの活性化合物濃度で、例えば、調製例からの化合物1、2、4、6、7、17、19、22～24、26～30および32～35は、少なくとも85%という良好な活性を示す。この試験の結果は、下の表Gから詳細にわかる。

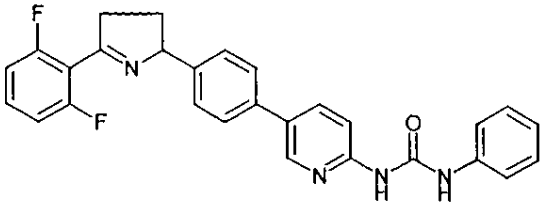
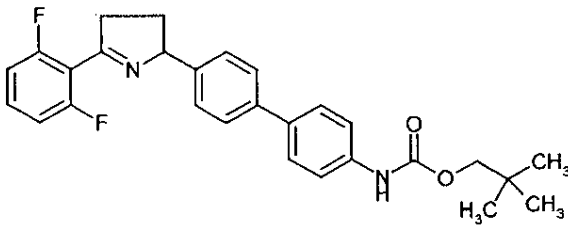
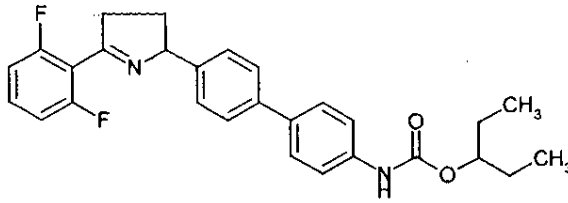
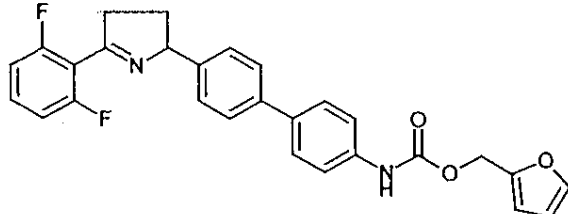
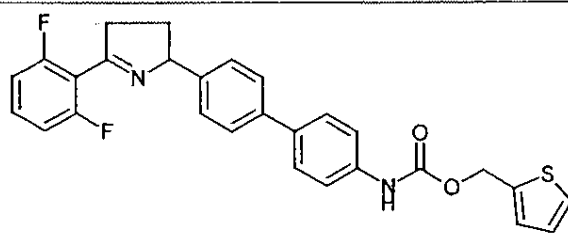
## 【 0 3 5 1 】

## 【表 8】

表G  
植物を損傷させる昆虫  
ナミハダニ属 (Tetranychus) 試験 (OP耐性/浸漬処理)

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)	
	(1) 100	98	10
	(6) 100	98	20
	(2) 100	98	30
	(7) 100	98	
	(17) 100	90	40
	(19) 100	90	

表G  
植物を損傷させる昆虫  
ナミハダニ属 (Tetranychus) 試験 (OP耐性/浸漬処理)

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)
 <p>(22)</p>	100	90
 <p>(23)</p>	100	95
 <p>(24)</p>	100	95
 <p>(26)</p>	100	98
 <p>(27)</p>	100	98

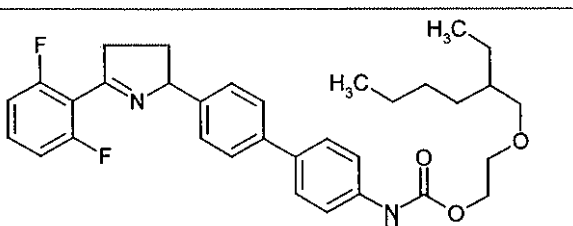
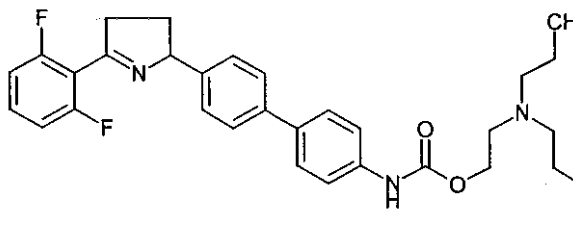
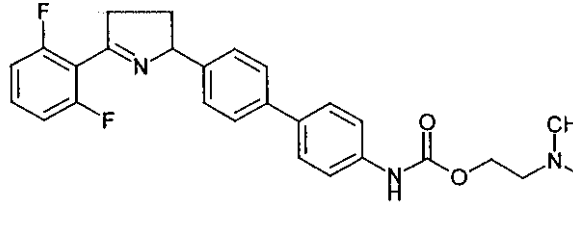
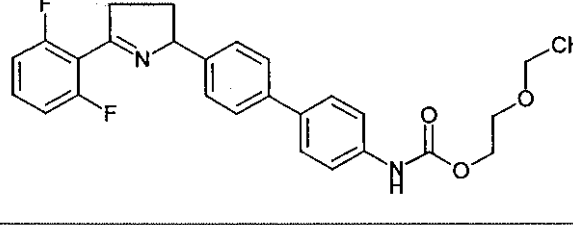
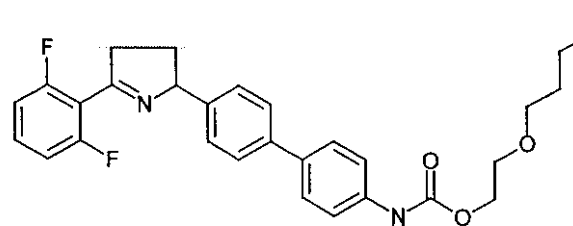
10

20

30

40

表G  
植物を損傷させる昆虫  
ナミハダニ属 (Tetranychus) 試験 (OP耐性/浸漬処理)

活性化合物	活性化合物濃度 (単位: ppm)	7日後の殺虫率 (単位: %)
 (28)	100	95
 (29)	100	98
 (30)	100	95
 (32)	100	98
 (33)	100	100

10

20

30

40

表G  
植物を損傷させる昆虫  
ナミハダニ属 (Tetranychus) 試験 (OP耐性/浸漬処理)

活性化合物	活性化合物濃度 (単位：ppm)	7日後の殺虫率 (単位：%)
	(34) 100	90
	(35) 100	98
	(4) 100	90

【 0 3 5 2 】

( 实施例 H )

ジアブロチカ・バルテアタ ( *D i a b r o t i c a   b a l t e a t a* ) ( 土 壌 中 の 幼 虫 ) 30

溶媒：ジメチルホルムアミド 7重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1重量部の活性化合物と示した量の溶媒とを混合し、示した量の乳化剤を添加し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【 0 3 5 3 】

活性化合物の調製物を土壌に注ぎかける。この場合、この調製物における活性化合物の濃度は、実質的に重要でなく、 $\text{ppm} (\text{mg} / \text{L})$  で示される土壌の容量単位あたりの活性化合物の重量による量のみが重要である。その土壌を  $0.25 \text{ L}$  のポットに充填し、これらを  $20^\circ\text{C}$  で放置する。

【 0 3 5 4 】

準備したら直ちに、栽培品種 YIELD GUARD (Monsanto Comp., U.S.A.の商標)のあらかじめ発芽させたトウモロコシ5つを各ポットに入れる。2日後、対応する試験昆虫を、処理した土壌に配置する。さらに7日後、発芽したトウモロコシ植物の数を数えることによって、活性化化合物の有効度を判定する(植物1つ = 活性20%)。

【 0 3 5 5 】

( 实施例 J )

オオタバコガ ( *Heliothis virescens* ) 試験 ( トランスジェニック植物の処理 )

溶媒：ジメチルホルムアミド 7重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル 1重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、示した量の溶媒および示した量の乳化剤と1重量部の活性化合物を混合し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【0356】

所望の濃度の活性化合物の調製物に浸漬することによって、栽培に品種 Roundup Ready (Monsant Comp., USAの商標) の大豆苗条 (ダイズ (Glycine max)) を処理し、葉がなお湿潤している状態で、オオタバコガの幼虫 イモムシ (オオタバコガ (Heliothis virescens)) とともに置く。

【0357】

望ましい時間が経過した後、殺虫 (単位: %) を判定する。100% は、すべての幼虫 イモムシが死んだことを意味し、0% は、どのイモムシも死んでいないことを意味する。

【0358】

(実施例 K)

オウシマダニ (Boophilus microplus) 耐性 / SP - 耐性パークハースト (Parkhurst) 系統での試験

試験動物：満腹の (satiated) 雌成体

溶媒：ジメチルスルホキシド

20 mg の活性化合物を 1 mL のジメチルスルホキシドに溶解する。同じ溶媒で希釈することによって、より低い濃度のものを調製する。

【0359】

試験は、5回反復して行う。1  $\mu$ L の溶液を腹部に注射し、その動物をシャーレに移して、気候制御室で保存する。7日後、受精卵の堆積についての検査により、活性をチェックする。受精が外観的に見て取れない卵は、幼虫が卵からかえるまで、環境制御室内のガラス管の中で保管する。100% の活性は、どのマダニも受精卵を生んでいないことを示す。

【0360】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、非常に良好な活性を示す。

【0361】

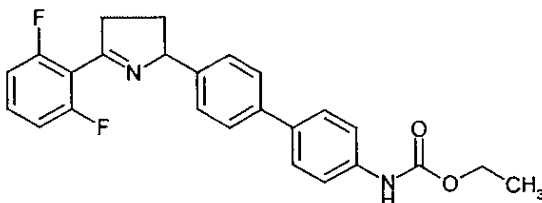
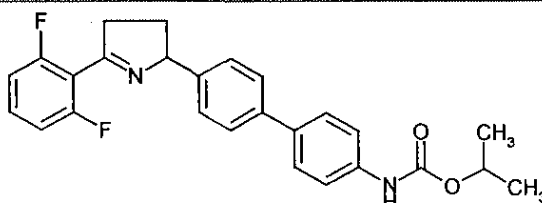
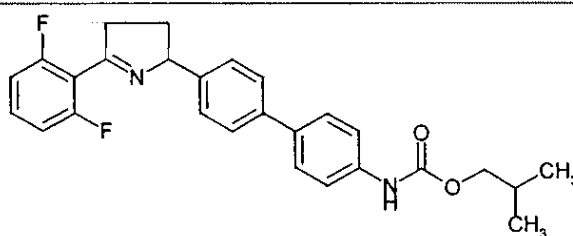
10

20



【表 9】

表K  
 オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 耐性/  
 SP-耐性パークハースト (Parkhurst) 系統での試験

活性化化合物	濃度 (単位: $\mu\text{g}$ /動物 1 匹)	活性/殺虫 (単位: %)
	(6) 100/20	20/20
	(7) 100/20	40/0
	(8) 100/20/4	80/40/0

10

20

## 【0362】

(実施例 L)

ハエ (イエバエ (*Musca domestica*)) での試験

試験動物: イエバエ (*Musca domestica*) 成体、ライヒスヴァルド (Reichswald) 系統 (OP、SP、カルバメート耐性) 30

溶媒: ジメチルスルホキシド

20 mg の活性化化合物を 1 mL のジメチルスルホキシドに溶解する。蒸留水で希釈することによって、より低い濃度のものを調製する。

## 【0363】

対応する寸法のペトリ皿の中の平円形濾紙 (9.5 cm) の上に、2 mL のこの活性化化合物の調製物をピペットで移す。その平円形濾紙を乾燥させた後、25 匹の試験動物を前記ペトリ皿に移し、その後、それらに覆いをかぶせる。

## 【0364】

1、3、5、24 および 48 時間後、活性化化合物の調製物の活性を測定する。100% は、すべてのハエが死んだことを意味し、0% は、どのハエも死んでいないことを意味する。 40

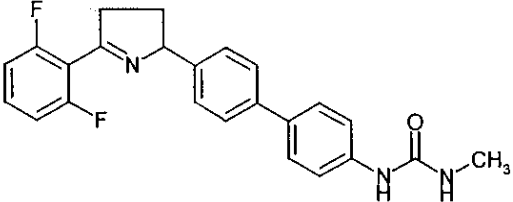
## 【0365】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、非常に良好な活性を示す。

## 【0366】

【表 10】

表 L  
ハエ（イエバエ (*Musca domestica*)）での試験

活性化合物	濃度 (単位：ppm)	活性／殺虫 (単位：%)
 (13)	100/20	30/0

## フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I
<b>A 0 1 N 43/40 (2006.01)</b>		A 0 1 N 43/40 1 0 1 J
<b>A 0 1 N 43/76 (2006.01)</b>		A 0 1 N 43/40 1 0 1 P
<b>A 0 1 N 43/84 (2006.01)</b>		A 0 1 N 43/76
<b>C 0 7 B 61/00 (2006.01)</b>		A 0 1 N 43/84 1 0 1
		C 0 7 B 61/00 3 0 0

- (72)発明者 ザイツ, トーマス  
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、リーテルパハ・1 0・ペー
- (72)発明者 フュースライン, マルティーン  
ドイツ国、4 0 2 1 5・デュツセルドルフ、ヤーンシュトラセ・3 9 - 4 1
- (72)発明者 ヤンセン, ヨハネス・ルドルフ  
ドイツ国、4 0 7 8 9・マンハイム、クニツブラターシュトラセ・4 7
- (72)発明者 クラーツ, ウード  
ドイツ国、5 1 3 7 5・レバークーゼン、アンドレアスシュトラセ・2 2・アー
- (72)発明者 エーアデレン, クリストフ  
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ウンタービューシエルホフ・1 5
- (72)発明者 トウルベルク, アンドレアス  
ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、ズインテルシュトラセ・8 6
- (72)発明者 ハンセン, オラフ  
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ノイエンカンブ・9・アー

審査官 高 岡 裕美

- (56)参考文献 特表2 0 0 4 - 5 1 5 4 8 9 ( J P , A )  
国際公開第 0 2 / 6 4 5 8 8 ( W O , A 1 )  
国際公開第 9 8 / 2 2 4 3 8 ( W O , A 1 )  
国際公開第 9 9 / 5 9 9 6 8 ( W O , A 1 )  
国際公開第 9 9 / 5 9 9 6 7 ( W O , A 1 )  
国際公開第 0 0 / 2 1 9 5 8 ( W O , A 1 )

## (58)調査した分野(Int.Cl., D B名)

C07D207/00-207/50  
C07D401/00-401/14  
C07D405/12  
C07D409/12  
C07D413/10  
CAplus(STN)  
REGISTRY(STN)