

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6215052号
(P6215052)

(45) 発行日 平成29年10月18日 (2017. 10. 18)

(24) 登録日 平成29年9月29日 (2017. 9. 29)

(51) Int. Cl.

F I

CO7D 401/14 (2006.01)
 AO1N 43/56 (2006.01)
 AO1N 43/78 (2006.01)
 AO1N 43/824 (2006.01)
 AO1P 7/02 (2006.01)

CO7D 401/14 C S P
 AO1N 43/56 D
 AO1N 43/78 B
 AO1N 43/82 I O I A
 AO1P 7/02

請求項の数 14 (全 117 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2013-517209 (P2013-517209)
 (86) (22) 出願日 平成23年6月24日 (2011. 6. 24)
 (65) 公表番号 特表2013-534530 (P2013-534530A)
 (43) 公表日 平成25年9月5日 (2013. 9. 5)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2011/060596
 (87) 国際公開番号 W02012/000896
 (87) 国際公開日 平成24年1月5日 (2012. 1. 5)
 審査請求日 平成26年6月20日 (2014. 6. 20)
 審判番号 不服2016-11723 (P2016-11723/J1)
 審判請求日 平成28年8月4日 (2016. 8. 4)
 (31) 優先権主張番号 11159576.5
 (32) 優先日 平成23年3月24日 (2011. 3. 24)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)
 (31) 優先権主張番号 61/359,058
 (32) 優先日 平成22年6月28日 (2010. 6. 28)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 512137348
 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
 Bayer Intellectual Property GmbH
 ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

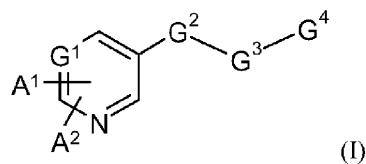
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての複素環化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】

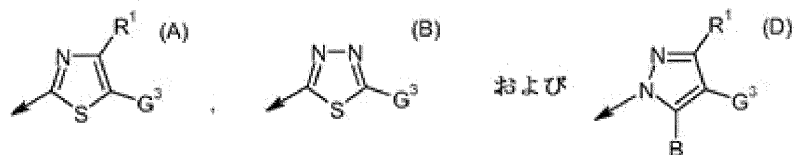


[式中、

A¹ および A² は、各々、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルまたは C₁ - C₆ - アルコキシであり、

G¹ は N または C - A¹ であって、G² は、

【化 2】

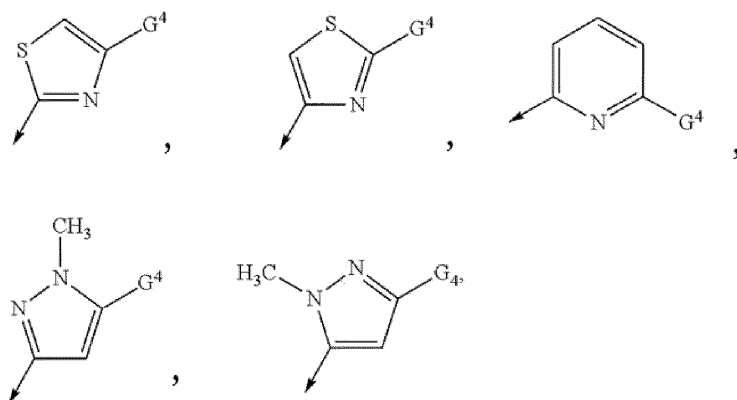


[式中、矢印は、隣接する環への結合を示し、

Bは水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_3-C_6 -シクロアルキルであり、

R^1 は、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルキルである。]、および

G^3 はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニル、または C_2-C_6 -アルキニルで置換されていてもよい、

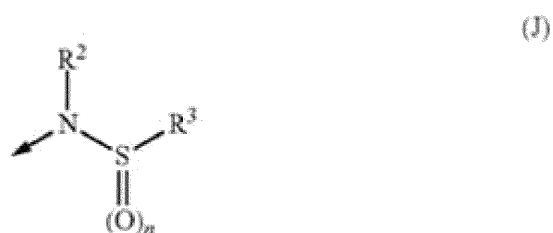
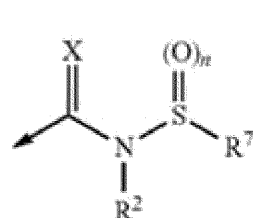


[式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。]

の群からの基であり、そして

G^4 は、

【化 3】



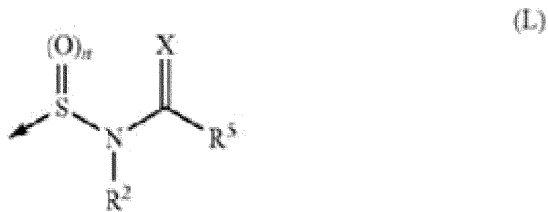
および

10

20

30

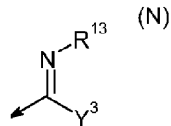
40



の群からの基であり、

並びに G^2 が基 (A) または (B) の場合には、基：

【化 4】



10

でもあり、〔式中、矢印は、 G^3 への結合を示し、

X は酸素または硫黄であり、

n は 1 または 2 であり、

R^2 は水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、および、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-またはシアノ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルの群からの基であり、

20

R^3 および R^7 は、各々、独立して、

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-または C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、

30

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-または C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい、

各場合において、ハロゲン-、シアノ-、シアノアルキル-、ニトロ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ (C_1-C_6 -アルキル) アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキル、並びに

40

$NR'R''$ であって、 R' および R'' は、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -ア

50

ルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルの群からの基である、
 の群からの基であり、

R^2 および R^3 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-または C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい 5 員から 7 員の環を形成してもよく、

10

R^5 は、

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-または C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、および C_2-C_6 -アルキニル、

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-または C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい、

20

各場合において、ハロゲン-、シアノ-、シアノアルキル-、ニトロ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキル、並びに

30

$NR'R''$ であって、 R' および R'' は、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルの群からの基である、

40

の群からの基であり、

R^2 および R^5 は、それらが結合している $N-C(X)$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここに酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-または C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい 5 員から 7 員の環を形成してもよく、

G^4 が基 (E) である場合における R^2 および R^7 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここに酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 つのカ

50

ルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の、ハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-または C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい5員から7員の環を形成してもよく、

R^{13} は水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルチオ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -シアノアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_2-C_6 -シアノアルキニル、 C_1-C_7 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_7 -アルコキシカルボニルの群からの基であり、

Y^3 は C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、および $NR^{14}R^{15}$ の群からの基であって、

R^{14} および R^{15} は、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_6 -シアノアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルチオ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -シアノアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_2-C_6 -シアノアルキニル、 C_1-C_7 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_7 -アルコキシカルボニルの群からの基であるか、あるいは

R^{14} および R^{15} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン-、シアノ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_3-C_8 -シクロアルキル-または C_1-C_6 -アルキルチオ-で置換されていてもよい飽和または不飽和の、硫黄、酸素（ここに酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、5員から8員の環を形成してもよい。】であり、

ここで、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素の群から選択され、

アリールは、フェニル、ナフチル、アントリルおよびフェナントレニルの群から選択され、

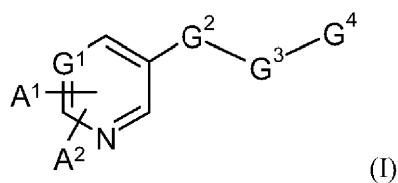
ヘテロアリールは、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニルおよびインドリジニルの群から選択される。]

の化合物、または式(I)の化合物の塩もしくはN-オキシド。

【請求項2】

式(I)：

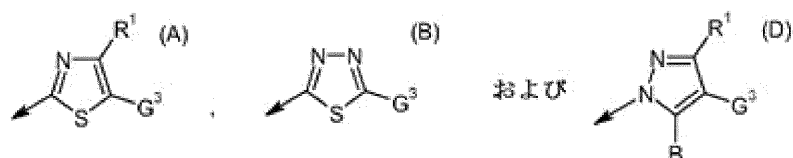
【化 1】



[式中、

 A^1 は、水素、ハロゲンまたはシアノであり、 A^2 は水素であり、 G^1 はNまたはC- A^1 であって、 G^2 は、

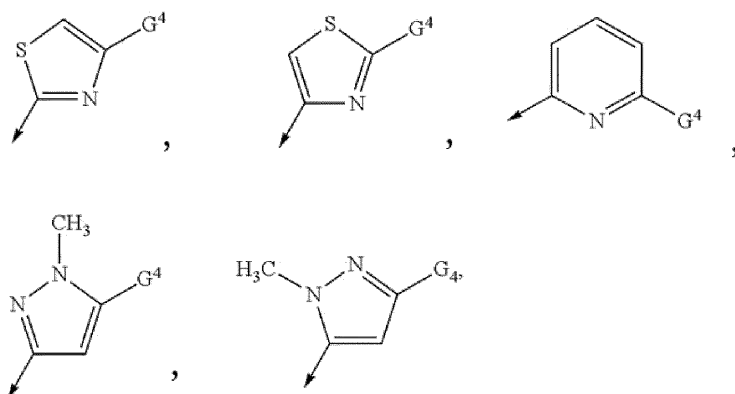
【化 2】



[式中、矢印は、隣接する環への結合を示し、

 R^1 は、水素またはC₁-C₄-アルキルであり、 B は、水素である。]、および

G^3 はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ヒドロキシル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルケニル、またはC₂-C₆-アルキニルで置換されていてもよい、



[式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。]

の群からの基であり、そして

 G^4 は、

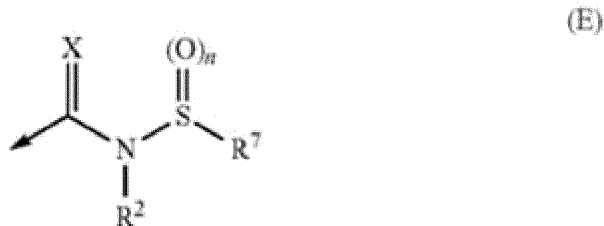
10

20

30

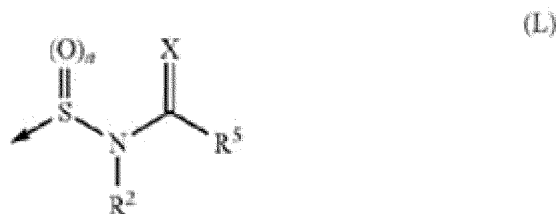
40

【化 3】



および

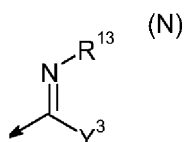
10



の群からの基であって、
並びに G^2 が基 (A) または (B) の場合には、基：

【化 4】

20



でもあり、〔式中、矢印は、 G^3 への結合を示し

X は酸素であり、

n は 2 であり、

R^2 は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロゲン-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、およびハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-またはシアノ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルの群からの基であり、

30

R^5 は、

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-または C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、

40

各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-または C_1-C_4 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい、

各場合において、ハロゲン-、シアノ-、シアノアルキル-、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -

50

C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、C₁-C₄-アルキルアミノ-、ジ(C₁-C₄-アルキル)アミノ-、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシカルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₂-C₄-アルケニル-、C₂-C₄-アルキニル-、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-アルキルカルボニル-、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール-C₁-C₄-アルキルおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル、並びに

10

NR'R'であって、R'およびR'は、各々、独立して、水素およびC₁-C₄-アルキルの群からの基である、

の群からの基であり、

R⁷は、

各場合において、ハロゲン-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-アルキルチオ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-またはC₁-C₄-ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよいC₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニルおよびC₂-C₄-アルキニル、

各場合において、ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-またはC₁-C₄-ハロアルコキシ-で置換されていてもよいC₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキルおよびC₃-C₄-シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい、

20

各場合において、ハロゲン-、シアノ-、シアノアルキル-、ニトロ-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-アルキルチオ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、C₁-C₄-アルキルアミノ-、ジ(C₁-C₄-アルキル)アミノ-、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシカルボニルアミノ-、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₂-C₄-アルケニル-、C₂-C₄-アルキニル-、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-アルキルカルボニル-、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよい、アリール、ヘテロアリール、アリール-C₁-C₄-アルキルおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル、並びに

30

NR'R'であって、R'およびR'は、各々、独立して、水素、C₁-C₄-アルキルおよびC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキルの群からの基である、
の群からの基であり、

40

R¹³は水素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、シアノ、C₁-C₄-シアノアルキル、C₁-C₄-ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-シアノアルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₂-C₄-ハロアルキニル、C₂-C₄-シアノアルキニル、C₁-C₅-アルキルカルボニルおよびC₁-C₅-アルコキシカルボニルの群からの基であり、

Y³はC₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、およびNR¹⁴R¹⁵の群からの基であって、

50

R^{14} および R^{15} は、各々、独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、ヒドロキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニル および C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基であるか、あるいは

R^{14} および R^{15} は、それらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン-、シアノ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-または C_1-C_4 -アルキルチオ-で置換されていてもよい飽和または不飽和の、硫黄、酸素（ここに酸素原子 同士 は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からのさらなるヘテロ原子および／または1つのカルボニル基を含有してもよい、5員から8員の環を形成してもよい。] であり、

ここで、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素の群から選択され、

アリールは、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、

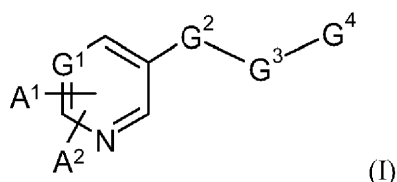
ヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジニル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、イミダゾリル、チアゾリル、チアジアゾリルおよびフラニルの群から選択される。]

の化合物、または式 (I) の化合物の塩もしくはN-オキシド。

【請求項3】

式 (I) :

【化1】

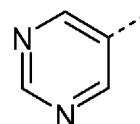
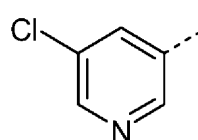
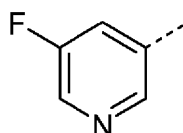
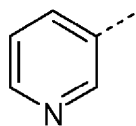


[式中、

A^1 は、水素、フッ素または塩素であり、

A^2 は水素であり、

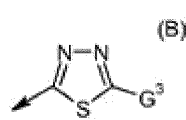
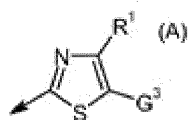
G^1 はNまたはC- A^1 であり、これは、以下の構造エレメント：



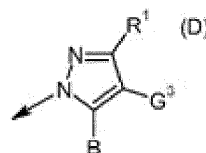
[式中、破線は G^2 への結合を意味する。] を含有する化合物に導き、

G^2 は

【化2】



および

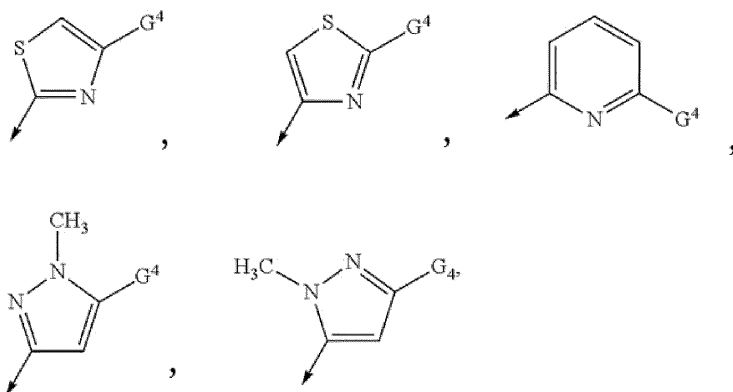


[式中、矢印は、各場合において、隣接する環への結合を示し、

R^1 は、水素またはメチルであり、

Bは水素である。] であり、および

G^3 は、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、アミノまたはジメチルアミノで置換されていてもよい



10

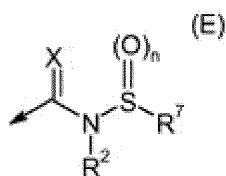
[式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。]

の群からの基であり、そして

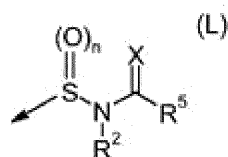
G^4 は、

【化3】

20



および

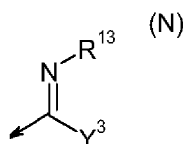


30

の群からの基であり、

並びに G^2 が基 (A) または (B) の場合には、

【化4】



でもあり、[式中、各場合において、矢印は、 G^3 への結合を示し、

40

X は酸素であり、

n は2であり、

R^2 は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、シアノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、およびハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキルまたはシアノで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニルの群からの基であり、

R^5 は、

50

___各場合において、ハロゲンー、 C_1-C_4 -アルコキシー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシー、 C_1-C_4 -アルキルチオー、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオー、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルーまたは C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルーで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、

___各場合において、ハロゲンー、 C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルー、 C_1-C_4 -アルコキシーまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシーで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルー C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい、

10

___各場合において、ハロゲンー、シアノー、シアノアルキルー、ニトロー、 C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルー、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシー、 C_1-C_4 -アルキルチオー、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオー、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルー、アミノー、 C_1-C_4 -アルキルアミノー、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノー、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノー、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノー、 C_1-C_4 -アルコキシ C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ C_1-C_4 -アルキルー、 C_2-C_4 -アルケニルー、 C_2-C_4 -アルキニルー、 C_3-C_6 -シクロアルキルー C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルー、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルーまたはアミノカルボニルーで置換されていてもよい、アリール、ヘテロアリール、アリールー C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリールー C_1-C_4 -アルキル、並びに

20

___ $NR'R''$ であって、 R' および R'' は、各々、独立して、水素および C_1-C_4 -アルキルの群からの基である、

の群からの基であり、

R^7 は、

___各場合において、ハロゲンー、 C_1-C_4 -アルコキシー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシー、 C_1-C_4 -アルキルチオー、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオー、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルーまたは C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルーで置換されていてもよい、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、

30

___各場合において、ハロゲンー、 C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルー、 C_1-C_4 -アルコキシーまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシーで置換されていてもよい、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルー C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子同士は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい、

___各場合において、ハロゲンー、シアノー、シアノアルキルー、ニトロー、 C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルー、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシー、 C_1-C_4 -アルキルチオー、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオー、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニルー、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルー、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルー、アミノー、 C_1-C_4 -アルキルアミノー、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノー、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノー、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノー、 C_1-C_4 -アルコキシ C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ C_1-C_4 -アルキルー、 C_2-C_4 -アルケニルー、 C_2-C_4 -アルキニルー、 C_3-C_6 -シクロアルキルー C_1-C_4 -アルキルー、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルー、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルーまたはアミノカルボニルーで置換されてい

40

50

てもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル、並びに
 $NR'R''$ であって、 R' および R'' は、各々、独立して、水素および C_1-C_4 -アルキルの群からの基である、

の群からの基であり、

R^{1-3} は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基であり、

Y^3 は C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、および $NR^{1-4}R^{1-5}$ の群からの基であって、

R^{1-4} および R^{1-5} は、各々、独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基であるか、あるいは

R^{1-4} および R^{1-5} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ハロゲン-、シアノ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-または C_1-C_4 -アルキルチオ-で置換されていてもよい飽和または不飽和の、硫黄、酸素および窒素の群からのさらなるヘテロ原子および/または1つのカルボニル基を含有してもよい、5員から6員の環を形成してもよい。]であり、

ここで、

アリールはフェニルであり、

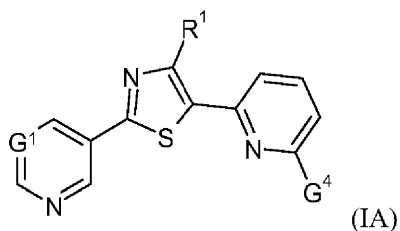
ヘテロアリールは、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニルおよびピラジニルの群から選択される。]

の化合物、または式(I)の化合物の塩もしくはN-オキシド。

【請求項4】

式(IA)：

【化5】



[式中、

G^1 は $C-H$ 、 $C-F$ 、 $C-Cl$ または N であり、

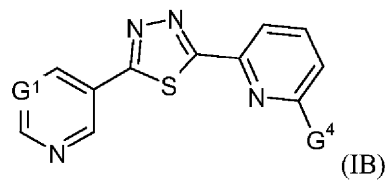
R^1 は水素またはメチルであり、そして

G^4 は請求項1で特定された(E)、(L)および(N)基のうち1つである。]

の化合物。

【請求項5】

式 (I B) :
【化 6】



[式中、

G¹ は C-H、C-F、C-Cl または N であり、そして

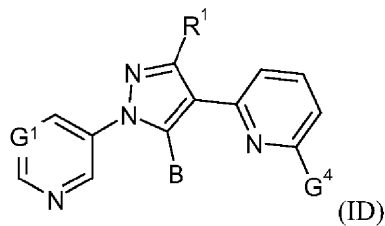
G⁴ は請求項 1 で特定された (E)、(L) および (N) 基のうち 1 つである。]

の化合物。

【請求項 6】

式 (I D) :

【化 8】



[式中、

G¹ は C-H、C-F、C-Cl または N であり、

R¹ は水素またはメチルであり、

B は水素であり、そして

G⁴ は請求項 1 で特定された (E) および (L) 基のうち 1 つである。]

の化合物。

【請求項 7】

請求項 1 から 6 に記載の式 (I)、(I A)、(I B) または (I D) の少なくとも 1 つの化合物を含有することに特徴を有する組成物。

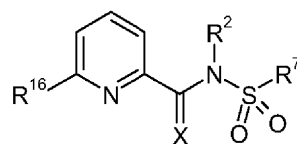
【請求項 8】

請求項 1 から 6 に記載の式 (I)、(I A)、(I B) または (I D) の化合物または請求項 7 に記載の組成物を有害生物および／またはそれらの生息地に作用させることを特徴とする有害生物の防除方法。

【請求項 9】

式 (X I I) :

【化 9】



(XII)

[式中、R¹⁶ はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり、そして

X、R² および R⁷ は、各々、請求項 1 で定義された通りである。]

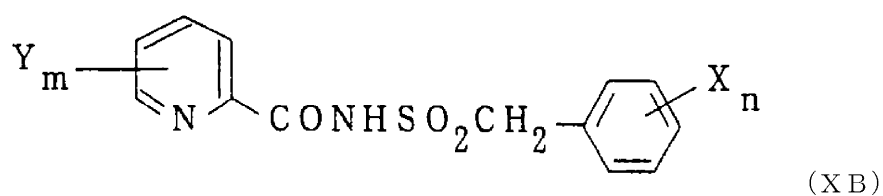
の化合物 (ただし、以下の式 (X B) で表される化合物、

10

20

30

40

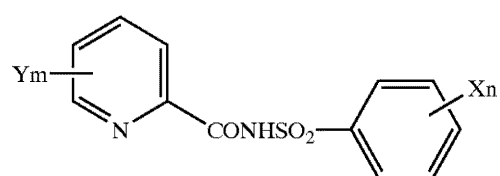


[式中、 X_n と Y_m は、以下の X_n と Y_m の各組み合わせから選択される。

X_n	Y_m
2-CF ₃	6-Cl
2-CH ₃	6-Cl
2-COOCH ₃	6-Cl
2-Cl, 3-Cl	6-Cl
2-Cl, 4-Cl	6-Cl
2-Cl, 5-Cl	6-Cl
2-Cl, 6-Cl	6-Cl
2-Cl	6-Cl
2-OCF ₃	6-Cl
2-F, 6-F	6-Cl
2-CH ₂ CH ₂ CF ₃	6-Cl
2-COOCH ₃ , 6-F	6-Cl
2-COOCH ₃ , 6-OCH ₃	6-Cl
2-F	6-Cl
2-OCF ₃ , 6-F	6-Cl
2-OCH ₂ CH ₂ CF ₃	6-Cl
2-SO ₂ CH ₃	6-Cl

]、

以下の式 (XC) で表される化合物、



(XC)

[式中、 X_n と Y_m は、以下の X_n と Y_m の各組み合わせから選択される。

10

20

30

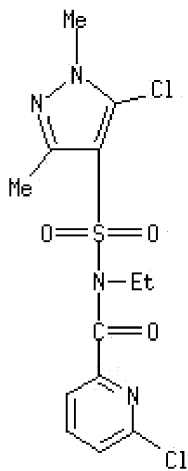
40

50

$\underline{X}_n$	$\underline{Y}_m$
$\underline{2-CF_3}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2-CH_3}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2-COOCH_3}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2,3-Cl_2}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2,4-Cl_2}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2,5-Cl_2}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2,6-Cl_2}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2-Cl}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2-OCF_3}$	$\underline{6-Cl}$
$\underline{2,6-F_2}$	$\underline{6-Cl}$

10

]、
並びに



20

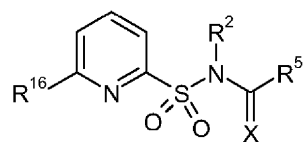
30

で表される化合物を除く。) 。

【請求項 10】

式 (XIV) :

【化 11】



(XIV)

40

[式中、

R^{16} はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり、そして

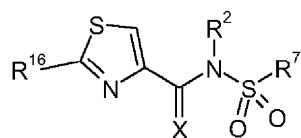
X、 R^2 および R^5 は、各々、請求項 1 に定義された通りである。]

の化合物。

【請求項 11】

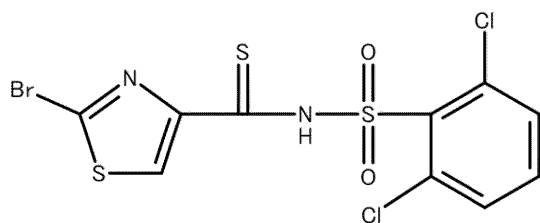
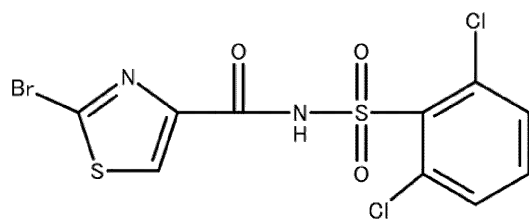
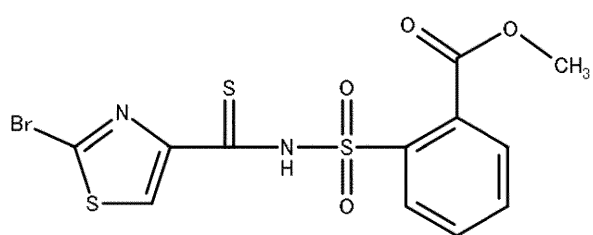
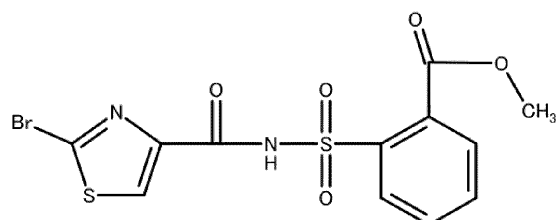
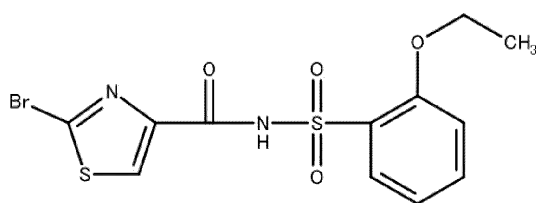
式 (XV) :

【化 1 2】



(XV)

[式中、 R^{16} はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり、そして
 X 、 R^2 および R^7 は、各々、請求項 1 に定義された通りである。]
の化合物（ただし、以下の化合物

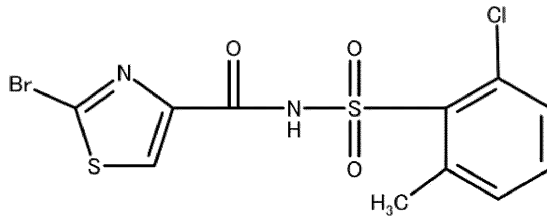


10

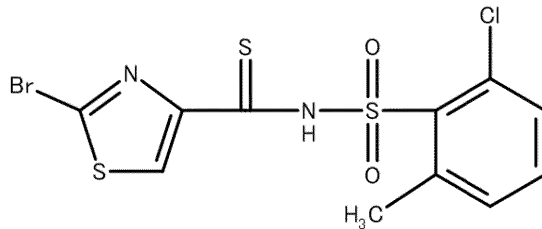
20

30

40



および



10

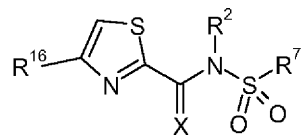
を除く。) 。

【請求項 1 2】

式 (XVI) :

【化 1 3】

20



(XVI)

[式中、 R^{16} はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり、そして

X 、 R^2 および R^7 は、各々、請求項 1 に定義された通りである。]

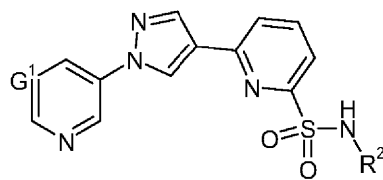
の化合物。

【請求項 1 3】

30

式 (XVII) :

【化 1 4】



(XVII)

[式中、

G^1 は窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-アルキル、C-シクロアルキルまたはC-アルコキシであり、そして

R^2 は請求項 1 で定義された通りである。]

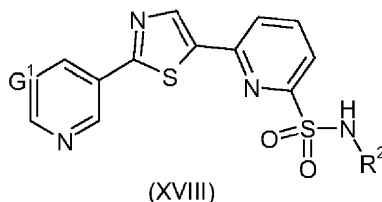
の化合物。

【請求項 1 4】

式 (XVIII) :

40

【化 1 5】



〔式中、

G¹ は窒素、C－ハロゲン、C－シアノ、C－ニトロ、C－アルキル、C－シクロアルキルまたはC－アルコキシであり、そして

R² は請求項 1 で定義された通りである。〕

の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、新規な複素環化合物、その調製方法、および節足動物および、特に昆虫を含む動物有害生物を防除するためのその使用、および該複素環化合物の調製のための中間体にも関する。

【背景技術】

【0002】

特別なチアゾリル、チアジアゾリルおよびピラゾリル化合物は、既に、殺虫活性成分として知られている（国際公開第 2010/006713 号パンフレット参照）。

【0003】

現在の作物保護組成物は、例えば、それらの作用のレベル、持続および幅、および可能な使用に関して、多くの要求を満足しなければならない。毒性の、および他の有効成分または製剤補助剤との適合性の問題は、有効成分の合成が必要とする出費の問題がそうであるように、役割を果たしている。加えて、耐性が起こり得る。全てのこれらの理由で、新規な作物保護組成物のサーチは完全であるとは考えることができず、公知の化合物と比較して、少なくとも個々の局面に関して改良された特性を有する新規な化合物に対して一定の要望が存在する。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献 1】 国際公開第 2010/006713 号パンフレット

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0005】

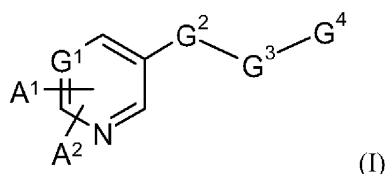
本発明の目的は、種々の点において有害生物防除剤のスペクトルを広げる化合物を提供することにある。

【0006】

本目的、および明示的には述べられていないが、本明細書中で議論される関係から認識でき、または誘導できるさらなる目的が式 (I)：

【0007】

【化 1】



10

20

30

40

50

[式中、

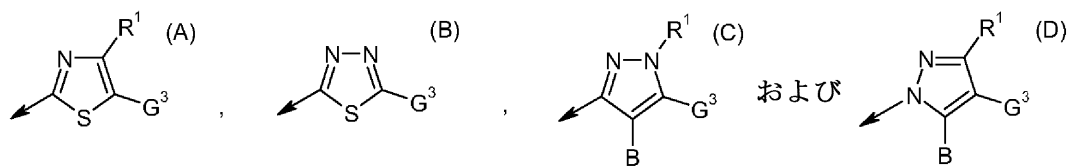
A^1 および A^2 は、各々、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、シクロアルキルまたはアルコキシであり、

G^1 はNまたはC- A^1 であって、

G^2 は、

【0008】

【化2】



10

(式中、矢印は、各場合において隣接する環への結合を示し、

R^1 は、複素環 (A) および (D) の場合には、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオまたはハロアルキルであり、および

R^1 は、複素環 (C) の場合には、水素、アルキルまたはハロアルキルであり、

Bは水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオまたはアルコキシであり、および

20

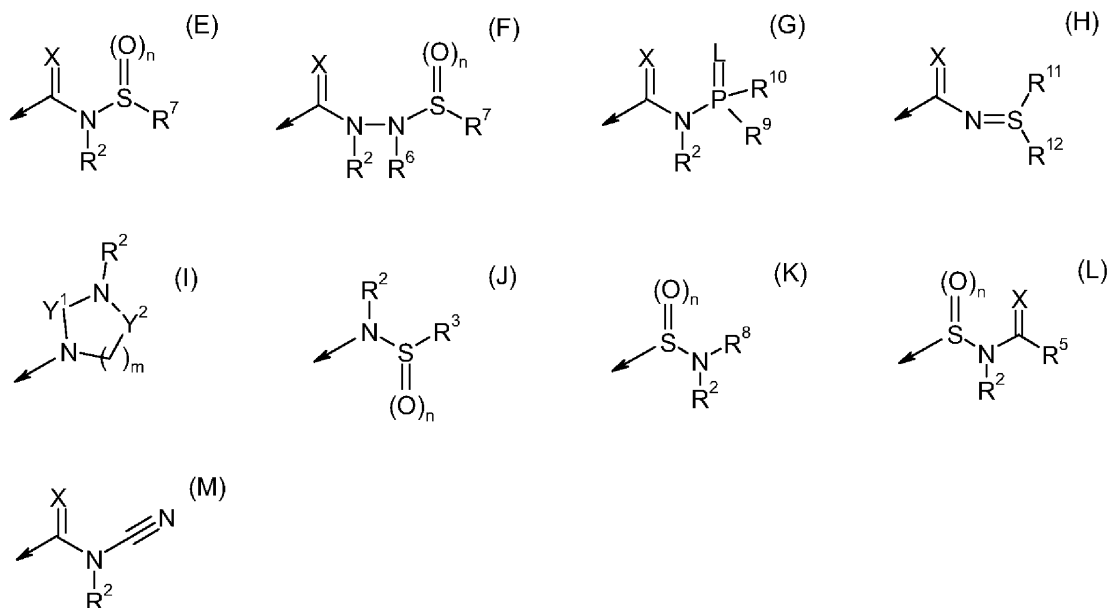
G^3 は置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいヘテロアリアルまたは置換されていてもよいアリアルである。)

の群からの基であり、および

G^4 は、

【0009】

【化3】



30

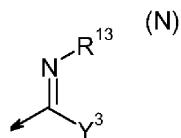
40

の群からの基であり、

および複素環 (A)、(B) および (C) の場合には、基：

【0010】

【化 4】



でもあり、

(式中、矢印は、各場合において、 G^3 への結合を示し、

X は酸素または硫黄であり、

n は 1 または 2 であり、

R^2 は水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルケニル、アルキニルおよびアルコキシアルキル、各場合において、ハロゲンで置換されていてもよいアルキルカルボニルおよびアルキルスルホニル、各場合において、ハロゲンで置換されていてもよいアルコキシカルボニル、各場合において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロアルキルおよびシアノで置換されていてもよいシクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば、一価または二価金属イオン、またはアルキルまたはアリールアルキルで置換されていてもよいアンモニウムイオンの群からの基であり、

R^3 および R^7 は、各々、独立して、各場合において、置換されていてもよいアルキル、アルケニルおよびアルキニル、各場合において、置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていてもよいアミノ基の群からの基であり、

R^2 および R^3 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 員から 8 員の環を形成してもよく、

R^5 は、各場合において、置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合において、置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、および置換されていてもよいアミノ基の群からの基であり、

R^8 は水素、各場合において、置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル、各場合において、置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびシクロアルケニル、ここに該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、置換されていてもよいアリール、ヘテロアリールアリールアルキルおよびヘテロアリールアルキル、および置換されていてもよいアミノ基の群からの基であり、

R^2 および R^5 は、それらが結合している $N-C(X)$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここに酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい 4 員から 8 員の環を形成してもよく、

R^6 は水素またはアルキルであり、

R^2 および R^6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、硫黄、酸素（ここに酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 つのさらな

10

20

30

40

50

るヘテロ原子および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい4員から8員の環を形成してもよく、

基(E)における R^2 および R^7 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素(ここに酸素原子は直ぐに隣接してはならない)および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい4員から8員の環を形成してもよく、

R^6 および R^7 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素(ここに酸素原子は直ぐに隣接してはならない)および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい4員から8員の環を形成してもよく、

R^2 および R^8 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、硫黄、酸素(ここに酸素原子は直ぐに隣接してはならない)および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和の置換されていてもよい4員から8員の環を形成してもよく、

Lは酸素または硫黄であり、

R^9 および R^{10} は、各々、独立して、各場合において、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオの群からの置換されていてもよい基であり、

R^9 および R^{10} は、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、酸素(ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない)および硫黄の群からの1または2のヘテロ原子を含有してもよい飽和または不飽和の置換されていてもよい5員から7員の環を形成してもよく、および

R^{11} および R^{12} は、各々、独立して、各場合において、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルの群からの置換されていてもよい基であり、

Y^1 および Y^2 は、各々、独立して、 $C=O$ または $S(O)_2$ であり、

mは1、2、3または4であり、

R^{13} は水素、アルキル、ハロアルキル、シアノ、シアノアルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、シアノアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シアノアルキニル、アルキルカルボニルおよびアルコキシカルボニルの群からの基であり、

Y^3 はアルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、および R^{14} および R^{15} が、各々、独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロアルキル、シアノ、シアノアルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、シアノアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、シアノアルキニル、アルキルカルボニルおよびアルコキシカルボニルの群からの基であるか、あるいは R^{14} および R^{15} が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロ原子を含有してもよい置換されていてもよい飽和または不飽和の5員から8員の環を形成してもよい $NR^{14}R^{15}$ の群からの基である。)]

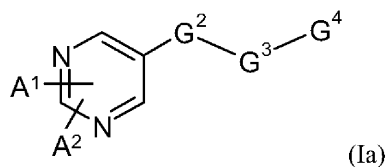
G^3 および G^4 は、加えて、一緒にあって、酸素、窒素および硫黄の群からの1以上のさらなるヘテロ原子を含有してもよい置換されていてもよい複素環を形成してもよい。]の新規な化合物、および式(I)の化合物の塩およびN-オキシドによって達成される。

【0011】

G^1 がNである場合、式(Ia)の化合物がかくして得られ、

【0012】

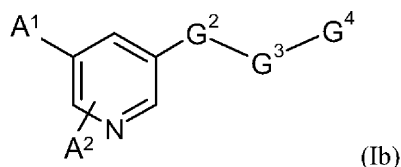
【化 5】



および G^1 が $C-A^1$ である場合、式 (I b) :

【0013】

【化 6】



10

[式中、残りの置換基は各々先に定義された通りである。]
の化合物が得られる。

【0014】

加えて、式 (I) の化合物は以下に記載されたプロセスによって得ることができること

20

【0015】

G^4 基に依存して、式 (I) の化合物はサブ構造 (I_E) から (I_M) に分割することができる。

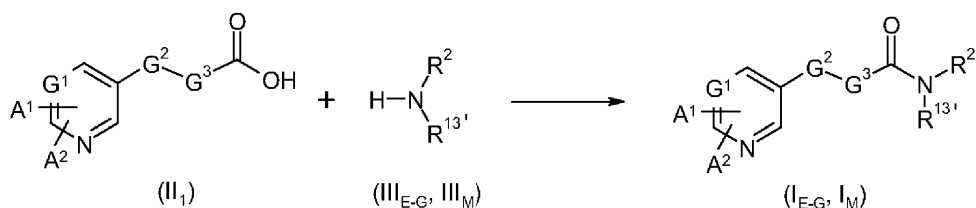
【0016】

式 (I_{E-G} , I_M) の化合物は、例えば、式 (II_1) のカルボン酸またはその酸塩化物を式 (III_{E-G} , III_M) のアミン誘導体と反応させることによって調製することができる。

【0017】

【化 7】

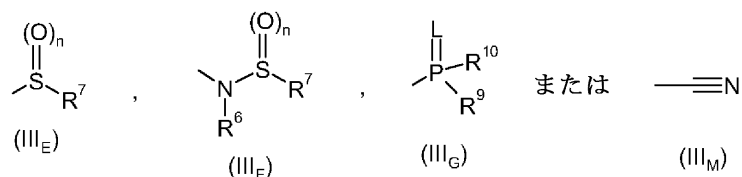
30



[式中、 $R^{13'}$ は

【0018】

【化 8】



40

である。]

式 (I_1) の化合物は、例えば、式 (II_2) のアミンから、後に詳細に説明するように調製することができる。

【0019】

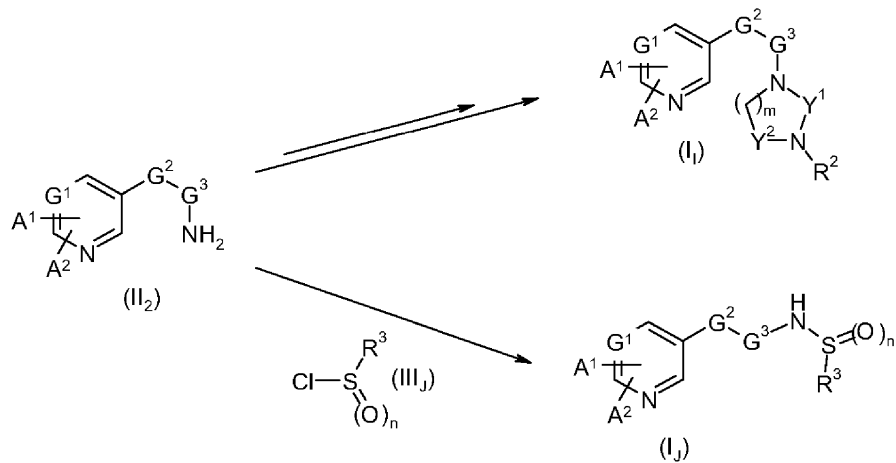
式 (I_J) の化合物は、例えば、式 (II_2) の複素環アミンを式 (III_J) の塩化

50

スルホニルと反応させることによって調製することができる。

【0020】

【化9】



10

式 (I_K) の化合物は、例えば、式 (I I₃) の塩化スルホニルを式 (I I I_K) のアミンと反応させることによって調製することができる。

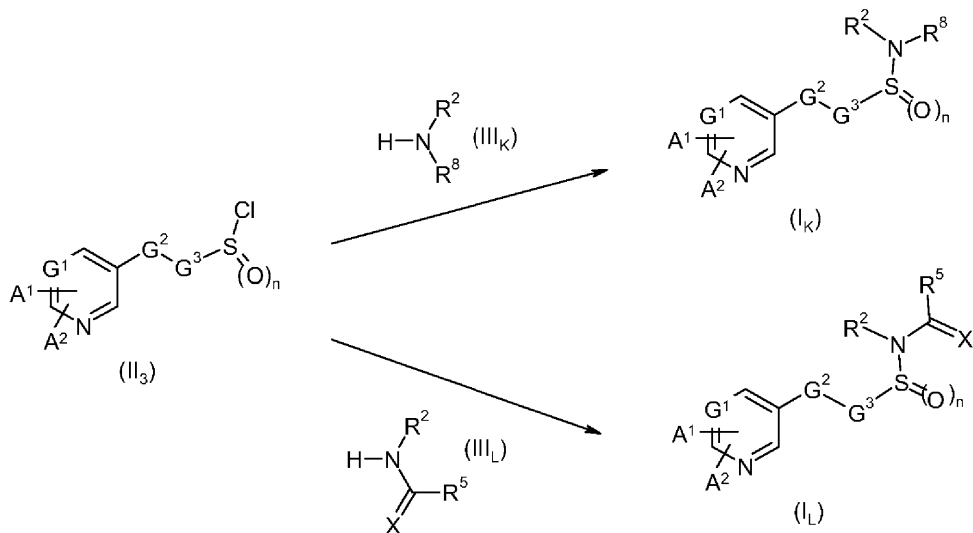
【0021】

式 (I_L) の化合物は、例えば、式 (I I₃) の塩化スルホニルを式 (I I I_L) のアミドと反応させることによって調製することができる。

20

【0022】

【化10】



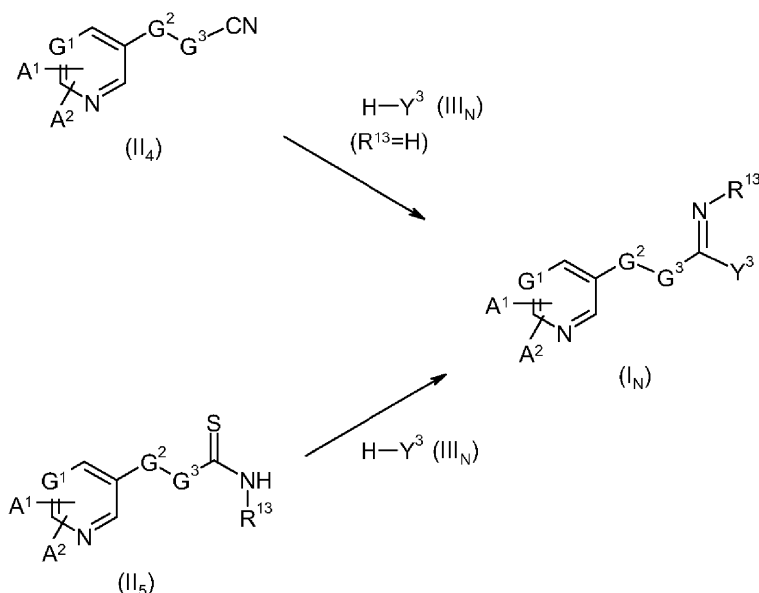
30

式 (I_N) の化合物は、例えば、式 (I I₄) のニトリルまたは式 (I I₅) のチオアミドを式 (I I I_N) のオキシ、チオまたはアミノ誘導体と反応させることによって調製することができる。

40

【0023】

【化 1 1】



10

最後に、式（I）の新たな化合物は非常に顕著な生物学的特性を有し、および特に、農業において、森林において、貯蔵した産物および材料の保護において、および衛生部門において遭遇する、動物害虫、特に昆虫、クモ形節足動物および線虫を防除するのに適していることが判明した。

20

【0024】

一般式（I）の化合物は、適切な場合には、置換基の性質に応じて、異なる組成物において、幾何および／または光学的に活性な異性体または対応する異性体混合物の形態であってよい。当該発明は純粋な異性体および異性体の混合物の双方に関する。

【0025】

本発明の化合物は、例えば、独国特許第2221647号明細書に他のアミドについて記載されているように、金属錯体として存在させることもできる。

【0026】

式（I）の化合物で示された基についての好ましい置換基または範囲は以下で明らかにする。

30

【0027】

A¹ および A² は、各々、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルまたは C₁ - C₆ - アルコキシである。

【0028】

G¹ は N または C - A¹ である。

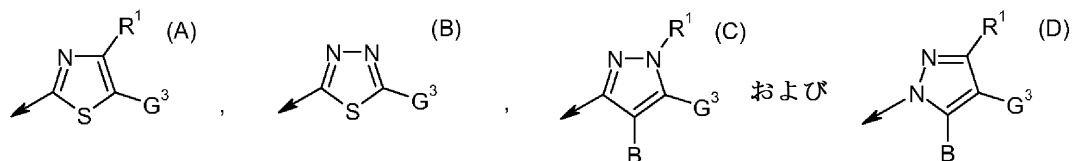
【0029】

G² は

【0030】

【化 1 2】

40



[式中、矢印は隣接する環への結合を示す。]
の群からの基である。

【0031】

R¹ は、複素環（A）および（D）の場合には、水素、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆

50

ーアルキル、 C_1-C_6 ーアルコキシまたは C_1-C_6 ーハロアルキルである。

【0032】

R^1 は、複素環 (C) の場合には、水素、 C_1-C_6 ーアルキルまたは C_1-C_6 ーハロアルキルである。

【0033】

B は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 ーアルキル、 C_1-C_6 ーハロアルキル、 C_1-C_6 ーアルコキシまたは C_3-C_6 ーシクロアルキルである。

【0034】

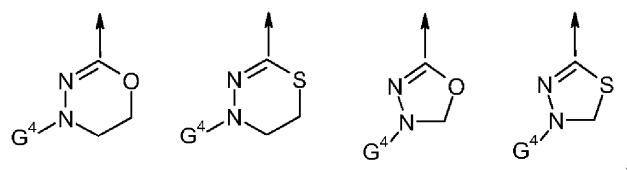
G^3 は、各場合において、ハロゲンー、シアノー、ニトロー、アミノー、 C_1-C_6 ーアルキルアミノー、ジ (C_1-C_6) ーアルキルアミノー、 C_1-C_6 ーアルキルー、 C_3-C_6 ーシクロアルキルー、 C_1-C_6 ーハロアルキルー、ヒドロキシルー、 C_1-C_6 ーアルコキシー、 C_1-C_6 ーハロアルコキシー、 C_1-C_6 ーアルキルチオー、 C_1-C_6 ーアルキルカルボニルー、 C_1-C_6 ーアルコキシカルボニルー、 C_2-C_6 ーアルケニルーまたは C_2-C_6 ーアルキニルーで置換されていてもよい5員のヘテロアリールまたは6員のヘテロアリールであり； G^3 は、特に、各場合において、ハロゲンー、シアノー、ニトロー、アミノー、 C_1-C_6 ーアルキルアミノー、ジ (C_1-C_6) ーアルキルアミノー、 C_1-C_6 ーアルキルー、 C_3-C_6 ーシクロアルキルー、 C_1-C_6 ーハロアルキルー、ヒドロキシルー、 C_1-C_6 ーアルコキシー、 C_1-C_6 ーハロアルコキシー、 C_1-C_6 ーアルキルチオー、 C_1-C_6 ーアルキルカルボニルー、 C_1-C_6 ーアルコキシカルボニルー、 C_2-C_6 ーアルケニルーまたは C_2-C_6 ーアルキニルーで置換されていてもよいピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはトリアジニル、および加えて、ハロゲンー、シアノー、ニトロー、アミノー、 C_1-C_6 ーアルキルアミノー、ジ (C_1-C_6) ーアルキルアミノー、 C_1-C_6 ーアルキルー、 C_3-C_6 ーシクロアルキルー、 C_1-C_6 ーハロアルキルー、ヒドロキシルー、 C_1-C_6 ーアルコキシー、 C_1-C_6 ーハロアルコキシー、 C_1-C_6 ーアルキルチオー、 C_1-C_6 ーアルキルカルボニルー、 C_1-C_6 ーアルコキシカルボニルー、 C_2-C_6 ーアルケニルーまたは C_2-C_6 ーアルキニルーで置換されていてもよいフェニルであり、

および G^4 が基 (E)、(F)、(G)、(H)、(K)、(L) および (M) のうちの1つである場合、

G^3 はハロゲンー、シアノー、ニトロー、アミノー、 C_1-C_6 ーアルキルアミノー、ジ (C_1-C_6) ーアルキルアミノー、 C_1-C_6 ーアルキルー、 C_3-C_6 ーシクロアルキルー、 C_1-C_6 ーハロアルキルー、ヒドロキシルー、 C_1-C_6 ーアルコキシー、 C_1-C_6 ーハロアルコキシー、 C_1-C_6 ーアルキルチオー、 C_1-C_6 ーアルキルカルボニルー、 C_1-C_6 ーアルコキシカルボニルー、 C_2-C_6 ーアルケニルーまたは C_2-C_6 ーアルキニルーで置換されていてもよい5員のヘテロシクリルまたは6員のヘテロシクリルであってもよく； G^3 は、その場合、特に、

【0035】

【化13】



[式中、各場合における矢印は G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。]

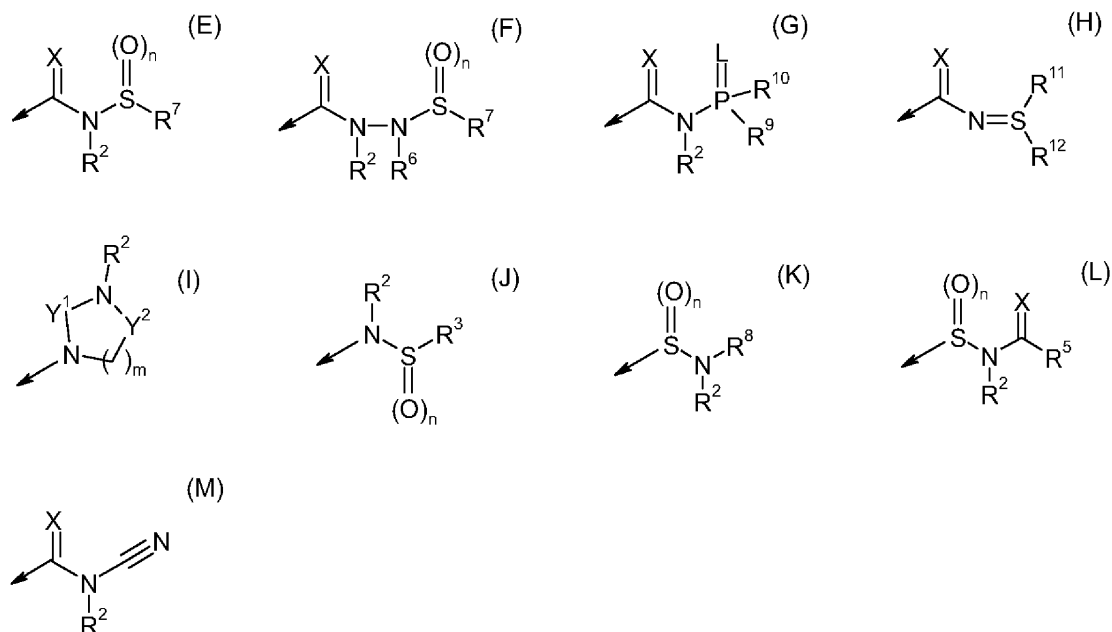
の群からの基である。

【0036】

G^4 は

【0037】

【化 1 4】



10

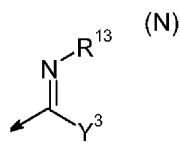
の群からの基であり、

20

および複素環 (A)、(B) および (C) の場合には、基：

【0038】

【化 1 5】



[式中、矢印は G³ への結合を示す。]

30

でもある。

【0039】

Xは酸素または硫黄である。

【0040】

nは1または2である。

【0041】

R²は、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、シアノ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、各場合において、ハロゲンで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキルカルボニルおよび C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルキルおよびシアノで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば、Na⁺ および K⁺ のような一価または二価金属イオン、または C₁ - C₆ - アルキルまたはアリール - C₁ - C₆ - アルキルで置換されていてもよいアンモニウムイオンの群からの基である。

40

【0042】

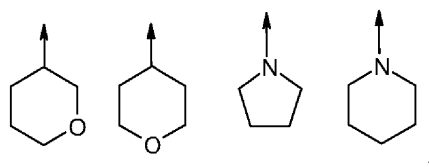
R³ および R⁷ は、各々、独立して、各場合において、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル

50

スルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルおよび C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニルで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素（特に、

【0043】

【化16】



10

[式中、各場合における矢印は基(E)、(F)および(J)における硫黄原子への結合を示す。]) の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン、(アルキル部位におけるのを含めた)シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニルで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキル、または $R'R''$ が、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルの群からの基である $NR'R''$ の群からの基である。

20

30

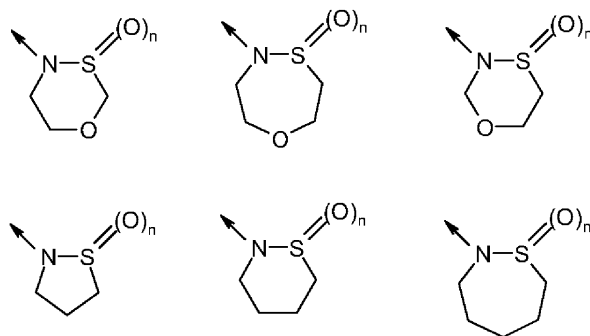
【0044】

R^2 および R^3 は、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、飽和または不飽和であってハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい5から7員の環を形成してもよく、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素および/または少なくとも1つのカルボニル基の群からの1以上のさらなるヘテロ原子を含有してもよく； R^2 および R^3 は、特に、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒にあって、

40

【0045】

【化 17】



10

(式中、矢印は、再度、各場合において、 G^3 への結合を示す。) の群からの基であってよい。

【0046】

R^5 は、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルまたは C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニルで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニル、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素(ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない)および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン、(アルキル部位におけるものを含めた)シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニルで置換されてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキル、または R' および R'' が、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルである $NR'R''$ の群からの基である。

20

30

40

【0047】

R^8 は水素、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルまたは C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニルで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルケニル、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキ

50

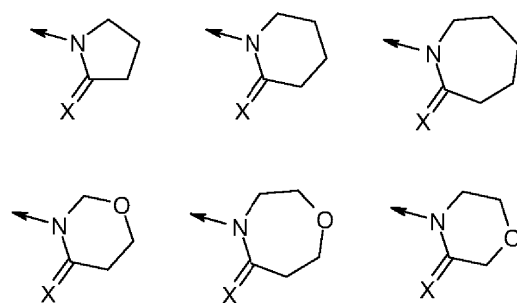
ル- C_1-C_6 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接するものであってはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン-、（アルキル部位におけるものを含めた）シアノー、ニトロ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオール-、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオール-、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_6 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル-、 C_2-C_6 -アルケニル-、 C_2-C_6 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_6 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキル、または R' および R'' が、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_6 -アルコキシカルボニルである $NR'R''$ の群からの基である。

【0048】

R^2 および R^5 は、それらが結合している $N-C(X)$ 基と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子、および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい5員から7員の環を形成してもよく； R^2 および R^5 は、特に、それらが結合している $N-C(X)$ 基と一緒にあって、

【0049】

【化18】



（式中、矢印は、各場合において、基（L）中の硫黄原子への結合を示す。）の群からの基であってよく、

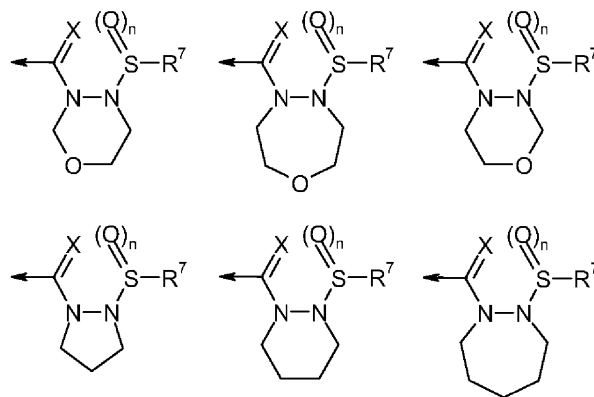
R^6 は水素または C_1-C_6 -アルキルである。

【0050】

R^2 および R^6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのさらなるヘテロ原子、および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい5員から7員の環であってよく； R^2 および R^6 は、特に、それらが結合している $N-N$ 基と一緒にあって、

【0051】

【化 1 9】



10

(式中、全基 (F) が描かれ、および矢印は、再度、各場合において、 G^3 への結合を示す。)

の群からの基であってもよい。

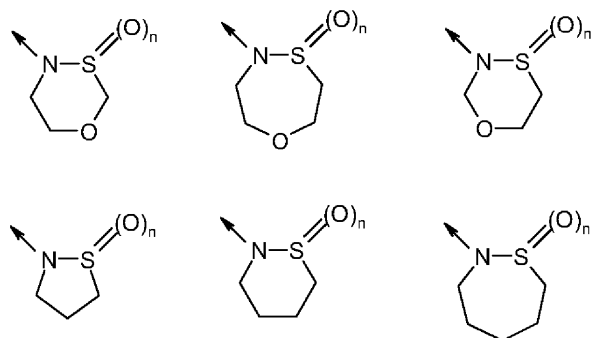
【0052】

R^2 および R^7 もまた、 G^3 が (E) である場合、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、硫黄、酸素 (ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子、および/または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい 5 員から 7 員の環を形成してもよく; R^2 および R^7 は、特に、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、

20

【0053】

【化 2 0】



30

(式中、矢印は、各場合において、 $C(X)$ 基への結合を示す。)

の群からの基であってよい。

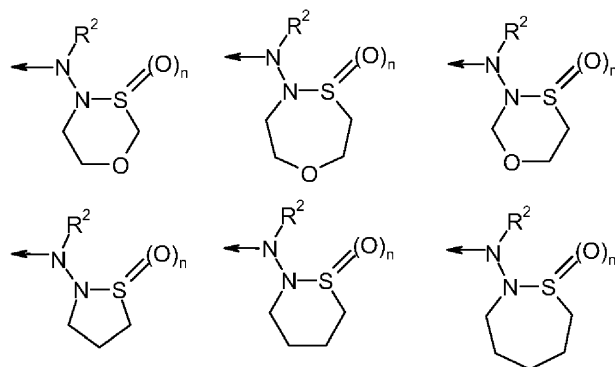
【0054】

R^6 および R^7 もまた、 G^3 が (F) である場合、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、硫黄、酸素 (ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上のさらなるヘテロ原子、および/または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい 5 員から 7 員の環で形成してもよく; R^6 および R^7 は、特に、それらが結合している $N-S(O)_n$ 基と一緒に、

40

【0055】

【化 2 1】



10

(式中、 $N-R^2$ 基も示され、および矢印は、各場合において、 $C(X)$ 基への結合を示す。)

の群からの基であってよい。

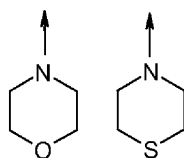
【0056】

R^2 および R^8 もまた、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの1以上のさらなるヘテロ原子、および／または少なくとも1つのカルボニル基を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよい5員から7員の環を形成してもよく； R^2 および R^8 は、特に、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、

20

【0057】

【化 2 2】



30

(式中、矢印は、各場合において、基 (K) 中の硫黄原子への結合を示す。)

の群からの基であってよい。

【0058】

L は酸素または硫黄である。

【0059】

R^9 および R^{10} は、各々、独立して、各場合において、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルケニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_2-C_6 -アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリール- C_1-C_6 -アルコキシおよびヘテロアリール- C_1-C_6 -アルキルチオの群からのハロゲンで置換されていてもよい基である。

40

【0060】

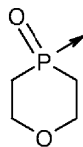
R^9 および R^{10} もまた、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および硫黄の群からの1または2つのヘテロ原子を含有してもよい、飽和または不飽和のハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキ

50

シーで置換されていてもよい5員から7員の環を形成してもよく； R^9 および R^{10} は、特に、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、基

【0061】

【化23】



(式中、矢印は基 (G) 中の窒素原子への結合を示す。) であってよい。

【0062】

R^{11} および R^{12} は、各々、独立して、各場合において、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、フェニルおよびフェニル- C_1-C_6 -アルキルの群からのハロゲン-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい基である。

【0063】

Y^1 および Y^2 は、各々、独立して、 $C=O$ または $S(O)_2$ である。

【0064】

m は 1、2、3 または 4 である。

【0065】

R^{13} は水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルチオ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -シアノアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_2-C_6 -シアノアルキニル、 C_1-C_7 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_7 -アルコキシカルボニルの群からの基である。

【0066】

Y^3 は C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、および R^{14} および R^{15} が、各々、独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_6 -シアノアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルチオ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -シアノアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_2-C_6 -シアノアルキニル、 C_1-C_7 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_7 -アルコキシカルボニルの群からの基である $NR^{14}R^{15}$ の群からの基であり；または R^{14} および R^{15} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの 1 以上のさらなる原子、および／または少なくとも 1 つのカルボニル基を含有してもよいハロゲン-、シアノ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_3-C_8 -シクロアルキル-または C_1-C_6 -アルキルチオ-置換されていてもよい飽和または不飽和の 5 員から 8 員の環であり； R^{14} および R^{15} は、特に、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、

【0067】

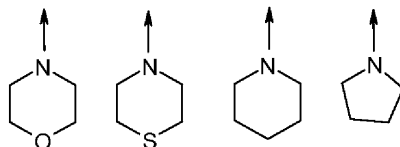
10

20

30

40

【化 2 4】



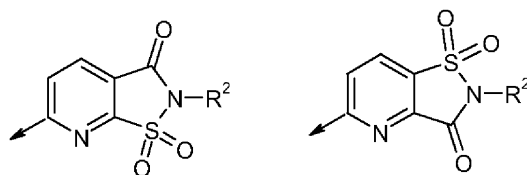
(式中、矢印は、各場合において、(N)基における炭素原子への結合を示す。)の群からの基であってよい。

【0068】

G³ および G⁴ は、加えて、一緒になって、酸素、窒素および硫黄の群からのさらなるヘテロ原子を含有してもよい置換されていてもよい複素環を形成してもよく；G³ および G⁴ は、特に、

【0069】

【化 2 5】



(式中、矢印はG²への結合を示す。)の群からの二環を形成してもよい。

【0070】

式(I)の化合物に示された基についての特に好ましい置換基または範囲は以下に明らかにする。

【0071】

A¹ は水素、ハロゲンまたはシアノであり、および A¹ は、特に、水素、フッ素および塩素の群からの基である。

【0072】

A² は水素である。

【0073】

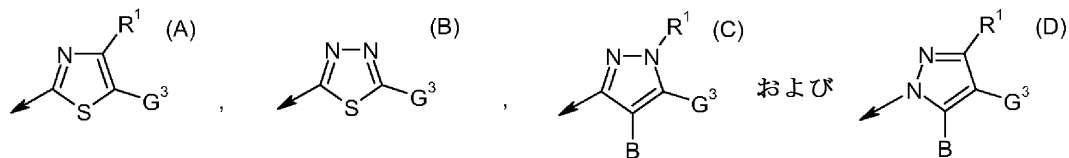
G¹ はNまたはC-A¹である。

【0074】

G² は、

【0075】

【化 2 6】



(式中、矢印は隣接する環への結合を示す。)の群からの基である。

【0076】

R¹ は水素またはC₁-C₄-アルキルであって、R¹ は特に水素またはメチルである。

【0077】

Bは水素である。

【0078】

G³ は、各場合において、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁-C₆-

10

20

30

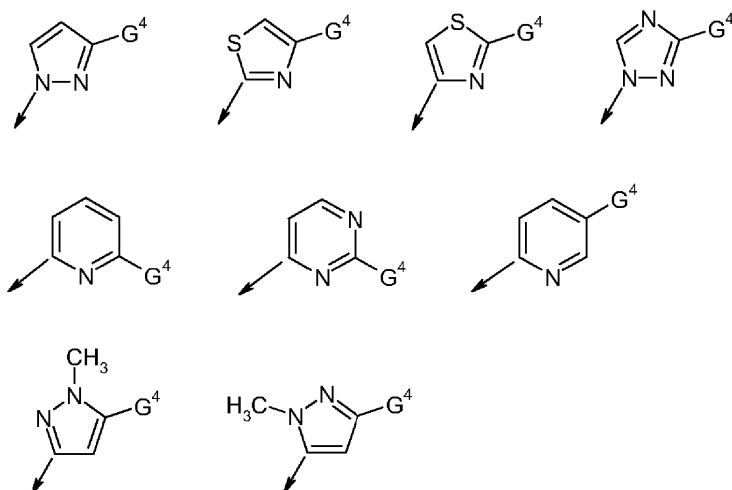
40

50

アルキルアミノー、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノー、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、ヒドロキシル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニル-または C_2-C_6 -アルキニル-で置換されていてもよい5員のヘテロアリアルまたは6員のヘテロアリアルであり； G^3 は、特に、ハロゲン-、シアノー-、ニトロ-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、ヒドロキシル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニル-または C_2-C_6 -アルキニル-で置換されていてもよいピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはトリアジニルであり； G^3 は、強調すると、

【0079】

【化27】



(式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。)

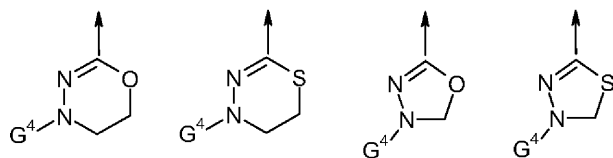
の群からのハロゲン-、シアノー-、メチル-、メトキシ-、トリフルオロメチル-、アミノ-またはジメチルアミノ-で置換されていてもよい基、および加えて、ハロゲン-、シアノー-、ニトロ-、アミノ-、 C_1-C_6 -アルキルアミノ-、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノ-、 C_1-C_6 -アルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_6 -ハロアルキル-、ヒドロキシル-、 C_1-C_6 -アルコキシ-、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_6 -アルキルチオ-、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニルまたは C_2-C_6 -アルキニル-で置換されていてもよいフェニルであり、

および G^4 が基(E)および(L)のうちの1つである場合、

G^3 もまた、

【0080】

【化28】



(式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために

示される。)

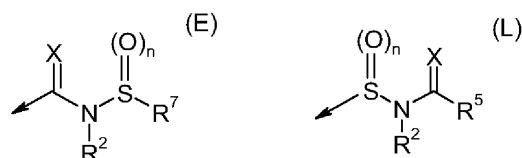
の群からの、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_6)-アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 -アルケニルまたは C_2-C_6 -アルキニルで置換されていてもよい5員のヘテロシクリルまたは6員のヘテロシクリルであってよい。

【0081】

G^4 は

【0082】

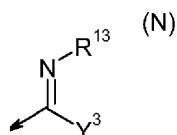
【化29】



の群からの基であり、および複素環 (A)、(B)、および (C) の場合には、基

【0083】

【化30】



(式中、矢印は、各場合において、 G^3 への結合を示す。)
の基でもある。

【0084】

Xは酸素である。

【0085】

nは2である。

【0086】

R^2 は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、シアノ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルカルボニルまたは C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニル、または、カチオン、例えば、一価または二価金属イオンまたは C_1-C_4 -アルキルまたはアリール- C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよいアンモニアの群からの基； R^2 は、特に、水素、メチル、エチル、 CH_2OCH_3 、 $CH_2OCH_2CH_3$ 、 $COCH_3$ 、 $COCH_2CH_3$ 、シクロプロピル、 Na^+ 、 K^+ および $^+N(CH_3)_4$ の群からの基である。

【0087】

R^5 は、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルおよび C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニルで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合において、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ置換されていてもよい C_3-C

10

20

30

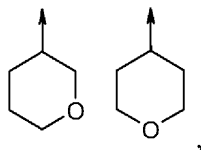
40

50

C_6 －シクロアルキル、 C_3 － C_6 －シクロアルキル－ C_1 － C_4 －アルキルおよび C_3 － C_4 －シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく（特に、

【0088】

【化31】



10

[式中、矢印は、各場合において、基（L）中の炭素原子への結合を示し]）、各場合において、ハロゲン－、（アルキル部位におけるものを含めた）シアノー、ニトロ－、 C_1 － C_4 －アルキル－、 C_1 － C_4 －ハロアルキル－、 C_3 － C_6 －シクロアルキル－、 C_1 － C_4 －アルコキシ－、 C_1 － C_4 －ハロアルコキシ－、 C_1 － C_4 －アルキルチオ－、 C_1 － C_4 －ハロアルキルチオ－、 C_1 － C_4 －アルキルスルフィニル－、 C_1 － C_4 －ハロアルキルスルフィニル－、 C_1 － C_4 －アルキルスルホニル－、 C_1 － C_4 －ハロアルキルスルホニル－、アミノ－、 C_1 － C_4 －アルキルアミノ－、ジ（ C_1 － C_4 －アルキル）アミノ－、 C_1 － C_4 －アルキルカルボニルアミノ－、 C_1 － C_4 －アルコキシカルボニルアミノ－、 C_1 － C_4 －アルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキル－、 C_1 － C_4 －ハロアルコキシ－ C_1 － C_4 －アルキル－、 C_2 － C_4 －アルケニル－、 C_2 － C_4 －アルキニル－、 C_3 － C_6 －シクロアルキル－ C_1 － C_4 －アルキル－、 C_1 － C_4 －アルキルカルボニル－、 C_1 － C_4 －アルコキシカルボニル－またはアミノカルボニル－で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール－ C_1 － C_4 －アルキルおよびヘテロアリール－ C_1 － C_4 －アルキル、または R' および R'' は、各々、独立して、水素および C_1 － C_4 －アルキルの群からの基である $NR'R''$ の群からの基であり、および R^5 は、特に、メチル、エチル、*i*－プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。

20

【0089】

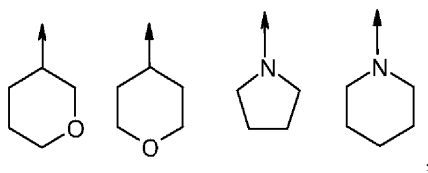
30

R^7 は、各場合において、ハロゲン－、 C_1 － C_4 －アルコキシ－、 C_1 － C_4 －ハロアルコキシ－、 C_1 － C_4 －アルキルチオ－、 C_1 － C_4 －ハロアルキルチオ－、 C_1 － C_4 －アルキルスルフィニル－、 C_1 － C_4 －ハロアルキルスルフィニル－、 C_1 － C_4 －アルキルスルホニル－および C_1 － C_4 －ハロアルキルスルホニル－で置換されていてもよい C_1 － C_4 －アルキル、 C_2 － C_4 －アルケニルおよび C_2 － C_4 －アルキニル、各場合において、ハロゲン－、 C_1 － C_4 －アルキル－、 C_1 － C_4 －ハロアルキル－、 C_1 － C_4 －アルコキシ－、 C_1 － C_4 －ハロアルコキシ－で置換されていてもよい C_3 － C_6 －シクロアルキル、 C_3 － C_6 －シクロアルキル－ C_1 － C_4 －アルキルおよび C_3 － C_4 －シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素（および特に、

40

【0090】

【化32】



[式中、矢印は、各場合において、基（E）中の硫黄原子への結合を示す。]）の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン－、（アルキル部位におけるものを含めた）シアノー、ニトロ－、 C_1 － C_4 －アルキル－

50

、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニルで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル、または R' および R'' が、各々、独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルの群からの基である $NR'R''$ の群からの基であり、および R^7 は、特に、メチル、エチル、i-プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。

10

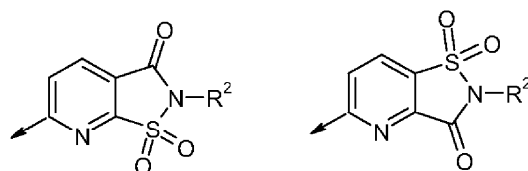
【0091】

G^3 および G^4 は、加えて、酸素、窒素および硫黄の群からのさらなるヘテロ原子を含有してもよい置換されていてもよい複素環を形成してもよく； G^3 および G^4 は、特に、

20

【0092】

【化33】



(式中、矢印は G^2 への結合を示す。)の群からの二環を形成してもよい。

30

【0093】

R^{13} は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シクロアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基である。

【0094】

Y^3 は C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、および R^{14} および R^{15} が、各々、独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基である $NR^{14}R^{15}$ の群からの基であり、または R^{14} および R^{15} はそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲ

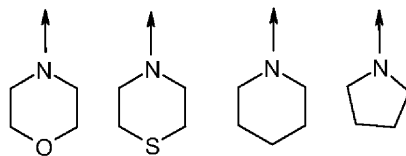
40

50

ンー、シアノー、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルまたは C_1-C_4 -アルキルチオーで置換されていてもよい、硫黄、酸素および窒素の群からのさらなる原子および／または1つのカルボニル基を含有してもよい飽和または不飽和の5員から8員の環であり； R^{1-4} および R^{1-5} は、特に、それらが結合している窒素原子と一緒に、

【0095】

【化34】



10

(式中、矢印は、各場合において、(N)基中の炭素原子への結合を示す。)の群からの基であってよい。

【0096】

式(I)の化合物で示された非常に特に好ましい置換基または基の範囲を以下に明らかにする。

【0097】

A^1 は水素、フッ素および塩素の群からの基である。

【0098】

A^2 は水素である。

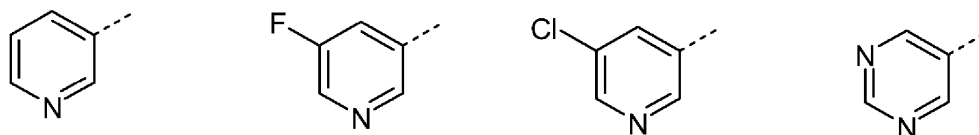
20

【0099】

G^1 はNまたは $C-A^1$ であり、これは、以下の構造エレメント：

【0100】

【化35】



30

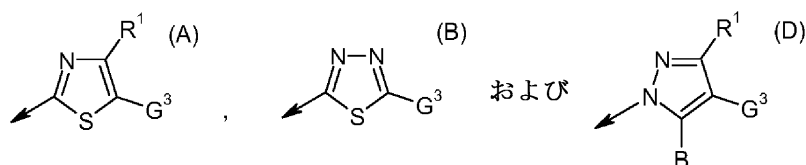
(式中、破線は G^2 への結合を意味する。)を含有する化合物に導く。

【0101】

G^2 は、

【0102】

【化36】



40

(式中、矢印は、各場合において、隣接する環への結合を示す。)の群からの基である。

【0103】

R^1 は水素またはメチルである。

【0104】

Bは水素である。

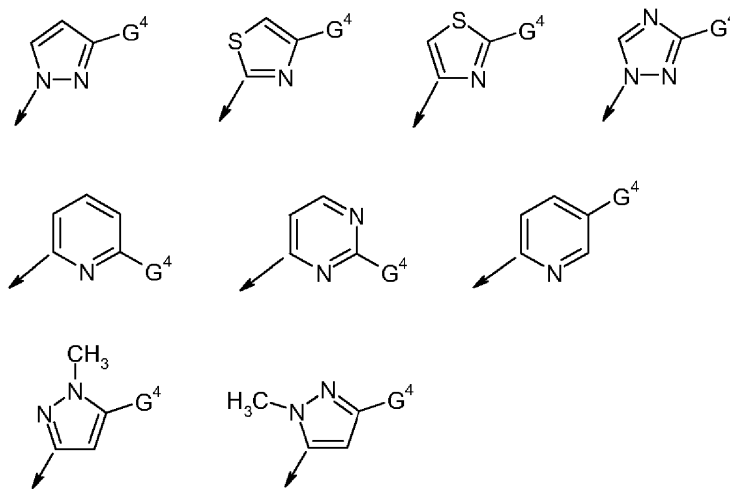
【0105】

G^3 は、

【0106】

50

【化 3 7】



10

(式中、矢印は、各場合において、 G^2 への結合を示し、および G^4 もまた説明のために示される。)

の群からの、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、アミノまたはジメチルアミノで置換されていてもよい基である。

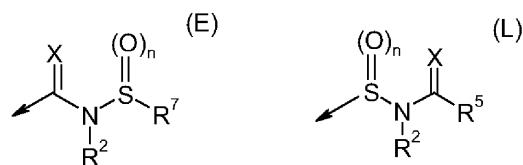
【0107】

20

G^4 は、

【0108】

【化 3 8】

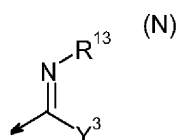


の群からの基であり、および、複素環 (A) および (B) の場合には、基

【0109】

30

【化 3 9】



(式中、矢印は、各場合において、 G^3 への結合を示す。)

でもある。

【0110】

X は酸素である。

40

【0111】

n は 2 である。

【0112】

R^2 は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルキニル、シアノ- C_1-C_4 -アルキルおよび C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルカルボニルまたは C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロゲンアルキルおよびシアノで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば、一価または二価の金属イオン、または C_1-C_4 -アルキルまたはア

50

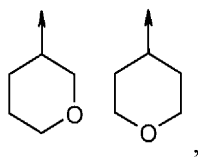
リール- C_1-C_4 -アルキル-で置換されていてもよいアンモニウムイオンの群からの基であり； R^2 は、特に、水素、メチル、エチル、 CH_2OCH_3 、 $CH_2OCH_2CH_3$ 、 $COCH_3$ 、 $COCH_2CH_3$ 、 CH_2CN 、プロピニル、シクロプロピル、 Na^+ 、 K^+ および $N(CH_3)_4$ の群からの基である。

【0113】

R^5 は、各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子は直ぐに隣接してはならない）および窒素（および、特に、

【0114】

【化40】



（式中、矢印は、各場合において、（L）基中の炭素原子への結合を示す。）の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン-、（アルキル部位におけるものを含めた）シアノ-、ニトロ-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-、アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルアミノ-、ジ（ C_1-C_4 -アルキル）アミノ-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ-、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル-、 C_2-C_4 -アルケニル-、 C_2-C_4 -アルキニル-、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル-、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル-またはアミノカルボニル-で置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル、または R' および R'' が、各々、独立して、水素および C_1-C_4 -アルキルの群からの基である $NR'R''$ の群からの基であり、および R^5 は、特に、メチル、エチル、*i*-プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。

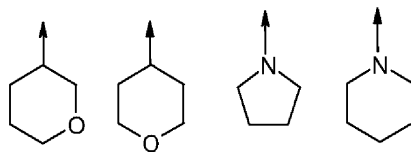
【0115】

R^7 は、各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルキルチオ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル-、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル-および C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル-で置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニルおよび C_2-C_4 -アルキニル、各場合において、ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-で置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキルおよび C_3-C_4 -シクロアルケニル、ここにおいて、該環は硫黄、酸素（ここにおいて、酸素原子

は直ぐに隣接してはならない) および窒素 (および、特に、

【0116】

【化41】



(式中、矢印は、各場合において、(E)基中の硫黄原子への結合を示す。)の群からの少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよく、各場合において、ハロゲン、(アルキル部位におけるのを含めた)シアノ、ニトロ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_4 -アルキル)アミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニルまたはアミノカルボニルで置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール- C_1-C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1-C_4 -アルキル、または R' および R'' が、各々、独立して、水素および C_1-C_4 -アルキルの群からの基である $NR'R''$ の群からの基であり、および R^7 は、特に、メチル、エチル、*i*-プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。

【0117】

R^{13} は水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基である。

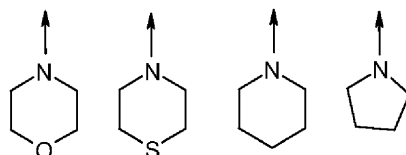
【0118】

Y^3 は C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、および R^{14} および R^{15} が、各々、独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、シアノ、 C_1-C_4 -シアノアルキル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -シアノアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_2-C_4 -シアノアルキニル、 C_1-C_5 -アルキルカルボニルおよび C_1-C_5 -アルコキシカルボニルの群からの基であり、または R^{14} および R^{15} は、それらが結合している窒素と一緒に、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルまたは C_1-C_4 -チオアルキルで置換されていてもよい飽和または不飽和の、硫黄、酸素および窒素の群からのさらなる原子および/またはカルボニル基を含有してもよい5員から6員の環を形成してもよく； R^{14} および R^{15} は、それらが結合してい

る窒素原子と一緒にあって、特に、

【0119】

【化42】



(式中、矢印は、各場合において、(N)基中の炭素原子への結合を示す。) 10
の群からの基であってよい $\text{NR}^{14}\text{R}^{15}$ の群からの基である。

【0120】

好ましい定義において、そうでないことが述べられているのでなければ、ハロゲンはフッ素、塩素、臭素およびヨウ素の群からの、好ましくは、今度は、フッ素、塩素および臭素の群から選択され、

(より大きな単位、例えば、アリールアルキルの一部として含まれる) アリールはフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、好ましくは、今度は、フェニルであり、

ヘタリール(より大きな単位、例えば、ヘタリールアルキルの一部として含まれた、ヘテロアリールと同義)は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニルおよびインドリジニルの群から選択され、 20

5員のヘテロシクリルは、1または2の窒素原子および/または1の酸素原子および/または1の硫黄原子を含有する部分的に飽和された5員の環であり、

6員のヘテロシクリルは、1または2の窒素原子および/または1の酸素原子および/または1の硫黄原子を含有する部分的に飽和した6員の環である。 30

【0121】

特に好ましい定義において、そうでないことが述べられているのでなければ、

ハロゲンはフッ素、塩素、臭素およびヨウ素の群から、好ましくは、フッ素、塩素および臭素の群から選択され、 40

(より大きな単位、例えば、アリールアルキルの一部として含まれた) アリールは、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、および好ましくは、フェニルであり、

(より大きな単位、例えば、ヘタリールアルキルの一部として含まれた) ヘタリールはピリジル、ピリミジニル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、イミダゾリル、チアゾリル、チアジアゾリルおよびフラニルの群から選択される。

【0122】

非常に特に好ましい定義において、そうでないことが述べられているのでなければ、

アリールはフェニルであり、および

(より大きな単位、例えば、ヘタリールアルキルの一部としてを含めた、ヘテロアリー 50

ルと同等な)ヘタリールはピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニルおよびピラジニルの群から選択される基である。

【0123】

ハロゲン置換基、例えば、ハロアルキル、モノーまたはポリハロゲネート、最大数までの可能な置換基。ポリハロゲン化の場合には、ハロゲン原子は同一または異なってよい。この場合、ハロゲンはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特に、フッ素、塩素または臭素である。

【0124】

アルキルまたはアルケニルのような飽和または不飽和のヒドロカルビル基は、各場合において、例えば、アルコキシにおけるように、ヘテロ原子と組み合わせたものを含めた、直鎖または可能な限り分岐鎖であってよい。

10

【0125】

置換されていてもよい基はモノーまたはポリ置換されていてよく、ここにおいて、ポリ置換の場合における置換基は同一または異なってよい。

【0126】

G^2 が表すことができる基 (A)、(B)、(C) および (D) において、矢印は、各場合において、隣接する環への結合を示す。

【0127】

本発明の化合物の強調された基において、 G^2 は基 (A) である。

【0128】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^2 は基 (B) である。

20

【0129】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^2 は基 (C) である。

【0130】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^2 は基 (D) である。

【0131】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、Xは酸素である。

【0132】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、Xは硫黄である。

【0133】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^1 はC-Hである。

30

【0134】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^1 はC-Fである。

【0135】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^1 はN(窒素)である。

【0136】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 A^1 は水素である。

【0137】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 A^2 は水素である。

【0138】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、nは2である。

40

【0139】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 R^1 は水素である。

【0140】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 R^1 はメチルである。

【0141】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 R^1 はフッ素である。

【0142】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^4 は基 (E) である。

【0143】

50

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^4 は基 (I) である。

【0144】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^4 は基 (L) である。

【0145】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^4 は基 (N) である。

【0146】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^3 はピラゾリル基である。

【0147】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^3 はチアゾリル基である。

【0148】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^3 はトリアゾリル基である。

【0149】

本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^3 はピリジニル基である。

【0150】

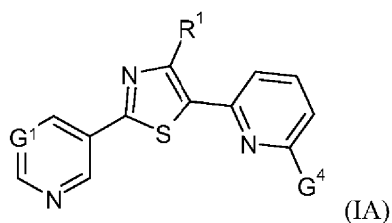
本発明の化合物のさらなる強調された基において、 G^3 はピリミジニル基である。

【0151】

本発明の強調された実施形態は、式 (IA) :

【0152】

【化43】



[式中、

G^1 は C-H、C-F、C-Cl または N であり、

R^1 は水素またはメチルであり、および

G^4 は (E)、(L) および (N) 基のうちの 1 つ、特に、(E) 基である。]

の化合物に関する。

【0153】

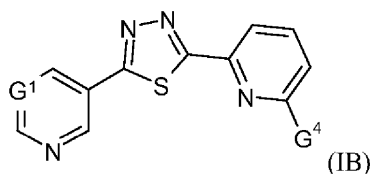
式 (IA) の化合物内で好ましい化合物の群は、 G^1 が C-F であり、 R^1 が水素であって、 G^4 が (E) 基であるものである。

【0154】

本発明のさらなる強調された実施形態は、式 (IB) :

【0155】

【化44】



[式中、

G^1 は C-H、C-F、C-Cl または N であり、および

G^4 は (E)、(L) および (N) 基のうちの 1 つである。]

の化合物に関する。

【0156】

本発明のさらなる強調された実施形態は、式 (IC) :

10

20

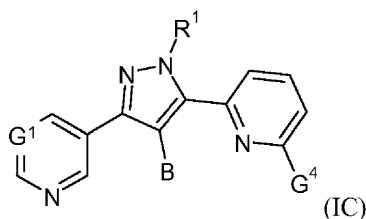
30

40

50

【0157】

【化45】



[式中、

G¹ はC-H、C-F、C-Cl またはNであり、R¹ は水素またはメチルであり、

B は水素であり、および

G⁴ は(E)、(L) および(N) 基のうちの1つである。]

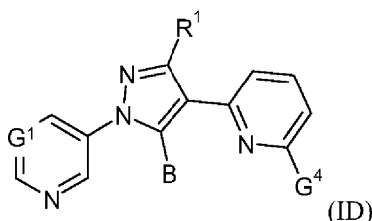
の化合物に関する。

【0158】

本発明のさらなる強調された実施形態は、式(ID)：

【0159】

【化46】



[式中、

G¹ はC-H、C-F、C-Cl またはNであり、R¹ は水素またはメチルであり、

B は水素であり、および

G⁴ は(E) および(L) 基のうちの1つである。]

の化合物に関する。

【0160】

式(IA)、(IB)、(IC) および(ID) の化合物における(E)、(L) および(N) 基における置換基は、各々、前記記載において特定された定義をとることができる。

【0161】

一般的用語にて、または選択の領域内で先に与えられた基の定義または説明は、式(I) の最終生成物(および、よって、式(Ia)、(Ib)、(IA)、(IB)、(IC) および(ID) の化合物) に適用され、および対応して、出発物質および中間体に適用される。これらの基の定義は望まれるように相互に組み合わせることができ、すなわち、各好ましい範囲の間の組合せを含む。

【0162】

好ましいものとして先に挙げた定義の組合せが存在するところの式(I) の化合物が、本発明に従って、好ましい。

【0163】

特に好ましいものとして先に挙げた定義の組合せが存在するところの式(I) の化合物が、本発明に従って、特別に好ましい。

【0164】

非常に特に好ましいものとして先に挙げた定義の組合せが存在するところの式(I) の

10

20

30

40

50

化合物に対が、本発明に従って、非常に特別に好ましい。

【0165】

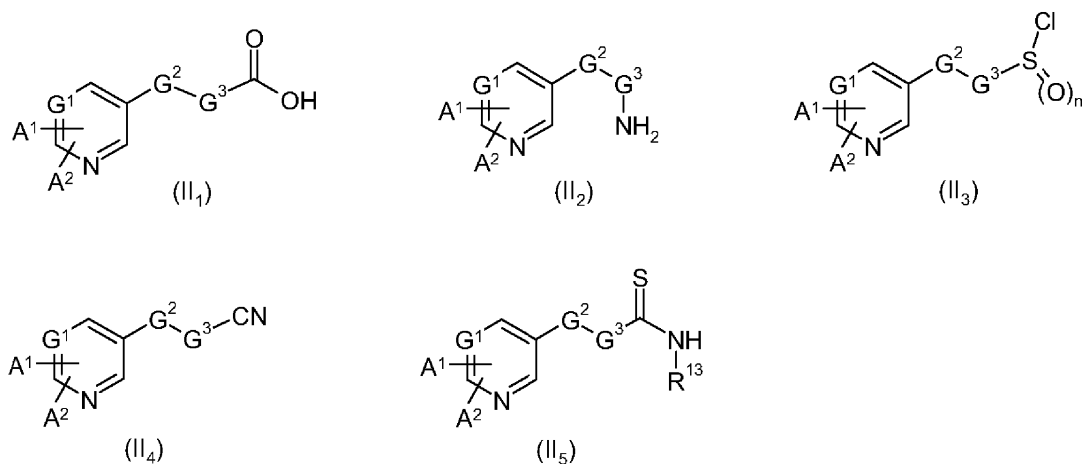
本発明の化合物の調製は以下に詳細に説明される。

【0166】

出発物質として要求される、 G^2 が基 (A)、(B) および (C) を表す式 (II₁)、(II₂)、(II₃)、(II₄) および (II₅) の化合物は、国際公開第 2010/006713 号パンフレットに記載された方法と同様に調製することができる。

【0167】

【化 47】

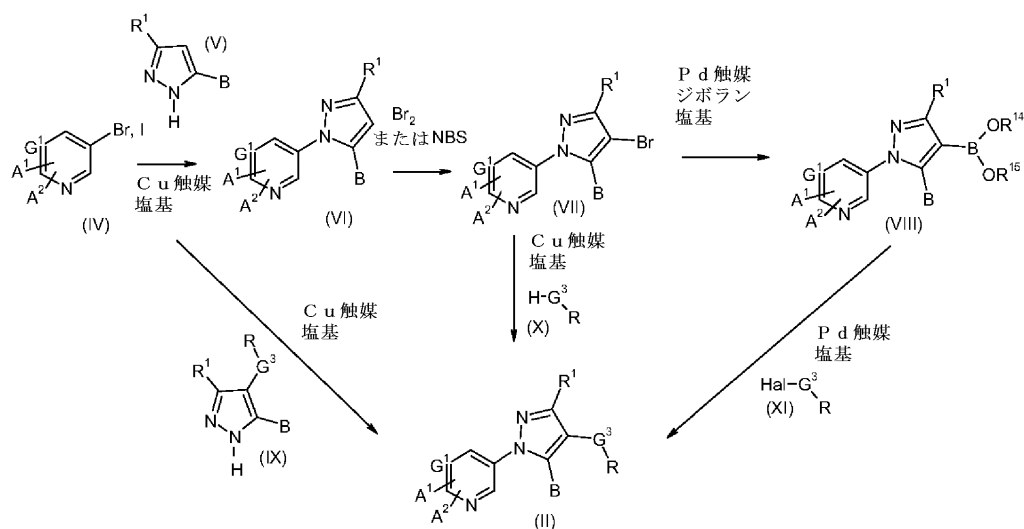


出発物質として要求される、 G^2 が基 (D) を表す式 (II₁)、(II₂)、(II₃)、(II₄) および (II₅) の出発物質は、以下のように、文献に記載された方法と同様に調製することができる。

反応スキーム 1

【0168】

【化 48】



例えば、銅触媒の、および炭酸カリウムのような塩基の存在下での式 (IV) の臭化物と式 (V) のピラゾールとの反応により、式 (VI) の化合物を得る。例えば、3-(4-ブロモピラゾール-1-イル)ピリジンについては: Journal of Heterocyclic Chemistry 1981, 18, 9-14; European Journal of Organic Chemistry, 2004, 695 参照。式 (VI) のこれらのピラゾールを用いて、臭素または N-ブロモスクシンイミドとの

反応によって、式(VII)の臭化物を得る。例えば、3-(4-ブロモピラゾール-1-イル)ピリジンについては: Journal of Heterocyclic Chemistry 18, 1981, 9-14 参照。式(VII)の臭化物を用いて、パラジウム触媒および塩基の存在下での、例えば、ビス(ピナコラト)ジボランとの反応によって、式(VIII)のボロン酸エステルを得る。必要とされる式(II)の出発化合物は、銅触媒および塩基の存在下での、N-Hを含有するH-G³-R単位を構成する式(X)の化合物、例えば、ピラゾールとの反応によって、あるいは式(IV)の臭化物と式(IX)の適当なピラゾールとの反応により、同一のプロセスに従って、式(VII)の臭化物から得ることができる。

【0169】

10

加えて、式(I)の本発明の化合物は、パラジウム触媒および塩基の存在下での、式(VIII)のボロン酸エステルと式(XI)のハライドとの反応(Suzuki反応)によって得ることができる。

【0170】

Rが保護されたカルボン酸、例えば、エステルであれば、カルボン酸(II₁)は公知の方法によって容易に調製することができる。

【0171】

Rが保護されたアミンであれば、アミン(II₂)は公知の方法によって容易に調製することができる。

【0172】

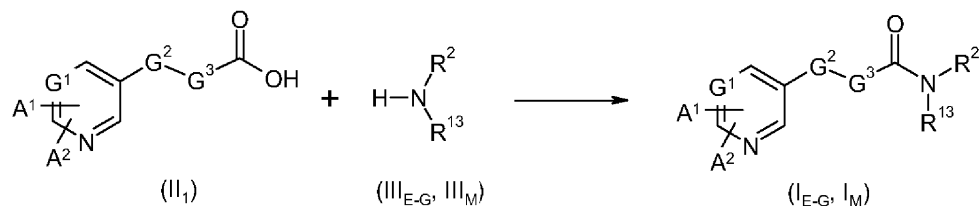
20

Rがハロゲン、例えば、臭素である場合、(国際公開第2007/45588号パンフレットおよび米国特許出願公開第2008/318941号と同様に)、ハロゲンは金属、例えば、リチウムに交換することができる。金属化合物は二酸化硫黄と反応し、次いで、塩化スルフリルまたはN-クロロスクシンイミドのような塩素化試薬と反応させて、出発化合物(II₃)を得る。

反応スキーム2

【0173】

【化49】

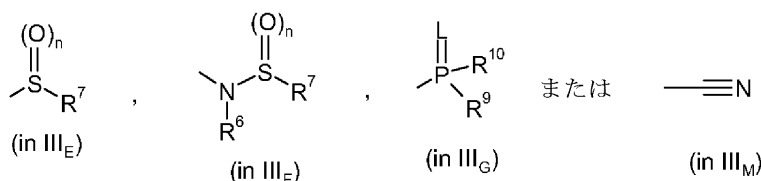


30

ここにおいて、R¹³は以下のものである。

【0174】

【化50】



40

出発物質として必要な式(III_{E-G}、III_M)のアミン誘導体は公知であるか、または原理的に知られた方法によって調製することができる。

【0175】

式(II₁)の酸を、例えば、活性化後に酸塩化物を得ることにより(例えば、Bioorg & MedChem Letters 15, 4354 (2005) 参照)、またはCDI(カルボニルジイミダゾール; 例えば、Bioorg & MedChem

50

9, 1543 (2001) 参照)、DMAP (ジメチルアミノピリジン; 例えば、J. Med. Chem. 50, 3101 (2007)) の存在下での EDC (1-エチル-3-[3-ジメチルアミノプロピル] カルボジイミド塩酸塩)、または HOBt (1-ヒドロキシベンゾトリアゾール; 例えば、J. Med. Chem. 50, 3101 (2007) 参照) の存在下での DCC (ジシクロヘキシルカルボジイミド) のような活性化試薬によって、水素化金属 (特に、水素化ナトリウム) または DBU (ジアザビシクロウンデセン) のような塩基の存在下であってもよいが、式 (I I I_E) のスルホンアミドと反応させて、X が酸素である式 (I_E) の本発明の化合物を得ることができる。

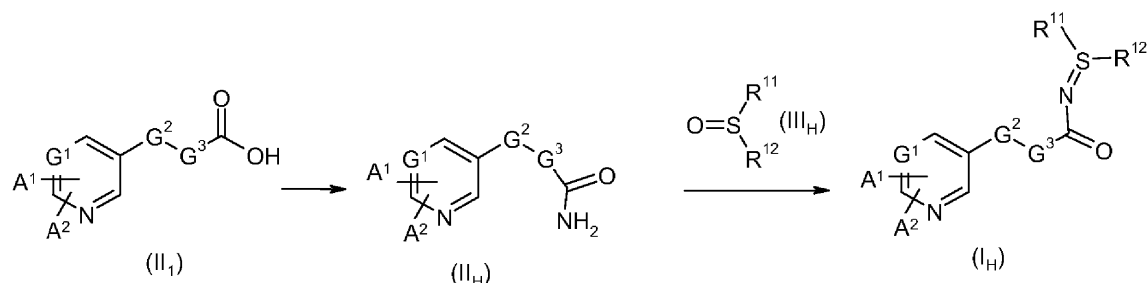
【0176】

R¹³ について述べたさらなる基は、文献の方法によって、またはこれらの方法と同様に、式 (I I I₁) の酸またはその酸塩化物から調製することができ、例えば、Chem. Letters 36, 1370 (2007) または J. Med. Chem. 29, 1299 (1986) に従って、式 (I I I_F) の化合物と反応させて、式 (I_F) の本発明の化合物を得るか、あるいは例えば、J. Org. Chem. 72, 465 (2007) または Phosphorus & Sulfur 20, 93 (1984) に従って式 (I I I_G) の化合物と反応させて、式 (I_G) の本発明の化合物が得られ、および例えば、国際公開第 2006/002099 号パンフレットに従って式 (I I I_M) のシアミンと反応させて、式 (I_M) の本発明の化合物を得ることができる。

反応スキーム 3

【0177】

【化 51】



式 (I_H) の化合物は、例えば、文献の方法または同様な方法によって、式 (I I I_H) のカルボキサミドを式 (I I I_H) のスルホキシドと反応させることによって調製することができる; 例えば、国際公開第 2008/154528 号パンフレット参照。

【0178】

出発物質として必要な式 (I I I_H) のカルボキサミドは、文献の方法または類似の方法によって、例えば、国際公開第 2007/103755 号パンフレットまたは米国特許出願公開第 2009/203657 号に記載されたように、酸 (I I I₁) または酸塩化物から調製することができる。

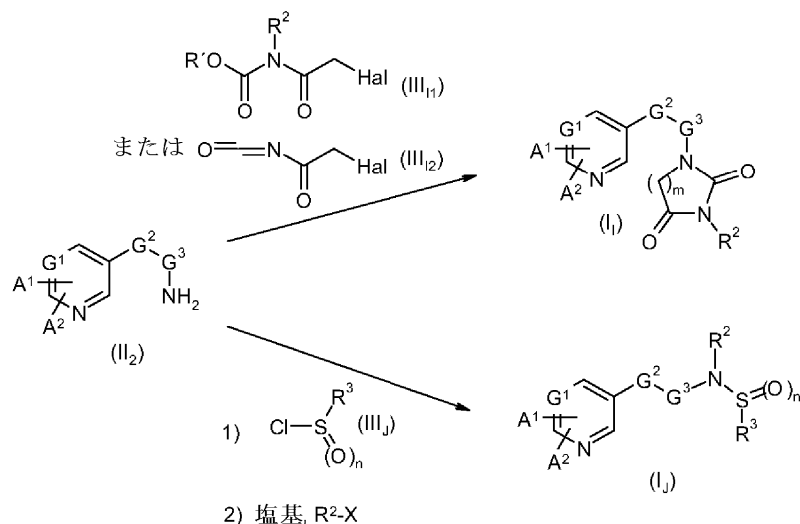
【0179】

式 (I I I_H) のスルホキシドは文献から知られた化合物である。

反応スキーム 4

【0180】

【化 5 2】



10

式 (I₁) の化合物は、例えば、国際公開第 2007/132475 号パンフレットまたは同第 2006/019831 号パンフレットに記載された方法と同様にして、式 (I₁) のアミンを式 (I I I_{1 1}) または (I I I_{1 2}) の化合物と反応させることによって調製することができる。

20

【0181】

式 (I I I_{1 1}) および (I I I_{1 2}) の化合物は公知であるか、または原理的には公知の方法によって調製することができる。

【0182】

式 (I_j) の化合物は、例えば、塩基、例えば、ピリジンまたは水酸化ナトリウムの存在下で、式 (I I I_j) の複素環アミンを式 (I I I_j) の塩化スルホニルと反応させることによって調製することができる；例えば、国際公開第 2007/114532 号パンフレットおよび米国特許出願公開第 2006/211603 号参照。

【0183】

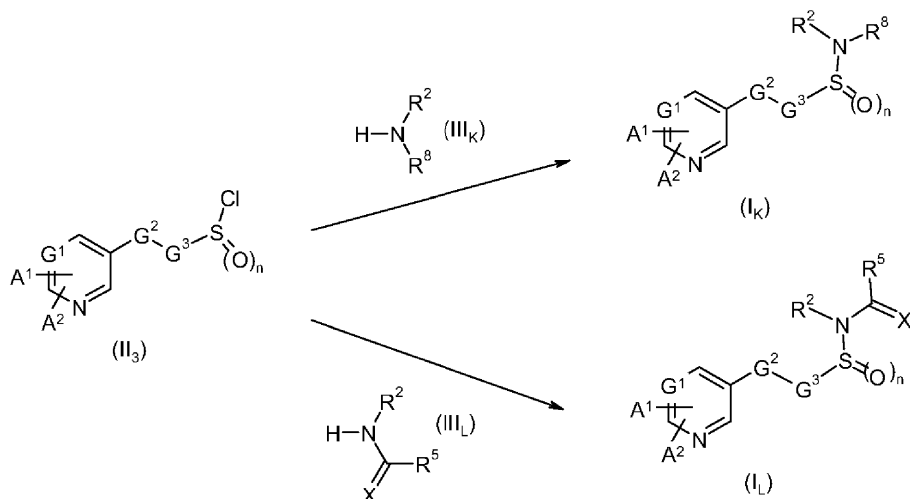
出発物質として必要とされる式 (I I I_j) のクロロスルフィニルまたはクロロスルホニル誘導体は公知であるか、または原理的には公知の方法によって調製することができる。

30

反応スキーム 5

【0184】

【化 5 3】



40

式 (I_k) の化合物は、例えば、米国特許第 6,265,411 号明細書、国際公開第

50

2007/114532号パンフレットまたは米国特許第6,673,817号明細書に記載された方法と同様にして、塩基、例えば、ピリジンまたはトリエチルアミンの存在下であってもよい条件で、式(II₃)の塩化スルホニルを式(III_K)のアミンと反応させることによって調製することができる。

【0185】

出発物質として必要とされる式(III_K)のアミンは公知であるか、または原理的には公知の方法によって調製することができる。

【0186】

Xが酸素である式(I_L)の化合物は、例えば、米国特許出願公開第2004/006143号またはOrg. Lett. 3458-3461(2009)に記載された方法と同様にして、塩基、例えば、水素化ナトリウムまたはn-ブチルリチウムの存在下で、式(II₃)の塩化スルホニルを式(III_L)のアミドと反応させることによって調製することができる。

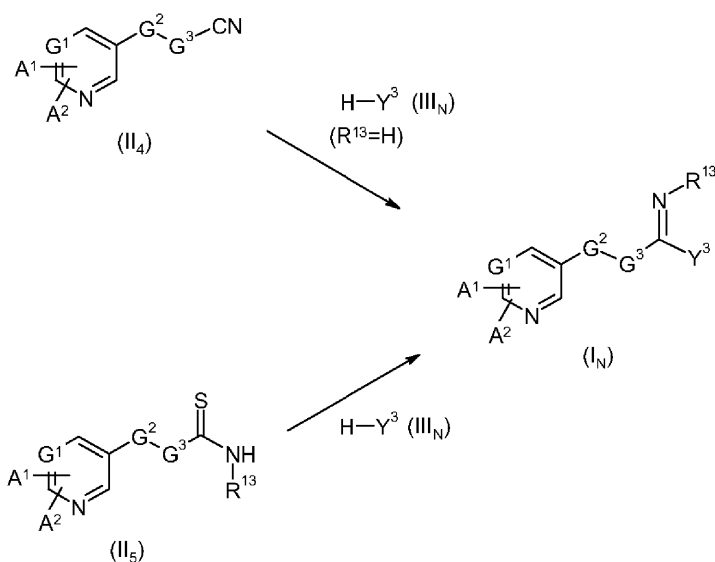
【0187】

出発物質として必要とされる式(III_L)のアミドは公知であるか、または原理的には公知の方法によって調製することができる。

反応スキーム6

【0188】

【化54】



式(I_N)の化合物は、例えば、式(II₄)のニトリル、または式(II₅)のチオアミドと式(III_N)のオキシ、チオまたはアミノ誘導体との反応によって調製することができる。オキシ誘導体は、例えば、European Journal of Medicinal Chemistry 2009, 44(6), 2497-2505に記載された方法によって用いることができ；チオ誘導体は、例えば、Journal of the America Chemical Society 1985, 107(28), 5745-5754に記載された方法によって用いることができる。アミノ誘導体は、例えば、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letter 2010, 20(1), 299-301、国際公開第2007/083239号パンフレットまたはEuropean Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45(3), 902-908に記載された方法によって用いることができる。

【0189】

出発物質として必要とされる式(III_N)の化合物は公知であるか、または原理的には公知の方法によって調製することができる。

【0190】

Xが硫黄である式 (I_{E-H})、(I_I) および (I_L) の化合物は、チオネート化試薬との反応によって、Xが酸素である式 (I_{E-H})、(I_I) および (I_L) の対応する化合物から調製することができる。用いた硫化剤 (チオネート化試薬) は好ましくはリン試薬、例えば、五硫化二リン (P₂S₅)、五硫化二リン/ピリジン (P₂S₅/Py)、五硫化二リン/トリエチルアミン (P₂S₅/NEt₃)、五硫化二リン/炭酸水素ナトリウム (P₂S₅/NaHCO₃ 「シェーレン試薬」)、またはより好ましくは2, 4-ビス (4-メトキシフェニル) -2, 4-ジチオキソ-1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタン「ローソン試薬 (LR)」、2, 4-ビス (4-フェノキシフェニル) -2, 4-ジチオキソ-1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタン「ベレオー試薬 (BR)」または2, 4-ビス (4-フェニルチオフェニル) -2, 4-ジチオキソ-1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタンである。

10

【0191】

N-オキシドは、例えば、式 (I) の化合物をmCPBA (メタークロロ過安息香酸) と反応させることによって得ることができる。式 (I) の化合物の塩は、式 (I) の化合物を、Xが、例えば、塩素または臭素のようなハロゲンであって、Rが、例えば、各場合において、置換されていてもよいアルキル、アルケニルまたはアルキニル基である式RXの化合物と反応させることによって得ることができる。

【0192】

以下の式 (XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)、(XVII) および (XVIII) の中間体は新規であって、本発明の主題の一部も形成する。

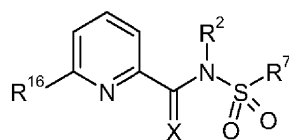
20

【0193】

式 (XII) :

【0194】

【化55】



(XII)

30

[式中、

R¹⁶はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素 (特に、塩素、臭素またはヨウ素) であって、X、R² およびRは各々、先に定義した通りである。]

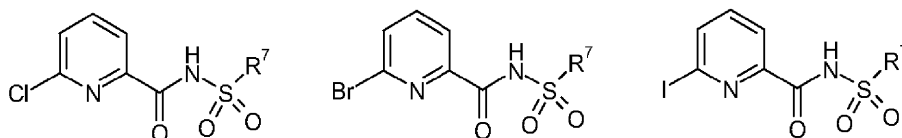
の化合物。

【0195】

特別な言及は式 (XII) :

【0196】

【化56】



40

[式中、R⁷はメチル、エチル、シクロプロピル、CF₃、CH₂CF₃、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルまたはベンジルである。]

の以下の化合物に対してなされるべきである。

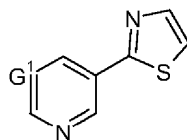
【0197】

式 (XIII) :

【0198】

50

【化 5 7】



(XIII)

[式中、 G^1 は窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-アルキル、C-シクロアルキルまたはC-アルコキシ、好ましくは、窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C- C_1-C_6 -アルキル、C- C_3-C_6 -シクロアルキルまたはC- C_1-C_6 -アルコキシである。]

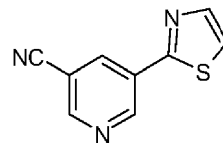
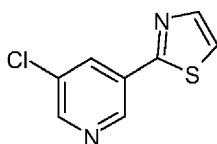
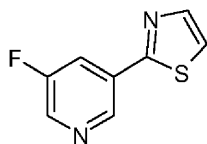
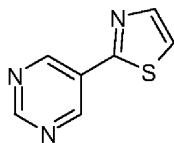
の化合物。

【0199】

特別な言及は式 (X I I I) の以下の化合物に対してなされるべきである。

【0200】

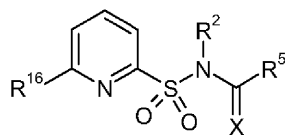
【化 5 8】



式 (X I V) :

【0201】

【化 5 9】



(XIV)

[式中、

R^{16} はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素（特に、塩素、臭素またはヨウ素）であり、およびX、 R^2 および R^5 は、各々、先に定義した通りである。]

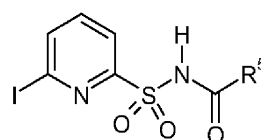
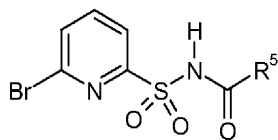
の化合物。

【0202】

特別な言及が式 (X I V) の以下の化合物に対してなされるべきである：

【0203】

【化 6 0】



[式中、 R^5 はメチル、エチル、i-プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。]

式 (X V) :

【0204】

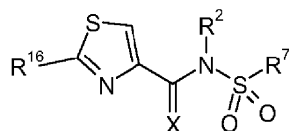
10

20

30

40

【化 6 1】



(XV)

[式中、

R¹⁶ はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素（特に、塩素、臭素またはヨウ素）であって、X、R² および R⁷ は、各々、先に定義した通りである。]

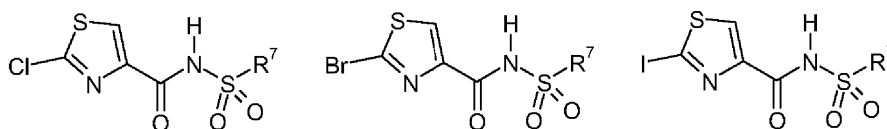
10

【0205】

特別な言及が式 (XV) の以下の化合物に対してなされるべきである：

【0206】

【化 6 2】



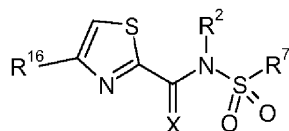
20

[式中、R² はメチル、エチル、シクロプロピル、CF₃、CH₂CF₃、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルまたはベンジルである。]

式 (XVI)：

【0207】

【化 6 3】



(XVI)

30

[式中、

R¹⁶ はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素（特に、塩素、臭素またはヨウ素）であって、X、R² および R⁷ は、各々、先に定義した通りである。]

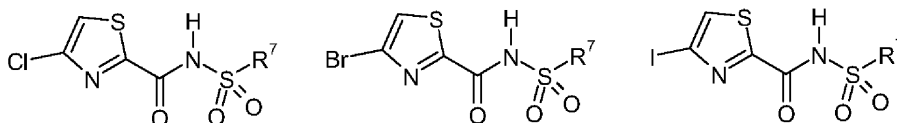
の化合物。

【0208】

特別な言及が式 (XVI) の以下の化合物に対してなされるべきである：

【0209】

【化 6 4】



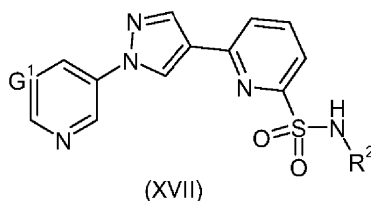
40

[式中、R⁷ は先に定義した通りであって、特に、メチル、エチル、シクロプロピル、CF₃、CH₂CF₃、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルまたはベンジルである。]

式 (XVII)：

【0210】

【化 6 5】



〔式中、

G¹ は窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-アルキル、C-シクロアルキルまたはC-アルコキシ、好ましくは、窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-C₁-C₆-アルキル、C-C₃-C₆-シクロアルキルまたはC-C₁-C₆-アルコキシであり、および

R² は先に定義した通りである。]

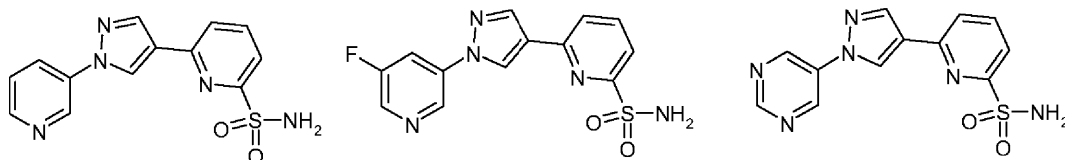
の化合物。

【0 2 1 1】

特別な言及が式 (XVII) の以下の化合物に対してなされるべきである。

【0 2 1 2】

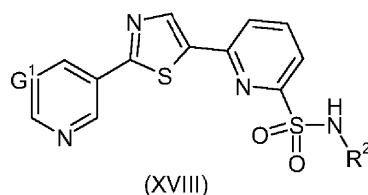
【化 6 6】



式 (XVII I) :

【0 2 1 3】

【化 6 7】



〔式中、

G¹ は窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-アルキル、C-シクロアルキルまたはC-アルコキシ、好ましくは、窒素、C-ハロゲン、C-シアノ、C-ニトロ、C-C₁-C₆-アルキル、C-C₃-C₆-シクロアルキルまたはC-C₁-C₆-アルコキシであり、および

R² は先に定義した通りである。]

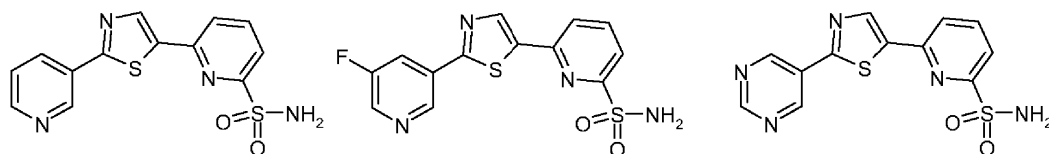
の化合物。

【0 2 1 4】

特別な言及が式 (XVIII) の以下の化合物に対してなされるべきである：

【0 2 1 5】

【化 6 8】



本発明の有効成分は、良好な植物許容性、好都合な恒温動物毒性および良好な環境適合性を考えれば、植物および植物の器官を保護するのに、収穫の収率を増加させるのに、収穫物の質を改良するために、および農業において、園芸において、動物飼育において、森林において、庭およびレジャー施設において、貯蔵された産物および材料の保護において、および衛生部門において遭遇する、動物の害虫、特に、昆虫、クモ形節足動物、蠕虫、線虫および軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、作物保護組成物として用いることができる。それらは通常に感受性および抵抗性の種に対して、および発生 of the 全てまたはいくつかの段階に対して活性である。前記した害虫は以下を含む：

シラミ (Anoplura) (フチラプテラ (Phthiraptera)) 目から、例えば、ダマリニア属種 (Damalinia spp.)、ヘマトピナス属種 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属種 (Linognathus spp.)、ペディクルス属種 (Pediculus spp.)、トリコデクテス属種 (Trichodectes spp.)。

【0216】

クモ類 (Arachnida) 綱から、例えば、アカルス・シロ (Acarus siro)、アセリア・シェルドニ (Aceria sheldoni) アクロプス属種 (Aculops spp.)、アクルス属種 (Aculus spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、アンフィテトラニクス・ヴィエネンシス (Argas spp.)、ボーフィラス属種 (Boophilus spp.)、ブレビパルス属種 (Brevipalpus spp.)、ブリオビア・プラエティオサ (Bryobia praetiosa)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、デルマニサス・ガリナエ (Dermanyssus gallinae)、エオテトラニクス属種 (Eotetranychus spp.)、エピトリメルス・ピリ (Epitrimerus pyri)、エウテトラニクス属種 (Eutetranychus spp.)、エリオフィエス属種 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属種 (Hemitarsonemus spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、ラトロデクツス・マクタンズ (Latrodectus mactans)、メタテトラニクス属種 (Metatetranychus spp.)、オリゴニクス属種 (Oligonychus spp.)、オミトドス属種 (Omithodoss spp.)、パノニカス属種 (Panonychus spp.)、フィロコプトルタ・オレイボラ (Phyllocoptruta oleivora)、ポリファゴタルソネムス・ラタス (Polyphagotarsonemus latus)、ソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、リピセファラス属種 (Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属種 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、スコルピオ・マウルス (Scorpio maurus、Stenotarsonemus spp.)、ステノタルソネムス属種 (Tarsonemus spp.)、テトラニカス属種 (Tetranychus spp.)、ヴァサテス・リコペルシキ (Vasates lycopersici)。

【0217】

双殻類 (Bivalva) 綱から、例えば、ドレイセナ属種 (Dreissena spp.)。

【0218】

ムカデ (Chilopoda) 目から、例えば、ゲオフィラス属種 (Geophilus spp.)、スクティゲラ属種 (Scutigera spp.)。

【0219】

鞘翅 (Coleoptera) 目から、例えば、アカントセリデス・オブテクツス (Acanthoscelides obtectus)、アドレタス属種 (Adoretus spp.)、アゲラスティカ・アルニ (Agelastica alni)、アグリオテス属種 (Agriotes spp.)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (Am

10

20

30

40

50

phimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、アノプロフォラ属種 (Anoplophora spp.)、アンソノマス属種 (Anthonomus spp.)、アンスレナス属種 (Anthrenus spp.)、アポゴニア属種 (Apogonia spp.)、アトマリア属種 (Atomaria spp.)、アタゲナス属種 (Attagenus spp.)、ブルキディウス・オブテクタス (Bruchidius obtectus)、ブルーカス属種 (Bruchus spp.)、セウトリンカス属種 (Ceuthorrhynchus spp.)、クレオヌス・メンディクス (Cleonus mendicus)、コノデルス属種 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属種 (Cosmopolites spp.)、コステリトラ・ジーランディカ (Costelytra zealandica)、クルクリオ属種 (Curculio spp.)、クリプトリンカス・ラパチ (Cryptorhynchus lapathi)、デルメステス属種 (Dermestes spp.)、ジアブロティカ属種 (Diabrotica spp.)、エピラクナ属種 (Epilachna spp.)、ファウスティヌス・クバエ (Faustinus cubae)、ギビウム・プシロイデス (Gibbium psylloides)、ヘテロニカス・アラトル (Heteronychus arator)、ヒラモルファ・エレガンス (Hylamorpha elegans)、ヒロトルペス・バユルス (Hylotrupes bajulus)、ヒペラ・ポスティカ (Hypera postica)、ハイPOSENUMS属種 (Hypothenemus spp.)、ラクノステルナ・コンサンギニア (Lachnosterna consanguinea)、レプチノタルサ・デセムリネアータ (Leptinotarsa decemlineata)、リソロプトルス・オリゾフィルス (Lissorhopterus oryzophilus)、リクス属種 (Lixus spp.)、リクツス属種 (Lyctus spp.)、メリゲテス・アエネアス (Meligethes aeneus)、メロロンタ・メロロンタ (Melolontha melolontha)、ミグドルス属種 (Migdolus spp.)、モノカムス属種 (Monochamus spp.)、ナウパクツス・キサソググラフス (Naupactus xanthographus)、ニプツス・ホロレウクス (Niptus hololeucus)、オリクテス・リノセロス (Oryctes rhinoceros)、オリザエフィルス・スリナメンシス (Oryzaephilus surinamensis)、オチオリンクス・スルカツス (Otiorrhynchus sulcatus)、オキシセトニア・ジュクンダ (Oxycetonia jucunda)、フェドン・コクレアリアエ (Phaedon cochleariae)、フィロファガ属種 (Phyllophaga spp.)、ポピリア・ジャポニカ (Popillia japonica)、プレムノトリペス属種 (Premnotrypes spp.)、プシリオデス・クリソセファラ (Psylliodes chrysocephala)、プチナス属種 (Ptinus spp.)、リゾビウス・ヴェントラリス (Rhizobius ventralis)、リゾペルタ・ドミニカ (Rhizopertha dominica)、シトフィラス属種 (Sitophilus spp.)、スフェノフォラス属種 (Sphenophorus spp.)、ステルネクス属種 (Sternechus spp.)、シンフィレテス属種 (Symphyletes spp.)、テネブリオ・モリター (Tenebrio molitor)、トリボリウム属種 (Tribolium spp.)、トロゴデルマ属種 (Trogoderma spp.)、チキアス属種 (Tychius spp.)、キシロトレカス属種 (Xylotrechus spp.)、ザブラス属種 (Zabrus spp.)。

【0220】

トビムシ (Collembola) 目から、例えば、オニキウルス・アルマツス (Onychiurus armatus)。

【0221】

革翅目類 (Dermaptera) 目から、例えば、フォルフィクラ・アウリクラリア

10

20

30

40

50

(*Forficula auricularia*)。

【0222】

ヤスデ (*Diplopoda*) 目から、例えば、ブラニウラス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)。

【0223】

双翅 (*Diptera*) 目から、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリフォラ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、セラティティス・キャピタータ (*Ceratitis capitana*)、クリソミア属種 (*Chrysomyia* spp.)、コクリオミア属種 (*Cochliomyia* spp.)、コルディオロピア・アンソロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クレックス属種 (*Culex* spp.)、クテブレラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダカス・オレアエ (*Dacus oleae*)、デルマトピア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、ファニア属種 (*Fannia* spp.)、ガストロフィルス属種 (*Gastrophilus* spp.)、ヒルエミヤ属種 (*Hylemyia* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hyppobosc* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリット (*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒオスシアミ (*Pegomyia hyoscyami*)、フォルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ストモキシス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、タンニア属種 (*Tannia* spp.)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、ウォールファルチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)。

【0224】

腹足 (*Gastropoda*) 綱から、例えば、アリオン属種 (*Arion* spp.)、ビオンファラリア属種 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属種 (*Bulinus* spp.)、デロセラス属種 (*Deroceras* spp.)、ガルバ属種 (*Galba* spp.)、リムナエア属種 (*Lymnaea* spp.)、オンコメラニア属種 (*Oncomelania* spp.)、スクシネア属種 (*Succinea* spp.)。

【0225】

蠕虫綱 (*Helminth*) から、例えば、アンシロストーマ・デュオデナレ (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストーマ・ケイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストーマ・ブラジリエンシス (*Ancylostoma braziliensis*)、アンシロストーマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、アスカリス・ルブリコイデス (*Ascaris lubricoides*)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、ブルギア・カライイ (*Brugia malayi*)、ブルギア・ティモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルティア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ディクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロビスリウム・レイタム (*Diphyllbothrium latum*)、ドラカンキュラス・メディネンシス (*Dracunculus medinensis*)、エキノコッカス・グラニューロサス (*Echinococcus granulosus*)、エキノコッカス・マルチロキュラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius*

10

20

30

40

50

vermicularis)、ファキオラ属種 (Faciola spp.)、ヘモンクス属種 (Haemonchus spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)、ヒメノレプシス・ナナ (Hymenolepis nana)、ヒョストロングス属種 (Hyostrongylus spp.)、ロア・ロア (Loa Loa)、ネマトディルス属種 (Nematodirus spp.)、エソファゴストムム属種 (Oesophagostomum spp.)、オピスソルキス属種 (Opisthorichis spp.)、オンコセルカ・ボブバルス (Onchocerca volvulus)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、パラゴニウムス属種 (Paragonimus spp.)、スキスオソメン属種 (Schistosomen spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (Strongyloides fuelleborni)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (Strongyloides stercoralis)、ストロニロイデス属種 (Strongyloides spp.)、タエニア・サギナータ (Taenia saginata)、タエニア・ソリウム (Taenia solium)、トリキネラ・スピラリス (Trichinella spiralis)、トリキネラ・ナティバ (Trichinella nativa)、トリキネラ・ブリトーヴィ (Trichinella britovi)、トリキネラ・ネルソーニ (Trichinella nelsoni)、トリキネラ・シュードプシラリス (Trichinella pseudopsiralis)、トリコストロングルス属種 (Trichostongylus spp.)、トリキュリス・トリキュリア (Trichuris trichuria)、バンクロフト糸条虫 (Wuchereria bancrofti)。

10

20

【0226】

また、アイメリア (Eimeria) のような原虫を防除するのも可能である。

【0227】

異翅類 (Heteroptera) 目から、例えば、アナサ・トリスティス (Anas tristis)、アンテスティオプシス属種 (Antestiopsis spp.)、ブリッサス属種 (Blissus spp.)、カロコリス属種 (Calocoris spp.)、キャンピロンマ・リビダ (Campylomma livida)、キャベレリウス属種 (Cavelerius spp.)、シメックス属種 (Cimex spp.)、クレオンティアデス・ディルタス (Creontiades dilutus)、ダシヌス・ピペリス (Dasynus piperis)、ディケロプス・フルカツス (Dichelops furcatus)、ディコノコリス・ヘウエッティ (Diconocoris hewetti)、ディスデルカス属種 (Dysdercus spp.)、ユースキスツス属種 (Euschistus spp.)、ユーリガステル属種 (Eurygaster spp.)、ヘリオペルティス属種 (Heliopeletis spp.)、ホルキアス・ノビレルス (Horcias nobilellus)、レプトコリス属種 (Leptocorisa spp.)、レプトグロサス・フィロプス (Leptoglossus phyllopus)、ライガス属種 (Lygus spp.)、マクロペス・エクスキャバタス (Macropes excavatus)、ミリダエ (Miridae)、ネザラ属種 (Nezara spp.)、オエバルス属種 (Oebalus spp.)、ペントミダエ (Pentomidae)、ピエズマ・クアドラータ (Piesma quadrata)、ピエゾドラス属種 (Piezodoros spp.)、サルス・セリアツス (Psallus seriatus)、シューダシスタ・ペルセア (Pseudacysta perseae)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.)、サールベルゲラ・シンギュラリス (Sahlbergella singularis)、スコチノフォラ属種 (Scotinophora spp.)、ステファニティス・ナシ (Stephanitis nashi)、ティブラカ属種 (Tibraca spp.)、トリアトマ属種 (Triatoma spp.)。

30

40

【0228】

同翅 (Homoptera) 目からの、例えば、アキルトシボン属種 (Acyrtho

50

sipon spp.)、アエネオラミア属種 (Aeneolamia spp.)、ア
 ゴノスケナ属種 (Agonoscena spp.)、アレウローデス属種 (Aleur
 odes spp.)、アウレウロロブス・バロデンス (Aleurolobus b
 arodensis)、アレウロスリンクス属種 (Aleurothrixus spp
 . .) アムラスカ属種 (Amrasca spp.)、アヌラフィス・カルドゥイ (An
 uraphis cardui)、アオニディエラ属種 (Aonidiella spp
 .)、アフアノスティグマ・ピリ (Aphanostigma piri)、アフィス属
 種 (Aphis spp.)、アルボリディア・アピカリス (Arboridia ap
 icalis)、アスピディエラ属種 (Aspidiella spp.)、アスピディ
 オトゥス属種 (Aspidiotus spp.)、アタヌス属種 (Atanus sp 10
 p.)、アウラコルサム・ソラニ (Aulacorthum solani)、ベミシア
 属種 (Bemisia spp.)、ブラキカウデウス・ヘリクリシ (Brachyca
 udus helichrysi)、ブラキコルス属種 (Brachycolus s
 pp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (Brevicoryne brassicae)
 、カリギボナ・マルギナータ (Calligypona marginata)、カルネ
 オセファラ・フルギーダ (Carneocephala fulgida)、ケラトバク
 ナ・ラニゲラ (Ceratovacuna lanigera)、ケルコピダエ (Cer
 copidae)、ケロプラステス属種 (Ceroplastes spp.)、カエト
 シフォン・フラガエフォリ (Chaetosiphon fragaefolii)、キ
 オナスピシス・テガレンシス (Chionaspis tegalensis)、クロリ 20
 タ・オヌキ (Chlorita onukii)、クロマフィス・ジュグランディコラ (Chromaphis juglandicola)、クリソムファルス・フィクス (Chrysomphalus ficus)、シカルデュリナ・ムビラ (Cicadulina mbila)、ココミティルス・ハリ (Coccomytilus halli)、コクス属種 (Coccus spp.)、クリプトミズス・リビス (Cryptomyzus ribis)、ダルブルス属種 (Dalbulus spp.)、ディアロイローデス属種 (Dialeurodes spp.)、ディアフォリーナ属種 (Diaphorina spp.)、ディアスピス属種 (Diaspis spp.)、ドロシカ属種 (Doralis spp.)、ディサフィス属種 (Drosicha spp.)、ディスマニコックス属種 (Dysaphis spp.)、ディスマニコックス属種 (Dysmicoccus spp.)、エンポアスカ属種 (Empoasca spp.)、エリオソマ属種 (Eriosoma spp.)、エリスロニューラ属種 (Erythroneura spp.)、ユーセリス・ビロバタス (Euscelis bilobatus)、ゲオコッカス・コフエアエ (Geococcus coffeae)、ホマロディスカ・コアグラータ (Homalodisca coagulata)、ヒアロプテルス・アルンディニス (Hyalopterus arundinis)、イセリア属種 (Icerya spp.)、イディオケルス属種 (Idocerus spp.)、イディオスコプス属種 (Idioscouspus spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス (Laodelphax striatellus)、レカニウム属種 (Lecanium spp.)、レピドサフェス属種 (Lepidosaphes spp.)、 40
 リパフィス・エリシミ (Lipaphis erysimi)、マクロシフム属種 (Macrosiphum spp.)、マハナルヴァ・フィムブリオラタ (Mahanarva fimbriolata)、メラナフィス・サッカリ (Melanaphis sacchari)、メトカルフィエラ属種 (Metcalfiella spp.)、メトポロフィウム・ディロズム (Metopolophium dirhodum)、モネリア・コスタリス (Monellia costalis)、モネリオプシス・ペカニス (Monelliopsis pecanisi)、マイザス属種 (Myzus spp.)、ナソノビア・リビスニグリ (Nasonovia ribisnigri)、ネホテティクス属種 (Nephotettix spp.)、ニラパルバータ・ルゲンス (Nilaparvata lugens)、オンコメトピア属種 (Oncometopia s 50

pp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオーザ属種 (*Paratrionza* spp.)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペンフィガス属種 (*Pemphigus* spp.)、ペレグリヌス・マイディス (*Peregrinus maidis*)、フェナコッカス属種 (*Phenacoccus* spp.)、フロエオマイザス・パセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、フォロドン・フミリ (*Phorodon humuli*)、フィロクセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、ピナスピス・アスピディストラエ (*Pinaspis aspidistrae*)、プラノコッカス属種 (*Planococcus* spp.)、プロトバルビナリア・ピリフォルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、シュードオーラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、シュードコッカス属種 (*Pseudococcus* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピディオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、ケサーダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコッカス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシファム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、サイセティア属種 (*Saissetia* spp.)、スカホイデス・ティタヌス (*Scaphoides titanus*)、スキザフィス・グラミナム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピツス・アルティキュラツス (*Selenaspis art* 20
iculatus)、ソガータ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フリシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトーデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スティクトセファラ・フェスティナ (*Stictocephala festina*)、テナラファラ・マレイエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、チノカリス・カリアエフォリアエ (*Tinocallis caryae*
foliae)、トマスピス属種 (*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、トリアロイロデス・バポラリオルム (*Trialearodes vaporariorum*)、トリオーザ属種 (*Trionza* spp.)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ユナプシス属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビティフォリ (*Vteus vitifolii*)。 30

【0229】

膜翅 (*Hymenoptera*) 目から、例えば、ディプリオン属種 (*Diprion* spp.)、ホプロキャンパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*) およびベスパ属種 (*Vespa* spp.)。

【0230】

等脚 (*Isopoda*) 目から、例えば、アルマジリジウム・バルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスカス・アセルス (*Oniscus asellus*) およびポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)。

【0231】

等翅 (*Isoptera*) 目から、例えば、レティキュリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp) およびオドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp.)。 40

【0232】

鱗翅 (*Lepidoptera*) 目から、例えば、アクロニクタ・メジャー (*Acronicta major*)、アエディア・リユーコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アンティカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、バラスラ・ブラッシカエ (*Barathra brassicae*)、ブ 50
キュラトリクス・スルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)

、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、カコエシア・ポダナ (*Cacoecia podana*)、カプア・レティクラーナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、ケイマトビア・ブルマータ (*Cheimatobia brumata*)、チロ属種 (*Chilo* spp.)、コリストネウラ・フミフェラナ (*Choristoneura fumiferana*)、クリシア・アンビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロケルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、エアリアス・インスラナ (*Earias insulana*)、エフェスチア・クエフニエラ (*Ephestia kuehniella*)、ユープロクティス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、ユークスア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルティア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、ヘリオシス属種 (*Heliothis* spp.)、ホフマノフィラ・シュードスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモナ・マグナニマ (*Homona magnanima*)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、リソコレティス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファン・アンテナータ (*Lithophane antennata*)、ロクサグロティス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、マラコソマ・ニューストリア (*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラッシカエ (*Mamestra brassicae*)、モキス・レパンダ (*Mocis repanda*)、ミチムナ・セパラータ (*Mythimna separata*)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オウレマ・オリゼア (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、フィロクニスティス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、シュードアレティア属種 (*Pseudaletia* spp.)、シュードプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、テルメシア・ゲマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、ティネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、ティネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス・ビリダナ (*Tortrix viridana*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)。

【0233】

直翅 (*Orthoptera*) 目から、例えば、アケタ・ドメスティカス (*Achet a domesticus*)、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、ロイコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロカスタ属種 (*Locusta* spp.)、メラノプラス属種 (*Melanoplus* spp.)、ペリプラネタ・アメリカーナ (*Periplaneta americana*)、スキストケルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*)。

【0234】

ノミ (*Siphonaptera*) 目から、例えば、セラトフィラス属種 (*Ceratophyllus* spp.) およびゼノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)。

【0235】

10

20

30

40

50

結合 (Symphylla) 目から、例えば、*Scutigera immaculata*。

【0236】

総翅 (Thysanoptera) 目から、例えば、バリオトリプス・ビフォルミス (*Baliothrips biformis*)、エネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエツラ属種 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオスリップス属種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノスリップス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、カコスリップス属種 (*Kakothrips* spp.)、リピフォロスリップス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、スキルトスリップス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニオスリップス・カルダモニ (*Taeniothrips cardamoni*) およびスリップス属種 (*Thrips* spp.)。

10

【0237】

総尾 (Thysanura) 目から、例えば、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)。

【0238】

植物寄生性線虫としては、例えば、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、ベロノアイムス属種 (*Belonoaimus* spp.)、ブルサフェレンカス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、ディチレンカス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、ヘリオコチレンカス属種 (*Heliocotylenchus* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、ロンギドラス属種 (*Longidorus* spp.)、メロイドジン属種 (*Meloidogyne* spp.)、プラティレンカス属種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドフォラス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンキュス属種 (*Rotylenchus* spp.)、トリコドラス属種 (*Trichodorus* spp.)、チレンコリンキュス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、チレンキュラス属種 (*Tylenchulus* spp.)、チレンキュラス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*) およびキフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.) を含む。

20

30

【0239】

本発明の化合物は、ある濃度または施用量にて、除草剤、毒性緩和剤、成長調節剤、または植物の特性を改良するための剤として、または殺微生物剤として、例えば、殺真菌剤、抗黴剤、殺菌剤、(ウイルスに対する剤を含めた) 殺ウイルス剤として、または MLO (マイコプラズマ様生物) および RLO (リケッチャー様生物) に対する剤として用いることもできる。それらは、さらなる有効成分の合成のための中間体または前駆体として用いることもできる。

【0240】

有効成分は、溶液、エマルジョン、水和剤、水-および油-ベースの懸濁液、粉末、粉剤、ペースト、可溶性粉末、可溶性粒剤、全面散布用粒剤、サスポエマルジョン濃縮物、有効成分を含浸させた天然化合物、有効成分を含浸させた合成物質、肥料、およびポリマー物質中へのマイクロカプセル化のような慣用的な製剤に変換することができる。

40

【0241】

これらの製剤は、有効成分を増量剤、すなわち、液状溶媒および／または固体担体と混合することによって公知の方法で生産され、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／または泡形成剤を用いてもよい。該製剤は適当な施設にて、または適用の前または間に調製される。

【0242】

用いられる補助剤は、ある種の技術的特性および／または特別な生物学的特性のような

50

、特別な特性を組成物それ自体に、および／またはそれから誘導される調製物（例えば、スプレー液、種子粉衣）に付与するのに適当な物質であってよい。典型的な補助剤は：増量剤、溶媒および担体を含む。

【0243】

適当な増量剤は、例えば、水、例えば、（パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼンのような）芳香族および非芳香族炭化水素、（置換され、エーテル化され、および／またはエステル化されていてもよい）アルコールおよびポリオール、（アセトン、シクロヘキサンのような）ケトン、（油脂を含めた）エステルおよび（ポリ）エーテル、置換されていない、および置換されたアミン、アミド、（N-アルキルピロリドンのような）ラクタム、およびラクトン、スルホン、および（ジメチルスルホキシドのような）スルホキシドのクラスからの極性および非極性有機化学的液体である。

10

【0244】

利用する増量剤が水であれば、例えば、補助的溶媒としての有機溶媒を用いることも可能である。有用な液体溶媒は、本質的に：キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような芳香族、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような塩素化芳香族または塩素化脂肪族炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィンのような脂肪族炭化水素、例えば、石油画分、鉱油および植物油、ブタノールまたはグリコールのようなアルコール、およびそれらのエーテルおよびエステル、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ンのようなケトン、ジメチルスルホキシドのような強い極性の溶媒、および水を含む。

20

【0245】

有用な固体担体は：例えば、アンモニウム塩、およびカオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土のような天然岩粉、および微粉碎されたシリカ、アルミナおよびシリケートのような合成岩粉を含み；粒剤のための有用な固体担体は：例えば、カルサイト、大理石、軽石、セピオライトおよびドロマイトのような破碎されかつ分画された天然岩、および無機および有機粉の合成顆粒、および紙、鋸屑、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコの茎のような有機物質の顆粒を含み；有用な乳化剤および／または泡形成剤は：例えば、ポリエチレン脂肪酸、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、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蛋白質加水分解物のようなノニオン性およびアニオン性乳化剤を含み；適当な分散剤は、例えば、アルコール-POEおよび／または-POPエーテル酸および／またはPOPおよびPOEエステル、アルキルアリアルおよび／またはPOPおよびPOEエーテル、脂肪および／またはPOP-POEアダクト、POEおよび／またはPOP-ポリオール誘導体、POE-および／またはPOP-ソルビタンまたは-糖アダクト、アルキルまたはアリアルスルフェート、アルキル-またはアリアル-スルホネート、アルキルまたはアリアルホスフェート、または対応するPO-エーテルアダクトのクラスからのノニオン性および／またはイオン性物質である。加えて、適当なものは、オリゴ-またはポリマー、例えば、ビニル性モノマーからの、アクリル酸からの、単独の、または例えば（ポリ）アルコールまたは（ポリ）アミンと組み合わせたEOおよび／またはPOから由来するものである。また、

30

40

【0246】

製剤において、カルボキシメチルセルロースのような粘着剤、アラビアガム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルのような粉末、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、またはセファリンおよびレクチンのような天然リン脂質、および合成リン脂質を用いることが可能である。

【0247】

無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびプルシャンプルー、およびアリザリン色

50

素、アゾ色素および金属フタロシアニン色素のような有機色素のような色素、および鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような微量栄養素を用いることが可能である。

【0248】

さらなる添加剤は、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のような、香料、修飾されていてもよい鉱油または植物油、ワックス、および（微量栄養素を含めた）栄養素であってよい。

【0249】

さらなる成分は冷安定化剤、保存剤、抗酸化剤、光安定化剤、または化学的および／または物理的安定性を改良する他の剤のような安定化剤であってよい。

10

【0250】

製剤は、一般に、0.01および98重量パーセントの間の、好ましくは、0.5および90パーセントの間の有効成分を含有する。

【0251】

本発明の有効成分は、それ自体で、またはそれらの製剤にて、1以上のより適切な殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺虫剤、殺微生物剤、肥料、誘引剤、滅菌剤、共力剤、毒性緩和剤、半化学物質、および／または植物成長調節剤にて混合物で存在させて、活性のスペクトルを広げ、作用の持続を延長させ、作用のスピードを増加させ、撥水を妨げ、または抵抗の発生を排除することもできる。加えて、そのような組合せは植物の成長を改良することができ、高温または低温、干ばつ、または水含有量または土壌塩度に対する許容性を増加させ、開花性能を増強させ、収穫を促進し、および収率を増大させ、成熟を加速させ、収穫された産物の質および／または栄養価を増大させ、貯蔵寿命を延長し、および／または収穫された産物の加工性を改良することができる。一般に、本発明の有効成分および混合成分の組合せは相乗効果を与え、これは、特定の混合物の有効性が個々の成分の有効性よりも大きいことを意味する。一般に、種子適用として、またはプレミックス、タンクミックスまたはレディーミックスにての組合せを用いることが可能である。

20

【0252】

特に好都合な混合パートナーは、例えば、以下のものである：

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

それらの普通の名称によってここでは同定される有効成分は公知であって、例えば、害虫ハンドブック（「The Pesticide Manual」第14巻、British Crop Protection Council 2006）に記載されているか、またはインターネット（例えば、<http://www.alanwood.net/pesticides>）で見出すことができる。

30

（1）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害剤、例えば、

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

40

オルガノホスフェート、例えば、アセフェート、アザメチフォス、アジンフォスーエチル、アジンフォスーメチル、カズサフォス、クロルエトキシフォス、クロルフェンビンフォス、クロルメフォス、クロルピリフォス、クロルピリフォスーメチル、クマフォス、シアノフォス、デメトン－S－メチル、ジアジノン、ジクロルボス／DDVP、ジクロトフォス、ジメトエート、ジメチルビンフォス、ジスルフォトン、EPN、エチオン、エトプロフォス、ファンフル、フェナミフォス、フェニトロチオン、フェンチオン、フォスチアゼート、ヘプテンフォス、イミシアフォス、イソフェンホス、イソプロピルO－（メトキシアミノチオホスホリル）サリシレート、イソオキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドフォス、メチダチオン、メビンフォス、モノクロトフォス、ナレド、オメトエー

50

ト、オキシデメトン－メチル、パラチオン、パラチオン－メチル、フェントエート、フォレート、フォスアロン、フォスメト、フォスファミドン、フォキシム、ピリミフォス－メチル、プロフェノフォス、プロペタムフォス、プロチオフォス、ピラクロフォス、ピリダフェンチオン、キナルフォス、スルフォテプ、テブピリムフォス、テメフォス、テルボフォス、テトラクロルピンフォス、チオメトン、トリアゾフォス、トリクロルフォンおよびバミドチオン。

(2) GABA－依存性塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、シクロジェン－有機塩素剤、例えば、クロルダンおよびエンドスルファン；またはフェニルピラゾール（フィロレス）、エチプロール、フィプロニル。

(3) ナトリウムチャンネル調節剤／電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、ピレスロイド、例えば、アクリナトリン、アレチリン、d－シスートランスアレスリン、d－ートランスアレチリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレチリンS－シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シベルメトリン、アルファーシベルメトリン、ベーターシベルメトリン、シーターシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シフェノトリン〔(1R)－ートランス－異性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔(EZ)－(1R)－異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメストン、タウ－フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)－ートランス－異性体〕プラレトリン、ピレトリン（ピレスルム）、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)－異性体〕、トラロメトリンおよびトランスフルトリン；またはDDT；またはメトキシクロール。

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノトフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チオクリプリドおよびチアメトキサムまたはニコチン。

(5) アロステリック性のアセチルコリン受容体調節剤（作動薬）、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラムおよびスピノサド。

(6) 塩化物チャンネル活性化剤、例えば、エバーメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、安息香酸エマメクチン、レピメクチンおよびミルベメクチン。

(7) 幼若ホルモンの類似体、例えば、若年性ホルモンアナログ、例えば、ヒドロプレン、キノプレンおよびメトプレン；またはフェノキシカルブまたはピリプロキシフェン。

(8) 作用機序が未知または未特定の活性化化合物、例えば、アルキルハライド、例えば、臭化メチルおよび他のアルキルハライド；またはクロロピクリン；またはフッ化スルフルル；またはホウ砂；または吐酒石。

(9) 選択的摂食阻害物質、例えば、ピメトロジン；またはフロニカミド。

(10) ダニ成長阻害剤、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾックスおよびジフロビダジン；またはエトキサゾール。

(11) 昆虫腸膜の微生物攪乱剤、例えば、バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バチルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*) およびBT植物蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34／35Ab1。

(12) 酸化的リン酸化阻害剤、ATP攪乱物質、例えば、ジアフェンチウロン；または

10

20

30

40

50

(国際公開第2005/077934号パンフレットから知られた) 3-ブローモ-N-{
2-ブローモ-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル) カルバモイル] フェニル
}-1-(3-クロロピリジン-2-イル) 1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(国
際公開第2007/115644号パンフレットから知られた) 4-{ [(6-ブromo
ピリド-3-イル) メチル] (2-フルオロエチル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン
、(国際公開第2007/115644号パンフレットから知られた) 4-{ [(6-フル
オロピリド-3-イル) メチル] (2, 2-ジフルオロエチル) アミノ} フラン-2 (
5H)-オン、(国際公開第2007/115644号パンフレットから知られた) 4-
{ [(2-クロロ-1, 3-チアゾール-5-イル) メチル] (2-フルオロエチル) ア
ミノ} フラン-2 (5H)-オン、(国際公開第2007/115644号パンフレット
から知られた) 4-{ [(6-クロロピリド-3-イル) メチル] (2-フルオロエチル)
アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(国際公開第2007/115644号パンフレ

ットから知られた) 4- { [(6-クロロピリド-3-イル)メチル] (2, 2-ジフル
 オロエチル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(国際公開第2007/115643
 号パンフレットから知られた) 4- { [(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)
 メチル] (メチル) アミノ} フラン- (5H)-オン、(国際公開第2007/1156
 46号パンフレットから知られた) 4- { [(5, 6-ジクロロピリド-3-イル)メチ
 ル] (2-フルオロエチル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(国際公開第2007
 /115643号パンフレットから知られた) 4- { [(6-クロロ-5-フルオロピリ
 ド-3-イル)メチル] (シクロプロピル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(欧州
 特許出願公開第0539588号から知られた) 4- { [(6-クロロピリド-3-イル)
)メチル] (シクロプロピル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(欧州特許出願公開
 第0539588号から知られた) 4- { [(6-クロロピリド-3-イル)メチル] (メ
 チル) アミノ} フラン-2 (5H)-オン、(国際公開第2007/149134号パ
 ンフレットから知られた) { [1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル] (メチル)
)オキシド- λ^4 -スルファニリデン} シアナミド、および(同様に、国際公開第200
 7/149134号パンフレットから知られた) そのジアステレオマー { [(1R)-1-
 -(6-クロロピリジン-3-イル)エチル] (メチル) オキシド- λ^4 -スルファニリ
 デン} シアナミド (A) および { [(1S)-1-(6-クロロピリジン-3-イル)エ
 チル] (メチル) オキシド- λ^4 -スルファニリデン} シアナミド (B) および(同様に
 、国際公開第2007/149134号パンフレットから知られた) スルフォキサフロ
 ール、および(国際公開第2010/074747、国際公開第2010/074751号
 パンフレットから知られた) ジアステレオマー群Aと命名された、そのジアステレオマー
 [(R)-メチル(オキシド) { (1R)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-
 3-イル]エチル} - Λ^4 -スルファニリデン] シアナミド (A1) および [(S)-
 メチル(オキシド) { (1S)-1-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]
]エチル} - λ^4 -スルファニリデン] シアナミド (A2)、(同様に、国際公開第20
 10/074747、国際公開第2010/074751号パンフレットから知られた)
 ジアステレオマー群Bと命名された、[(R)-メチル(オキシド) { (1S)-1-[
 6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル} - λ^4 -スルファニリデン]
 シアナミド (B1) および [(S)-メチル(オキシド) { (1R)-1-[6-(トリ
 フルオロメチル)ピリジン-3-イル]エチル} - λ^4 -スルファニリデン] シアナミド
 (B2)、および(国際公開第2006/089633として知られた) 11-(4-クロ
 ロロ-2, 6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1, 4-ジオキサ-9-アザジ
 スピロ [4. 2. 4. 2] テトラデカ-11-エン-10-オン、(国際公開第2008
 /067911号パンフレットから知られた) 3-(4'-フルオロ-2, 4-ジメチル
 ビフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ [4. 5] デカ
 -3-エン-2-オン、(国際公開第2006/043635号パンフレットから知られ
 た) 1-{2-フルオロ-4-メチル-5-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル)スル
 フィニル]フェニル}-3-(トリフルオロメチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール
 -5-アミン、(国際公開第2008/066153号パンフレットから知られた) シク
 ロプロパンカルボン酸 [(3S, 4aR, 12R, 12aS, 12bS)-3-(シクロ
 プロピルカルボニル)オキシ]-6, 12-ジヒドロオキシ-4, 12b-ジメチル-1
 1-オキソ-9-(ピリジン-3-イル)-1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 1
 2a, 12b-デカヒドロ-2H, 11H-ベンゾ [f] ピラノ [4, 3-b] クロメン
 -4-イル)メチル、(国際公開第2006/056433号パンフレットから知られた)
 2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-N, N-ジメチルベンゼンスルホンアミ
 ド、(国際公開第2006/100288号パンフレットから知られた) 2-シアノ-3-
 (ジフルオロメトキシ)-N-メチルベンゼンスルホンアミド、(国際公開第2005/
 035486号パンフレットから知られた) 2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-
 N-エチルベンゼンスルホンアミド、(国際公開第2007/057407号パンフレ
 ットから知られた) 4-(ジフルオロメトキシ)-N-エチル-N-メチル-1, 2-ベン

10

20

30

40

50

ゴチアゾール-3-アミン1, 1-ジオキサイド、(国際公開第2008/104503号パンフレットから知られた) N-[1-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-(3, 5-ジメチルフェニル)エチル]-4, 5-ジヒドロ-1, 3-チアゾール-2-アミン、(国際公開第2003/106457号パンフレットから知られた) {1'-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパー-2-エン-1-イル]-5-フルオロスピロ[インドール-3, 4-ピペリジン]1(2H)-イル} (2-クロロピリジン-4-イル)メタノン、(国際公開第2009/049851号パンフレットから知られた) 3-(2, 5-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ[4.5]デカー-3-エン-2-オン、(国際公開第2009/049851号パンフレットから知られた) 炭酸3-(2, 5-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ[4.5]デカー-3-エン-4-イル-エチル、(国際公開第2004/099160号パンフレットから知られた) 4-(ブター-2-イン-1-イルオキシ)-6-(3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル)-5-フルオロピリミジン、(国際公開第2005/063094号パンフレットから知られた) (2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5-オクタフルオロペンチル) (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル、(国際公開第2005/063094号パンフレットから知られた) (2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5-オクタフルオロペンチル) (3, 3, 4, 4, 4-ペンタフルオロブチル) マロノニトリル、(国際公開第2007/040280号パンフレットから知られた) 8-[2-(シクロプロピルメトキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-3-[6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-イル]-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン、(特開2008/110953号公報から知られた) 炭酸2-エチル-7-メトキシ-3-メチル-6-[(2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシ-6-イル)オキシ]-キノリン-4-イルメチル、(特開2008/110953号公報から知られた) 酢酸2-エチル-7-メトキシ-3-メチル-6-[(2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-2, 3-ジヒドロ-1, 4-ベンゾジオキシ-6-イル)オキシ]キノリン-4-イル、(特開2010/018586号公報から知られた) PF1364 (CAS Reg. No. 1204776-60-2)、(国際公開第2007/075459号パンフレットから知られた) 5-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ベンゾニトリル、(国際公開第2007/075459号パンフレットから知られた) 5-[5-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ベンゾニトリル、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-{2-オキソ-2-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ]エチル}ベンズアミド、(全てが国際公開第2010/005692号パンフレットから知られた) 4-{[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル] (シクロプロピル) アミノ}-1, 3-オキサゾール-2-(5H)-オン、4-{[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル] (2, 2-ジフルオロエチル) アミノ}-1, 3-オキサゾール-2-(5H)-オン、4-{[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル] (エチル) アミノ}-1, 3-オキサゾール-2-(5H)-オン、4-{[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル] (メチル) アミノ}-1, 3-オキサゾール-2-(5H)-オン、(国際公開第2002096882号パンフレットから知られた) NNI-0711、(国際公開第2002096882号パンフレットから知られた) 1-アセチル-N-[4-(1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-メトキシプロパン-2-イル)-3-イソブチルフェニル]-N-イソブチリル-3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 2-[2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-クロロ-3

10

20

30

40

50

-メチルベンゾイル] 2-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチル、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 2-[2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル} アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 2-[2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル} アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 2-[3, 5-ジブromo-2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル} アミノ)ベンゾイル]-1, 2-ジエチルヒドラジンカルボン酸メチル、(国際公開第2005/085216号パンフレットから知られた) 2-[3, 5-ジブromo-2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル} アミノ)-ベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル、(国際公開第2007/101369号パンフレットから知られた) (5RS, 7RS; 5RS, 7SR)-1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-7-メチル-8-ニトロ-5-プロポキシイミダゾ [1, 2-a]ピリジン、(国際公開第2010/006713号パンフレットから知られた) 2-{6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1, 3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-イル}ピリミジン、(国際公開第2010/006713号パンフレットから知られた) 2-{6-[2-(ピリジン-3-イル)-1, 3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-イル}ピリミジン、(国際公開第2010/069502号パンフレットから知られた) 1-(3-クロロピリジン-2-イル)-N-[4-シアノ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-3-{[5-(トリフルオロメチル)-1H-テトラゾール-1-イル]メチル}-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(国際公開第2010/069502号パンフレットから知られた) 1-(3-クロロピリジン-2-イル)-N-[4-シアノ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-3-{[5-(トリフルオロメチル)-2H-テトラゾール-2-イル]-メチル}-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(国際公開第2010/069502号パンフレットから知られた) N-[2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-シアノ-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-{[5-(トリフルオロメチル)-1H-テトラゾール-1-イル]メチル}-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、および(国際公開第2010/069502号パンフレットから知られた) N-[2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-シアノ-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-{[5-(トリフルオロメチル)-2H-テトラゾール-2-イル]メチル}-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド。

【0254】

本発明の好ましい実施形態において、作用を増強させるために、浸透剤を作物保護組成物に加えてもよい。有用な浸透剤は、例えば、スプレーコーティングにおいて式(I)の化合物の有効性を増強させる物質も含む。これらは、例えば、鉱油および植物油を含む。有用な油は、典型的には、農薬組成物で使用する事ができる全ての鉱油または植物油-修飾されたもの、またはそうでないものを含む。その例は、ヒマワリ油、菜種油、オリーブ油、ヒマシ油、セイヨウアブラナ油、綿実油、トウモロコシ種子油、綿実油および大豆油、または述べた油のエステルを含む。菜種油、ヒマワリ油、それらのメチルエステルまたはエチルエステル、特に、菜種油メチルエステルが好ましい。

【0255】

本発明の組成物における浸透剤の濃度は広い範囲内で変化させることができる。処方された作物保護組成物の場合には、それは、一般には、1から95重量%、好ましくは1から55重量%、より好ましくは15から40重量%である。直ぐに使える組成物(噴霧液)においては、濃度は一般には0.1および10g/Lの間、好ましくは0.5および5

10

20

30

40

50

g / Lの間である。

【0256】

殺虫剤として用いる場合、本発明の有効成分はそれらの商業的に入手可能な製剤にて、およびこれらの製剤から調製された使用形態にて、共力剤との混合物として存在させてもよい。共力剤は、加えられる共力剤それ自体が活性である必要性はなく、有効成分の作用を増強させる化合物である。

【0257】

殺虫剤として用いる場合、本発明の有効成分はそれらの商業的に入手可能な製剤にて、およびこれらの製剤から調製された使用形態において、植物の環境において、および植物の部分の表面上で、または植物の組織においての使用後に有効成分の分解を低下させる阻

10

【0258】

商業的に入手可能な製剤から調製された使用形態の有効成分の含有量は広い限界内で変化させてもよい。適用形態の有効成分の濃度は、0.00000001から95重量%、好ましくは0.00001および1重量%の間の有効成分であってよい。

【0259】

化合物は、使用形態に適した慣用的な様式で使用される。

【0260】

植物病の制御に必要な濃度における有効成分の良好な植物適合性は、地上植物部分の、植物および種子の、および土壌の処理を可能とする。

20

【0261】

植物および植物部分の有効成分での本発明の処理は、直接的に、またはそれらが、慣用的な処理方法によって、例えば、ディッピング、スプレーイング、蒸発、噴霧、散布、塗装、注入によって、および増殖材料の場合には、特に、種子の場合には、1以上のコーティングを適用することによって、周囲、生息地または貯蔵空間に作用するのを可能とすることによって行われる。

【0262】

全ての植物および植物部分は当該発明に従って処理することができる。植物は、ここでは、望まれるおよび望まない野生植物、または（天然に生じる作物植物を含めた）作物植物のような、全ての植物および植物の集団を意味すると理解される。作物植物は、慣用的な育種および最適化方法によって、またはトランスジェニック植物を含めた、および植物育種者の権利によって保護可能な、および保護可能でない植物品種を含めた、バイオテクノロジーおよび遺伝子工学方法またはこれらの方法の組合せによって得ることができる植物であってよい。植物の部分は、苗条、葉、花および根のような、植物の全ての地上および地下部分および器官を意味すると理解されるべきであり、その例は葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、および根、塊茎および地下茎を含む。植物の部分は、収穫された材料および栄養および生殖繁殖材料、例えば、挿木、塊茎、地下茎、接ぎ穂および種子も含む。

30

【0263】

本発明に従って処理することができる植物は以下の：バラ科各種（Rosaceae sp.）（例えば、リンゴおよびナシのようなナシ状果のみならず、アプリコット、チェリー、アーモンドおよびモモのような核果、およびイチゴのような柔軟な果実）、リベシオイダエ科各種（Ribesioideae sp.）、クルミ科各種（Juglandaceae sp.）、カバノキ科各種Betulaceae sp.）、ウルシ科各種（Anacardiaceae sp.）、ブナ科各種（Fagaceae sp.）、クワ科各種（Moraceae sp.）、モクセイ科各種（Oleaceae sp.）、マタタビ科各種（Actinidaceae sp.）、クスノキ科各種（Lauraceae sp.）、バショウ科各種（Musaceae sp.）（例えば、バナナ植物およびバナナプランテーション）、アカネ科各種（Rubiaceae sp.）（例えば、コーヒー）、ツバキ科各種（Theaceae sp.）、アオギリ科各種（St

40

50

eruliceae sp.)、ミカン科各種(Rutaceae sp.) (例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ)；ナス科各種(Solanaceae sp.) (例えば、トマト)、ユリ科各種(Liliaceae sp.)、キク科各種(Asteraceae sp.) (例えば、レタス)、セリ科各種(Umbelliferae sp.)、アブラナ科各種(Cruciferae sp.)、アカザ科各種(Chenopodiaceae sp.)、ウリ科各種(Cucurbitaceae sp.) (例えば、キュウリ)、ネギ科各種(Alliaceae sp.) (例えば、ニラ、タマネギ)、マメ科各種(Papilionaceae sp.) (例えば、エンドウ)のような綿、亜麻、ブドウ、果実、野菜；イネ科各種(Gramineae sp.) (例えば、トウモロコシ、芝、小麦、ライ麦、米、大麦、オート麦、キビおよびライ小麦のような穀物)、イネ科各種(Poaceae sp.) (例えば、サトウキビ)、キク科各種(Asteraceae sp.) (例えば、ヒマワリ)、アブラナ科各種(Brassicaceae sp.) (例えば、白色キャベツ、赤色キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、チンゲン菜、コールラビ、ダイコン、およびアブラナ、辛子、セイヨウワサビおよびクレソン)、マメ科各種(Fabaceae sp.) (例えば、エンドウ、落花生)、マメ科各種(Papilionaceae sp.) (例えば、大豆)、ナス科各種(Solanaceae sp.) (例えば、トマト)、アカザ科各種(Chenopodiaceae sp.) (例えば、サトウダイコン、飼料ビート、フダンソウ、ビートの根)のような主な作物植物；庭および森林における有用な植物および観葉植物；およびこれらの植物の各々の遺伝子的に修飾されたタイプを含む。

10

20

【0264】

既に先に述べたように、本発明に従って全ての植物およびそれらの部分を処理するのが可能である。好ましい実施形態において、野生の植物種および植物の栽培品種、または交雑またはプロトプラストの融合のような慣用的な生物学的育種方法によって得られたもの、およびその部分が処理される。さらに好ましい実施形態において、適切であれば、慣用的な方法と組み合わせた遺伝子工学によって得られたトランスジェニック植物および植物栽培品種(遺伝的に修飾された生物)、およびその部分が処理される。用語「部分」または「植物の部分」または「植物部分」は前記で説明した。より好ましくは、各々が商業的に入手可能であるか、または用いられている植物栽培品種の植物は本発明に従って処理される。植物栽培品種は、新しい特性(「形質」)を有し、かつ慣用的な育種によって、突然変異によって、または組換えDNA技術によって得られた植物を意味すると理解される。それらは栽培品種、品種、バイオまたは遺伝子型であり得る。

30

【0265】

本発明の処理方法は、遺伝子的に修飾された生物(GMO)、例えば、植物または種子の処理で用いることができる。遺伝的に修飾された植物(またはトランスジェニック植物)は、異種遺伝子がゲノムに安定に組み込まれた植物である。表現「異種遺伝子」は、植物の外部で供され、または組み立てられ、かつ核、葉緑体またはミトコンドリアゲノムに導入された場合に、注目する蛋白質またはポリペプチドを発現させることによって、または(例えば、アンチセンス技術、共抑制技術またはRNAi技術[RNA干渉]を用いて)植物に存在する他の遺伝子をダウンレギュレートし、またはサイレントとすることによって、新しいまたは改良された農学的または他の特性を形質転換された植物に与える遺伝子を実質的に意味する。ゲノムに存在する異種遺伝子は導入遺伝子とも呼ばれる。植物ゲノムにおけるその特異的存在によって定義される導入遺伝子は形質転換または遺伝子導入イベントと呼ばれる。

40

【0266】

植物の種または植物の品種、それらの位置および成長条件(土壌、気候、生育期、飼料)に依存して、本発明による処理の結果、超相加的(「相乗的」)効果ももたらされ得る。例えば、現実に予測される効果を超える以下の効果が可能である：低下した施用量および/または活性スペクトルの拡大および/または本発明に従って用いることができる有効成分および組成物の活性の増加、良好な植物の成長、高温または低温に対する増大した許

50

容性、干ばつに対する、または水または土壌の塩含有量に対する増大した許容性、増大した開花性能、より容易な収穫、加速された成熟、より高い収穫収率、より大きな果実、より丈の高い植物、より緑色の葉の色、より早い開花、より高い品質および／または収穫された産物のより高い栄養価、果実内のより高い糖の濃度、良好な貯蔵安定性および／または収穫された産物の加工性。

【0267】

特定の施用量において、本発明の有効成分は植物に対して強化効果も有することができる。それらは、従って、望まない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスによる攻撃に対して植物の防御系を動員させるのに適している。これは、例えば、真菌に対する本発明の組合せの増強された活性についての理由の1つであり得る。植物一強化（抵抗性－誘導）物質は、本発明との関係では、望まない植物病原性真菌を引き続いて接種した場合に、処理された植物が望まない植物病原性真菌に対して実質的な程度の抵抗性を示すように、植物の防御系を刺激することができる物質、または物質の組合せも意味すると理解されるべきである。従って、本発明の物質は、処理後のある期間内に述べられた病原体による攻撃から植物を保護するのに用いることができる。その間に保護が達成される期間は、一般に、有効成分での植物の処理後1から10日、好ましくは1から7日の間に及ぶ。

【0268】

好ましくは本発明に従って処理される植物および植物品種は、（育種および／またはバイオテクノロジーの手段によって得られたかを問わず）特に有利な有用な特徴をこれらの植物に付与する遺伝物質を有する全ての植物を含む。

【0269】

同様に、当該発明に従って好ましくは処理される植物および植物の品種は1以上の生物学的ストレス因子に対して抵抗性であり、すなわち、該植物は、線虫、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌、ウイルスおよび／またはウイロイドに対するような、動物および微生物害虫に対する良好な防御を有する。

【0270】

当該発明に従ってやはり処理することができる植物および植物品種は、1以上の非生物学的ストレス因子に対して抵抗性である植物である。非生物学的ストレス条件は、例えば、干ばつ、低温への暴露、熱暴露、浸透圧ストレス、湿地状態、増大した土壌の塩度、増大したミネラルへの暴露、オゾンへの暴露、強い光への暴露、窒素栄養素の制限された利用性、リン栄養素の制限された利用性または日陰の回避を含むことができる。

【0271】

同様に、当該発明に従って処理することができる植物および植物品種は、増強された収率特徴によって特徴付けられる植物である。これらの植物における増強された収率は、例えば、水使用効率、水保持効率、改良された窒素の使用、増強された炭素同化、改良された光合成、増大した発芽効率および加速された成熟のような、改良された植物の生理学、改良された植物の成長および発生の結果であり得る。収率は、早い開花、ハイブリッド種子生産についての開花制御、実生の活力、植物のサイズ、節間数および距離、根の成長、種子のサイズ、果実のサイズ、莢のサイズ、莢または穂の数、莢または穂当たりの種子の数、種子の質量、増強された種子充填、低下した種子分散、低下した莢の裂開、および倒伏抵抗性を含めた、（ストレスおよび非ストレス条件下での）改良された植物構成によってやはり影響され得る。さらなる収率の特色は、炭水化物の含有量、蛋白質の含有量、油含有量および組成、栄養価、抗一栄養化合物の低下、改良された加工性および良好な貯蔵安定性などの種子組成を含む。

【0272】

本発明に従って処理することができる植物は、既に雑種強勢の特徴、または雑種効果を発現するハイブリッド植物であり、その結果、一般には、より高い収率、活力、健康、および生物および無生物ストレス因子に対する抵抗性がもたらされる。そのような植物は、典型的には、雄性不稔交配母体近交系（inbred male sterile pa

10

20

30

40

50

rent line) (雌性親) をもう1つの雄性稔性交配母体近交系 (inbred male fertile parent line) (雄性親) と交雑させることによって生産される。ハイブリッド種子は、典型的には、雄性不稔植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、時々、(例えば、トウモロコシにおいて)、雄穂除去(すなわち、雄性繁殖器官または雄花の機械的な除去)によって生産することができ; しながら、雄不稔性にとって、植物ゲノムにおける遺伝子決定基の結果であるのがより典型的である。その場合、特に、種子がハイブリッド植物から収穫されるべき所望の産物である場合、典型的には、雄不稔性を担う遺伝子決定基を含有する、ハイブリッド植物における雄性稔性が十分に回復されるのを確実にするのが都合がよい。これには、雄親が、雄不稔性を担う遺伝子決定基を含有するハイブリッド植物において雄性稔性を回復することができる適切な稔性回復体遺伝子を有することを確実にすることによって達成することができる。雄性不稔性についての遺伝子決定基は細胞質に位置させることができる。細胞質雄性不稔(CMS)の例は、例えば、アブラナ種(Brassica species)について記載されている。しかしながら、雄性不稔性についての遺伝子決定基は核ゲノムに位置させることもできる。雄性不稔性植物は、遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得ることもできる。雄性不稔性植物を得る特に有用な手段は国際公開第89/10396号パンフレットに記載されており、例えば、バルナーゼのようなりボヌクレアーゼが雄蕊中のタペータム細胞において選択的に発現される。次いで、稔性は、バルスターのようなりボヌクレアーゼ阻害剤のタペータム細胞における発現によって回復させることができる。

10

20

【0273】

本発明に従って処理することができる(遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた)植物または植物品種は除草剤一耐性植物、すなわち、1以上の所与の除草剤に対して耐性とされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって、またはそのような除草剤耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

【0274】

除草剤一耐性植物は、例えば、グリホセート耐性植物、すなわち、除草剤グリホセートまたはその塩に対して耐性とされた植物である。例えば、グリホセート耐性植物は、植物を、酵素5-エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ(EPSPS)をコードする遺伝子で形質転換することによって得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィウム(Salmonella typhimurium)のAroA遺伝子(突然変異体CT7)、細菌アグロバクテリウム属各種(Agrobacterium sp.)のCP4遺伝子、ペチュニアEPSPS、トマトEPSPS、またはオヒシバ属EPSPSをコードする遺伝子である。それは突然変異したEPSPSでもあり得る。グリホセート耐性植物は、グリホセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、前記した遺伝子の天然に生じる突然変異を含有する植物を選択することによって得ることもできる。

30

40

【0275】

他の除草剤一抵抗性植物は、例えば、ビアラホス、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートのような酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤に対して耐性とされている植物である。そのような植物は、除草剤を解毒する酵素または阻害に対して抵抗性である突然変異体グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって得ることができる。1つのそのような効果的な解毒酵素(例えば、ストレプトマイセス属各種(Streptomyces)からのbarまたはpat蛋白質のような)は、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である。外因性ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は記載されている。

【0276】

50

さらなる除草剤－耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ（H P P D）を阻害する除草剤に対して耐性とされた植物でもある。ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼは、パラ－ヒドロキシフェニルピルベート（H P P）がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。H P P D阻害剤に対して耐性である植物は、天然に生じる抵抗性H P P D酵素をコードする遺伝子、または突然変異したH P P D酵素をコードする遺伝子で形質転換することができる。H P P D阻害剤に対する耐性は、植物を、H P P D阻害剤による天然H P P D酵素の阻害にも拘わらずホモゲンチセートの形成を可能とするある種の酵素をコードする遺伝子で形質転換することによって得ることもできる。H P P D阻害剤に対する植物の耐性は、植物を、H P P D－耐性酵素をコードする遺伝子に加えて、酵素プレフェン酸デヒドロゲナーゼをコードする遺伝子で形質転換することによって改良することもできる。

10

【0277】

さらなる除草剤－抵抗性植物は、アセト乳酸シンターゼ（A L S）阻害剤に対して耐性とされた植物である。公知のA L S阻害剤は、例えば、スルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン、オキシ（チオ）安息香酸ピリミジニル、および／またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン除草剤を含む。（アセトヒドロキシ酸シンターゼ、A H A Sとしても知られた）A L S酵素における異なる突然変異は、異なる除草剤および除草剤の群に対して耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素－耐性植物およびイミダゾリノン－耐性植物の生産は、国際公開第1996/033270号パンフレットに記載されている。さらなるスルホニル尿素－およびイミダゾリノン－耐性植物もまた、例えば、国際公開第2007/024782号パンフレットに記載されている。

20

【0278】

イミダゾリノンおよび／またはスルホニル尿素に対して耐性である他の植物は、誘導された突然変異誘発によって、除草剤の存在下での細胞培養における選択によって、または突然変異育種によって得ることができる。

【0279】

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物栽培品種は昆虫－抵抗性トランスジェニック植物、すなわち、ある種の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性とされた植物である。そのような植物は遺伝子形質転換によって、またはそのような昆虫抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

30

【0280】

本発明との関係では、用語「昆虫－抵抗性トランスジェニック植物」は、以下のものをコードするコーディング配列を含む少なくとも1つの導入遺伝子を含有するいずれの植物も含む：

1) http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/における殺虫性結晶蛋白質編集オンライン、またはその殺虫性部分、例えば、Cry蛋白質クラスCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3AeまたはCry3Bbの蛋白質、またはその殺虫性部分のような、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）からの殺虫性結晶蛋白質またはその殺虫性部分；または

40

2) Cy34およびCy35結晶蛋白質よりなる二元トキシンのような、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）またはその部分よりも第二の他の結晶蛋白質の存在下で殺虫性であるバシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）またはその部分からの結晶蛋白質；または

3) 前記1)の蛋白質のハイブリッドまたは前記2)の蛋白質のハイブリッド、例えば、トウモロコシイベントMON98034（国際公開第2007/027777号パンフレット）によって生産されたCry1A.105蛋白質のような、*Bacillus thuringiensis*からの2つの異なる殺虫性結晶蛋白質の部分を含むハイブリッド殺虫性蛋白質；または

50

4) いくつかの、特に、1から10のアミノ酸がもう1つのアミノ酸によって置き換えられて、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性が得られ、および／または影響される、および／またはトウモロコシイベントMON863またはMON88017におけるCry3Bb1蛋白質、またはトウモロコシイベントMIR604におけるCry3A蛋白質のような、クローニングまたは形質転換の間にコーディングDNAにおいて誘導された変化のため、標的昆虫種の範囲を拡大する前記ポイント1)から3)のいずれか1つの蛋白質；または

5) http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.htmlにおいてリストされた植物昆虫蛋白質(VIP)、例えば、VIP3Aa蛋白質クラスからの蛋白質のような、バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)またはバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)からの殺虫性分泌蛋白質、またはその殺虫性部分；または

6) VIP1AおよびVIP2A蛋白質よりなる二元トキシンのような、バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)またはバシルス・セレウス(*B. cereus*)からの第二の分泌蛋白質の存在下で殺虫性であるバシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)またはバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)からの分泌蛋白質；

7) 前記1)における蛋白質のハイブリッド、または前記2)における蛋白質のハイブリッドのような、バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)またはバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)からの異なる分泌蛋白質からの部分を含むハイブリッド昆虫蛋白質；または

8) いくつかの、特に、1から10のアミノ酸がもう1つのアミノ酸によって置き換えられて、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性が得られ、および／または綿イベントCOT102におけるVIP3Aa蛋白質のような、(依然として殺虫性蛋白質をコードしつつ)影響された、および／またはクローニングまたは形質転換の間にコーディングDNAにおいて誘導された変化のため、標的昆虫種の範囲を拡大する、前記ポイント1)から3)のいずれか1つの蛋白質。

【0281】

勿論、昆虫一抵抗性トランスジェニック植物は、本明細書中で用いられるように、前記クラス1から8のいずれか1つの蛋白質をコードする遺伝子の組合せを含むいずれの植物も含む。1つの実施形態において、昆虫一抵抗性植物は、前記クラス1から8のいずれか1つの蛋白質をコードする1を超える導入遺伝子を含有して、同一の標的昆虫種に対して殺虫性であるが、昆虫における異なる受容体結合部位への結合のような異なる作用の態様を有する異なる蛋白質を用いることによって、影響される標的昆虫種の範囲を拡大し、または植物に対する昆虫抵抗性の発生を遅らせる。

【0282】

当該発明に従ってやはり処理することができる(遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られる)植物または植物培養品種は非生物学的ストレス因子に対して耐性である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって、またはそのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって、得ることができる。特に有用なストレス耐性植物は以下のものを含む：

a. 植物細胞または植物においてポリ(ADP-リボース)ポリメラーゼ(PARP)遺伝子の発現および／または活性を低下させることができる導入遺伝子を含有する植物；

b. 植物または植物細胞のPARG-コーディング遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるストレス耐性増強導入遺伝子を含有する植物；

c. ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンターゼまたはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを含めた、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物一機能的酵素をコードするス

トレス耐性—増強導入遺伝子を含有する植物。

【0283】

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られる）植物または植物栽培品種は、収穫された産物の改変された量、質および／または貯蔵安定性、および／または以下のごとき収穫された産物の特異的成分の改変された特性を示す（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物培養品種：

1) この修飾された澱粉がある種の適用に良好に適するように、野生型植物細胞または植物における合成された澱粉と比較して、澱粉のその化学物理的特色、特に、アミロース含有量またはアミロース／アミロペプチン比率、分岐の程度、平均鎖長、側鎖の分布、粘度挙動、ゲル抵抗性、粒のサイズおよび／または粒形態に関して改変された修飾された澱粉を合成するトランスジェニック植物。

2) 遺伝子的修飾がない野生型植物と比較して、非澱粉炭水化物ポリマーを合成し、または改変された特性を持つ非澱粉炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。その例は、特にイヌリンおよびレバンタイプのポリフルクトースを生産する植物、アルファ-1, 4-グルカンを生産する植物、アルファ-1, 6-分岐アルファ-1, 4-グルカンを生産する植物、およびアルターナンを生産する植物である。

3) ヒアルロナンを生産するトランスジェニック植物

当該発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物栽培品種は、改変された繊維特徴を持つ綿植物のような植物である。そのような植物は、遺伝子的形質転換によって、またはそのような改変された繊維特徴を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ、これは以下のものを含む：

- a) セルロースシンターゼ遺伝子の改変された形態を含有する綿植物のような植物；
- b) r s w 2 または r s w 3 相同核酸の改変された形態を含有する綿植物のような植物；
- c) スクロースリン酸シンターゼの増大した発現を持つ綿植物のような植物；
- d) スクロースシンターゼの増大した発現を持つ綿植物のような植物；
- e) 例えば、繊維—選択的 β -1, 3-グルカナーゼのダウンレギュレーションを介して、繊維細胞の基部における原形質連絡のゲーティングのタイミングが改変される、綿植物のような植物；
- f) 例えば、n o d C およびキチンシンターゼ遺伝子を含めたN-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子の発現を介した改変された反応性を持つ繊維を有する綿植物のような植物。

【0284】

当該発明に従ってやはり処理することができる（遺伝子工学のような植物バイオテクノロジー方法によって得られた）植物または植物培養品種は、改変された油プロファイル特徴を持つ、アブラナまたは関連するアブラナ属植物のような植物である。そのような植物は遺伝子的形質転換によって、またはそのような改変された油特徴を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることもでき、以下のものを含む：

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を生産する、ナタネ植物のような植物；
- b) 低いリノレン酸含有量を有する油を生産する、ナタネ植物のような植物；
- c) 低いレベルの飽和脂肪酸を有する油を生産する、ナタネ植物のような植物。

【0285】

当該発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、1以上のトキシンをコードする1以上の遺伝子を含む植物であり、以下の商品名の下で販売されているトランスジェニック植物である：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）、B i t e G a r d（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、B T - X t r a（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、S t a 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）、N u c o t n

33B（登録商標）（綿）、NatureGard（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Protecta（登録商標）およびNewLeaf（登録商標）（イモ）。言及すべき除草剤－耐性植物の例は以下の商品名で入手可能なトウモロコシ品種、綿品種および大豆品種である。Roundup Ready（登録商標）（グリホセートに対する許容性、例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノンに対する耐性）およびSCS（登録商標）（スルホニル尿素、例えば、トウモロコシに対する耐性）。言及すべき除草剤－抵抗性植物（除草剤耐性に対して慣用的な様式で育種した植物）は、Clearfield（登録商標）名称（例えば、トウモロコシ）下で販売される品種を含む。

10

【0286】

当該発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換イベント、または形質転換イベントの組合せを含有し、例えば、種々の国家または地域の規制機関についてのデータベース（例えば、http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspxおよび<http://www.agbios.com/database.php>参照）にリストされた植物である。

【0287】

リストされた植物は、当該発明に従って、一般式（I）の化合物および／または有効成分の混合物で特に有利な様式にて当該発明に従って処理することができる。有効成分または混合物についての先に述べた好ましい範囲もまたこれらの植物の処理に適用される。特に強調する部分は、本テキストにて具体的に述べられた化合物または混合物での植物の処理についてである。

20

【0288】

本発明の有効成分は、植物、衛生および貯蔵された産物の害虫に対するのみならず、マダニ類、ヒメダニ類、キュウセンヒゼンダニ、ハダニ、ハエ（刺咬および舐め）、寄生性ハエ幼虫、シラミ、毛髪シラミ、羽ジラミおよびノミのような、動物寄生虫（外部および内部寄生虫）に対する動物薬部門においても作用する。これらの寄生虫は以下のものを含む：

シラミ（Anoplurida）目からの、例えば、ヘマトピナス属種（Haematopus spp.）、リノグナサス属種（Linognathus spp.）、ペディキュラス属種（Pediculus spp.）、フチラス属種（Phtirus spp.）およびソレノポテス属種（Solenopotes spp.）。

30

【0289】

ハジラミ（Mallophagida）目およびマルツノハジラミ亜目（Amblycerina）およびホソツノハジラミ亜目（Ischnocerina）からの、例えば、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネッキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）およびフェリコラ属種（Felicola spp.）。

40

【0290】

双翅（Diptera）目および長角類亜目（Nematocerina）および短角類亜目（Brachycerina）からの、例えば、イーデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、キュレックス属種（Culex spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、ユーシムリウム属種（Eusimulium spp.）、フレボトムス属種（Phlebotomus spp.）、ルツゾミヤ属種（Lutzomyia spp.）、キュリコイデス属種（Culicoides spp.）、クリソプス属種（Chrysops spp.）、ヒボミトラ属種（Hybomitra spp.）、アチロータス属種（Atylo

50

tus spp.)、タバヌス属種 (Tabanus spp.)、ヘマトポタ属種 (Haematopota spp.)、フィリポミア属種 (Philipomyia spp.)、ブラウラ属種 (Braula spp.)、ムスカ属種 (Musca spp.)、ヒドロタエア属種 (Hydrotaea spp.)、ストモキシス属種 (Stomoxys spp.)、ヘマトビア属種 (Haematobia spp.)、モレリア属種 (Morellia spp.)、ファニア属種 (Fannia spp.)、グロッシナ属種 (Glossina spp.)、カリホラ属種 (Calliphora spp.)、ルチリア属種 (Lucilia spp.)、クリソミア属種 (Chrysomyia spp.)、ウォールファルチア属種 (Wohlfahrtia spp.)、サルコフォガ属種 (Sarcophaga spp.)、エストラス属種 (Oestrus spp.)、ヒポデルマ属種 (Hypoderma spp.)、ガステロフィラス属種 (Gasterophilus spp.)、ヒッポボスカ属種 (Hippobosca spp.)、リポプテナ属種 (Lipoptena spp.) およびメロファガス属種 (Melophagus spp.)。

10

【0291】

ノミ (Siphonapterida) 目からの、例えば、ピューレクス属種 (Pulex spp.)、クテノセファリデス属種 (Ctenocephalides spp. (Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis)、キセノプシラ属種 (Xenopsylla spp.) およびセラトフィラス属種 (Ceratophyllus spp.)。

20

【0292】

異翅 (Heteropterida) 目からの、例えば、シメックス属種 (Cimex spp.)、トリアトマ属種 (Triatoma spp.)、ロドニウス属種 (Panstrongylus spp.) および Panstrongylus spp.)。

【0293】

ゴキブリ (Blattarida) 目からの、例えば、ブラタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ペリプラネタ・アメリカーナ (Periplaneta americana)、ブラテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica) およびスベラ種 (Supella spp.)。

30

【0294】

ダニ類 (Acarina) (ダニ類 (Acarina)) の亜綱およびマダニ (Metastigmata) 目およびトゲダニ (Mesostigmata) 目からの、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドラス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、ブーフイラス属種 (Boophilus spp.)、デルマセントール属種 (Dermacentor spp.)、ヘモフィサリス属種 (Haemophysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、リピセファラス属種 (Rhipicephalus spp.)、デルマニサス属種 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、ニューモニサス属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストーマ属種 (Sternostoma spp.) およびバロア属種 (Varroa spp.)。

40

【0295】

ケダニ (Actiniedida) (前気門類 (Prostigmata)) および回虫 (Acaridida) (コナダニ (Astigmata)) 目から、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、オルニソケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、プソレルゲーツ属種 (Psorergates spp.)、デモデックス属種 (Demodex spp.)、トロンビキュラ

50

属種 (*Trombicula* spp.)、リストロホラス属種 (*Listrophorus* spp.)、アカラス属種 (*Acarus* spp.)、チロファガス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリファス属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリカス属種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエド레스属種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cytodites* spp.) およびラミノシオプテス属種 (*Laminosioptes* spp.)。

10

【0296】

式 (I) の本発明の有効成分は、例えば、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、バッファロー、ウサギ、ニワトリ、七面鳥、アヒル、ガチョウ、ミツバチのような農業家畜、例えば、イヌ、ネコ、愛玩鳥、観賞魚等のペットおよび、例えば、ハムスター、モルモット、ラットおよびマウスのような実験動物を攻撃する節足動物を防除するのにも適している。これらの節足動物の防除は、死亡例および (肉、乳、羊毛、皮革、卵、蜂蜜等の) の生産性低下を軽減させることを意図しており、従って、より経済的かつより容易な動物飼育が本発明の有効成分の使用によって可能である。

【0297】

本発明の有効成分は、例えば、錠剤、カプセル、頓服水剤、水薬、顆粒、ペースト、ボラス、フィードスループロセスおよび坐薬の形態での腸投与によって、例えば、注射 (筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等)、インプラントによる、経鼻投与による、例えば、首輪、耳標、尾標、足輪、端綱、印付け用具等のような、有効成分を含有する成形された製品の助けも借りて、例えば、浸漬または液浸、噴霧、滴下 (pouring on) および点投与 (spotting on)、洗浄および散粉の形での皮膚投与による等の非経口投与によって、公知の様式で動物部門および動物飼育において用いられる。

20

【0298】

家畜、家禽、ペット等で用いる場合、式 (I) の有効成分は、1 から 80 重量%の量の有効成分を含む製剤 (例えば、例えば、粉剤、乳濁液、フロアブル剤) として、直接的に、または 100 から 10000 倍希釈後に用いることができ、またはそれらは薬浴として用いてもよい。

30

【0299】

また、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も判明した。

【0300】

好ましいが非限定的例は以下の昆虫を含む：

ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルフォビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌス・ペクチコルニス (*Ptilinus pecticornis*)、デンドロビウム・ペルチネキス (*Dendrobium pertinex*)、エルノビウス・モリス (*Ernobius mollis*)、プリオビウム・カルピニ (*Priobium carpini*)、リクツス・ブルネウス (*Lyctus brunneus*)、リクツス・アフリカヌス (*Lyctus africanus*)、リクツス・プラニコリス (*Lyctus planicollis*)、リクツス・リネアリス (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテス・ルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キシレボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monac*

40

50

hus)、ボストリクス・カプシンス(*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルネウス(*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種(*Sinoxylon spec.*)、ジノデルス・ミヌツス(*Dinoderus minutus*)のような甲虫類(*beetles*)；

シレクス・ジュベックス(*Sirex juvenicus*)、*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス(*Urocerus gigas taignus*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス(*Urocerus augur*)のようなハサミムシ類(*dermapterans*)；

カロテルメス・フラビコリス(*Kaloterme flavicollis*)、クリプトテルメス・ブレビス(*Cryptoterme brevis*)、ヘテロテルメス・インジコラ(*Heteroterme indicola*)、レチクリテルメス・フラビペス(*Reticuliterme flavipes*)、レチクリテルメス・サントネンシス(*Reticuliterme santonensis*)、レチクリテルメス・ルシフグス(*Reticuliterme lucifugus*)、マストテルメス・ダルウィニエンシス(*Mastoterme darwiniensis*)、ズーテルモプシス・ネバデンシス(*Zootermopsis nevadensis*)、コプトテルメス・フォルモサヌス(*Coptoterme formosanus*)のようなシロアリ類(*termites*)；

レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)のようなシミ類(*bristletails*)。

【0301】

本発明に関連して工業材料は、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙および厚紙、皮革、木材、加工された木材製品およびコーティング組成物のような非生物材料を意味すると理解される。

【0302】

即時使用できる組成物は、他の殺虫剤および1以上の殺真菌剤を含んでもよい。

【0303】

可能なさらなる混合相手」に関しては、先に述べた殺虫剤および殺真菌剤が参照される。

【0304】

同時に、本発明の化合物は、塩水または淡海水と接触する対象、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備および信号システムの汚れからの保護に使用することができる。

【0305】

加えて、本発明の化合物は、単独で、または他の有効成分との組合せで汚れ止め組成物として用いることができる。

【0306】

有効成分は、家庭内部門において、衛生部門において、および貯蔵された産物の保護において、動物害虫、特に、密閉された空間、例えば、家屋、ホール、オフィス、車両室等で見出される、昆虫、節足動物およびダニを防除するのにも適している。それらを用いて、これらの害虫を、単独で、または家庭用殺虫剤製品中の他の有効成分および補助物質と組み合わせて防除することができる。それらは感受性および抵抗性種に対して、および全ての発達段階に対して有効である。これらの害虫は以下のものを含む：

サソリ(*Scorpionidea*)目からの、例えば、ブツス・オッシタヌス(*Buthus occitanus*)。

ダニ(*Acarina*)目からの、例えば、アルガス・ペルシクス(*Argas persicus*)、アルガス・レフレキス(*Argas reflexus*)、ブリオビア属種(*Bryobia spp.*)、デルマニスス・ガリナエ(*Dermanyssus gallinae*)、グリシファグス・ドメスチクス(*Glyciphagus domesticus*)、オルニトドルス・モウバト(*Ornithodoros moub*

10

20

30

40

50

at)、リピセファルス・サンガイネウス (*Rhipicephalus sanguineus*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス (*Dermatophagoides pteronissimus*)、デルマトファゴイデス・ホリナエ (*Dermatophagoides forinae*)。

クモ (*Araneae*) 目からの、例えば、アビクラリイダエ (*Aviculariidae*)、アラネイダエ (*Araneidae*)。

メクラグモ (*Opiliones*) 目からの、例えば、シュウドスコルピオネス・ケリフェル (*Pseudoscorpiones chelifera*)、シュウドスコルピオネス・ケイリジウム (*Pseudoscorpiones cheiridium*)、オピリオネス・ファランギウム (*Opiliones phalangium*)。

等脚 (*Isopoda*) 目からの、例えば、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)。

倍脚 (*Diplopoda*) 目からの、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)、ポリデスムス属種 (*Polydesmus spp.*)。

唇脚 (*Chilopoda*) 目からの、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus spp.*)。

シミ (*Zygentoma*) 目からの、例えば、クテノレピスマ属種 (*Ctenolepisma spp.*)、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、レピスマデス・インクイリヌス (*Lepismodes inquilinus*)。

ゴキブリ (*Blattaria*) 目からの、例えば、ブラッタ・オリエンタリエス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahina*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属種 (*Panchlora spp.*)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・ブルネア (*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ (*Periplaneta fuliginosa*)、スベラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*)。

跳躍類 (*Saltatoria*) 目からの、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Achetia domesticus*)。

ハサミムシ (*Dermaptera*) 目からの、例えば、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)。

シロアリ (*Isoptera*) 目からの、例えば、カロテルメス属種 (*Kalotermea spp.*)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes spp.*)。

。チャタテムシ (*Psocoptera*) 目からの、例えば、レピナツス属種 (*Lepinatus spp.*)、リボセリス属種 (*Liposcelis spp.*)。

甲虫 (*Coleoptera*) 目からの、例えば、アントレヌス属種 (*Anthrenus spp.*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus spp.*)、デルメステス属種 (*Dermestes spp.*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ネクロビア属種 (*Necrobia spp.*)、プチヌス属種 (*Ptinus spp.*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)。

10

20

30

40

50

双翅 (Diptera) 目からの、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、カリフォラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、ファンニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*)、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、ストモキシス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)。

10

鱗翅 (Lepidoptera) 目からの、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビセリエラ (*Tineola biselliella*)。

20

ノミ (Siphonaptera) 目からの、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)。

膜翅類 (Hymenoptera) 目からの、例えば、カムポノツス・ヘルクレアヌス (*Camponotus herculeanus*)、ラシウス・フリギノス (*Lasius fuliginosus*)、ラシウス・ニゲル (*Lasius niger*)、ラシウス・ウムブラツス (*Lasius umbratus*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラベスプラ属種 (*Paravespula* spp.)、テトラモリウム・カエスピツム (*Tetramorium caespitum*)。

30

シラミ (Anoplura) 目からの、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス (*Pediculus humanus capitis*)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス (*Pediculus humanus corporis*)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、フィロエラ・バスタトリキス (*Phylloera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phthirus pubis*)。

異翅類 (Heteroptera) の目からの、例えば、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、ロジヌス・プロリキス (*Rhodinus prolixus*)、トリアトマ・インフェスタンス (*Triatoma infestans*)。

40

【0307】

家庭用殺虫剤の分野においては、それらは、単独で、あるいはリン酸エステル、カルバメート、ピレスロイド、ネオニコチノイド、成長調節剤または他の公知のクラスの殺虫剤からの有効成分のような他の適当な有効成分と組み合わせて用いられる。

【0308】

それらはエアロゾル、非圧縮スプレー製品、例えば、ポンプスプレーおよび噴霧スプレー、自動噴霧システム、噴霧器、泡剤、ゲル、セルローズまたはプラスチックで作成されたエバポレーター錠剤を備えたエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲルおよび膜エバポレーター、プロペラー駆動エバポレーター、無動力型 (energy-free)

50

または受動的蒸発システム、防虫紙 (moth papers)、防虫バッグ (moth bags) および防虫ゲル (moth gels) において、粒剤または粉剤として、ばら撒き用の餌または餌ステーションにおいて使用される。

【実施例】

【0309】

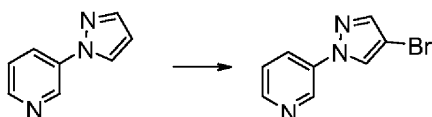
調製例

実施例 A : N - { 6 - [1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] ピリジン - 2 - イル } メタンスルホンアミド

段階 1 : 3 - (4 - ブロモピラゾール - 1 - イル) ピリジン

【0310】

【化 6 9】



3 - ピラゾール - 1 - イルピリジン (5 0 0 m g 、 3 . 4 4 ミリモル) をアセトニトリル (1 5 m l) に溶解させ、および硝酸セリウム (I V) アンモニウム (9 4 4 m g 、 1 . 7 2 ミリモル) を加えた (わずかに発熱) 。 N - ブロモスクシンイミド (7 3 6 m g 、 4 . 1 3 ミリモル) を何回かに分けて加え (わずかに発熱) 、および混合物を室温にて 3 0 分攪拌し、次いで、還流下で 3 時間加熱した。混合物を冷却した後、酢酸エチルを加えた。有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウム溶液で洗浄し、次いで、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下でロータリーエバポレーターにて除去した。

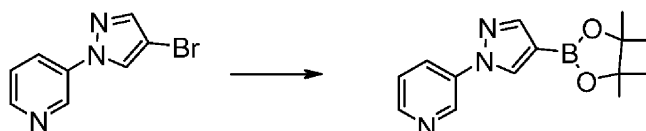
収率 : 7 5 0 m g (理論の 9 3 %) 、 l o g P (H C O O H) 1 . 5 6 、 [M ⁺ + 1] 2 2 4 . 0 。

¹ H NMR (d ₆ - DMSO) : 7 . 5 4 (m , 1 H) 、 7 . 9 0 (s , 1 H) 、 8 . 2 0 (m , 1 H) 、 8 . 5 5 (m , 1 H) 、 8 . 7 9 (s , 1 H) 、 9 . 0 6 (m , 1 H) 。

段階 2 : 3 - [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) ピラゾール - 1 - イル] ピリジン

【0311】

【化 7 0】



アルゴン下で、3 - (4 - ブロモピラゾール - 1 - イル) ピリジン (1 . 0 0 g 、 4 . 4 6 ミリモル) 、 1 , 1 ' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン (d p p f) (7 4 m g 、 0 . 1 3 ミリモル) 、 二塩化パラジウム - d p p f (1 0 9 m g 、 0 . 1 3 ミリモル) 、 酢酸カリウム (1 . 3 1 g 、 1 3 . 3 ミリモル) およびピナコラトジボラン (1 . 1 9 g 、 4 . 6 8 ミリモル) をジオキサン (1 1 m l) に加えた。混合物を還流下で 2 4 時間加熱し、次いで、冷却した。溶媒を減圧下でロータリーエバポレーターにて除去し、ジクロロメタン (1 0 0 m l) および水 (1 0 0 m l) を残渣に加え、および形成された固体を吸引濾過し、および捨てた。濾液をジクロロメタンで抽出し、および有機相を硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下でロータリーエバポレーターにて除去し、および残渣をクロマトグラフィー (酢酸エチル、シクロヘキサン) に付した。

収率 : 6 8 0 m g (理論の 5 5 %) 、 l o g P (H C O O H) 2 . 1 9 、 [M ⁺ + 1] 2 7 2 . 2

¹ H NMR (d ₆ - DMSO) : 1 . 3 0 (s , 1 2 H) 、 7 . 5 1 (m , 1 H) 、 7

10

20

30

40

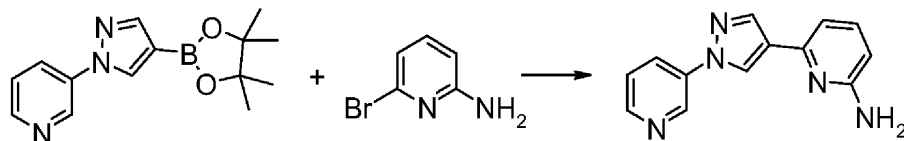
50

． 9 0 (s, 1H)、8. 2 5 (m, 1H)、8. 5 1 (m, 1H)、8. 7 3 (s, 1H)、9. 1 2 (m, 1H)。

段階 3：6－[1－(ピリジン－3－イル)－1H－ピラゾール－4－イル]ピリジン－2－アミン

【0312】

【化71】



10

アルゴン下で、3. 17 g (11. 7ミリモル)の3－[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)－1H－ピラゾール－1－イル]ピリジン、2. 02 g (11. 7ミリモル)の6－ブロモピリジン－2－アミンおよび945 mg (817 μモル)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを、2 M炭酸ナトリウム水溶液(23. 3 ml)およびアセトニトリル(63. 3 ml)の、アルゴンによって脱気した混合物に加えた。反応混合物を18時間で75℃まで加熱し、冷却後にアセトニトリルで希釈し、MgSO₄で乾燥し、濾過し、および濃縮した。かくして得られた粗製生成物をクロマトグラフィー(アセトニトリル/アセトン)によって精製した。

20

収率1. 76 g (理論の71%)

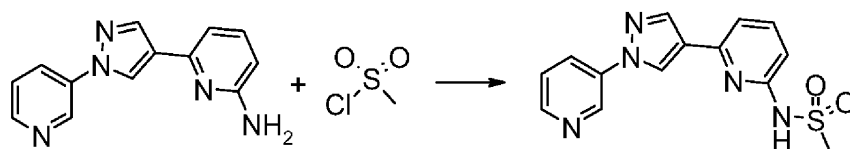
HPLC-MS: log P (HCOOH): 0. 30; 質量(m/z): 238. 1 (M+H)⁺

¹H NMR (d6-DMSO): 5. 88 (s, 2H)、6. 35 (d, 1H)、6. 93 (d, 1H)、7. 42 (t, 1H)、7. 58 (dd, 1H)、8. 22 (s, 1H)、8. 28 (m, 1H)、8. 54 (dd, 1H)、8. 97 (s, 1H)、9. 15 ppm (d, 1H)。

段階 4：N－{6－[1－(ピリジン－3－イル)－1H－ピラゾール－4－イル]ピリジン－2－イル}メタンスルホンアミド

【0313】

【化72】



30

146 mg (585 μモル)の6－[1－(ピリジン－3－イル)－1H－ピラゾール－4－イル]ピリジン－2－アミンおよび54. 0 μl (701 μモル)のN－メチルモルホリンを最初に10 mlのジクロロメタンに投入し、および塩化メタンスルホニルを室温で加えた。混合物を一晩攪拌し、および反応混合物をシリカゲルに通して濾過した(溶離剤: 酢酸エチル)。濃縮後、粗製生成物をクロマトグラフィー(ジクロロメタン/メタノール)によって精製した。

40

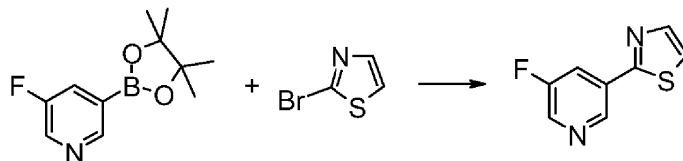
収率: 50 mg (理論の27%); HPLC-MS: log P (HCOOH): 1. 26; 質量(m/z): 316. 0 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 6. 82 (d, 1H)、7. 45 (d, 1H)、7. 59 (dd, 1H)、7. 78 (t, 1H)、8. 30 (m, 2H)、8. 57 (dd, 1H)、9. 09 (s, 1H)、9. 17 (d, 1H)、10. 55 ppm (s, 1H)。

実施例 B：6－[2－(5－フルオロピリジン－3－イル)－1, 3－チアゾール－5－

50

イル] -N- [(トリフルオロメチル) スルホニル] -ピリジン-2-カルボキサミド
 段階1: 3-フルオロ-5-(1, 3-チアゾール-2-イル) ピリジン
 【0314】
 【化73】



2.0 g (8.97ミリモル) のピリジルホウ酸エステル、1.47 g (8.97ミリモル) の2-ブロモチアゾール、197 mg (0.27ミリモル) のビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム(II)塩化物および3.72 g (26.9ミリモル) の炭酸カリウムを40 ml のジメトキシエタン中でアルゴン下にて80℃で16時間攪拌した。

【0315】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離剤: シクロヘキサン/酢酸エチル)によって精製した。

収率: 778 mg (理論の48%)

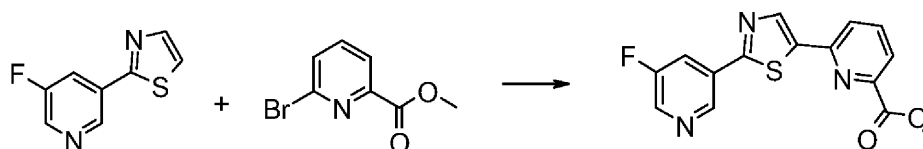
HPLC-MS: log P (HCOOH): 1.48; 質量(m/z): 180.9 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 7.95 (m, 1H)、8.04 (m, 1H)、8.24 (m, 1H)、8.69 (m, 1H)、9.04 (m, 1H) ppm.

段階2: 6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1, 3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボン酸メチル

【0316】

【化74】



748 mg (4.15ミリモル) のフルオロピリジルチアゾール、897 mg (4.15ミリモル) のブロモピリジン、62 mg (0.13ミリモル) の二水素ジクロロビス(ジ-tert-ブチルホスフィノ-kP)パラジウム(II)酸塩(CombiPhos、USAからのジクロロ{ビス[ジ-tert-ブチル(ヒドロキシ)ホスホラニル]}パラジウム、POPd)および1.147 g (8.3ミリモル) の炭酸カリウムをアルゴン下で10 ml のジメチルホルムアミド中で120℃にて16時間攪拌した。

【0317】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離剤: シクロヘキサン/酢酸エチル)によって精製した。

収率: 615 mg (理論の47%)

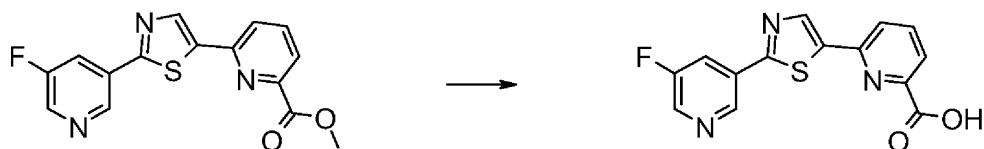
HPLC-MS: log P (HCOOH): 2.37; 質量(m/z): 316.0 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 3.93 (s, 3H)、8.03 (m, 1H)、8.14 (m, 1H)、8.36 (m, 2H)、8.73 (m, 1H)、8.80 (m, 1H)、9.12 (m, 1H) ppm.

段階3: 6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1, 3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボン酸

【0318】

【化 7 5】



570 mg (1.81ミリモル)のピリジルカルボン酸メチルを25 mlのテトラヒドロフランおよび8 mlの水の混合物に溶解させ、17 mlの水中の152 mg (3.62ミリモル)の水酸化リチウム一水和物の溶液を加え、および混合物を室温にて16時間攪拌した。

10

【0319】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、および水およびメチルtertブチルエーテルの間に分配し、水性相を1N塩酸で酸性化し、および沈澱した固体を吸引濾過し、および乾燥した。

収率：556 mg (理論の91%)

HPLC-MS: log P (HCOOH) : 1.72; 質量 (m/z) : 302.1 (M+H)⁺;

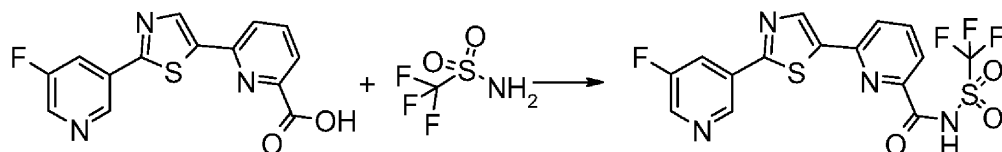
¹H NMR (d6-DMSO) : 8.00 (m, 1H)、8.10 (m, 1H)、8.32 (m, 2H)、8.72 (m, 1H)、8.78 (m, 1H)、9.10 (m, 1H)、13.5 (br) ppm。

20

段階4: 6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]-N-[(トリフルオロメチル)スルホニル]ピリジン-2-カルボキサミド

【0320】

【化 7 6】



30

100 mg (0.33ミリモル)のピリジルカルボン酸を最初に5 mlのテトラヒドロフランに投入し、81 mg (0.50ミリモル)のカルボニルジイミダゾールを加え、および混合物を還流下で1時間沸騰させた。室温まで冷却後、74 mg (0.50ミリモル)のトリフルオロメタンスルホンアミドを加え、混合物を10分間攪拌し、次いで、76 mg (0.50ミリモル)のジアザビスクロウンデセン (DBU)を加え、および混合物を室温で16時間攪拌した。

【0321】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー (溶離剤: ジクロロメタン/メタノール) によって精製した。

収率: 28 mg (理論の20%)

40

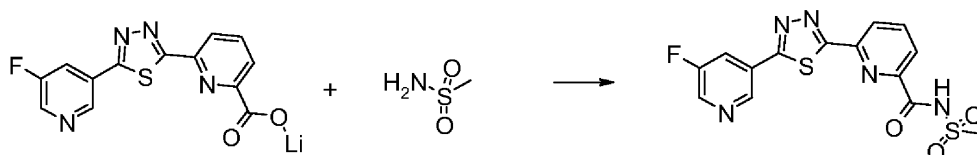
HPLC-MS: log P (HCOOH) : 1.86; 質量 (m/z) : 433.0 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO) : 7.60 (m, 1H)、7.88 (m, 1H)、7.96 (m, 1H)、8.12 (m, 1H)、8.30 (m, 1H)、8.70 (m, 1H)、8.89 (m, 1H)、9.10 (m, 1H) ppm。

実施例C: 6-[5-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル]-N-(メチルスルホニル)ピリジン-2-カルボキサミド

【0322】

【化 77】



200 mg (0.64ミリモル)のリチウム塩および1.01 g (7.78ミリモル)のジイソプロピルエチルアミンを、最初に、5 mlのアセトニトリルに投入し、198 mg (0.77ミリモル)の塩化ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)-ホスフィニル(BOP-Cl)を加え、混合物を20分間攪拌し、185 mg (1.94ミリモル)のメタンスルホンアミドおよび99 mg (0.64ミリモル)のジアザビシクロウンデセン(DBU)を加え、および混合物を室温で16時間攪拌した。

10

【0323】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、および水および酢酸エチルの間に分配し、および有機相を乾燥し、および濃縮した。さらなる精製は、シリカゲル上の(溶離剤:ジクロロメタン/メタノール)、次いで、RP18シリカゲル(溶離剤:水/アセトニトリル)上のカラムクロマトグラフィーによって行った。

収率: 37 mg (理論の15%)

HPLC-MS: log P (HCOOH): 1.79; 質量(m/z): 380.1 (M+H)⁺;

20

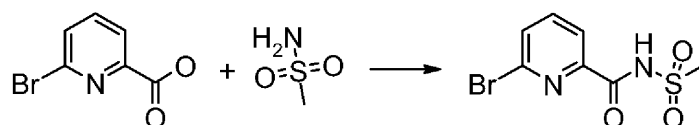
¹H NMR (d6-DMSO): 3.40 (s, 3H)、8.22 (m, 1H)、8.30 (m, 1H)、8.48 (m, 1H)、8.59 (m, 1H)、8.82 (m, 1H)、9.18 (m, 1H)、12.1 (br) ppm。

実施例D: 6-[1-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(メチルスルホニル)ピリジン-2-カルボキサミド

段階1: 6-ブロモ-N-(メチルスルホニル)ピリジン-2-カルボキサミド

【0324】

【化 78】



30

5.40 g (26.7ミリモル)の6-ブロモ-2-ピリジンカルボン酸を、最初に、150 mlのテトラヒドロフランに投入し、6.51 g (40.0ミリモル)のカルボニルジイミダゾールを加え、および混合物を還流下で1時間沸騰させた。室温まで冷却した後、3.81 g (40.0ミリモル)のメタンスルホンアミドを加え、混合物を10分間攪拌し、次いで、6.10 g (40ミリモル)のジアザビシクロウンデセン(DBU)を加え、および混合物を室温で16時間攪拌した。

【0325】

40

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離剤:ジクロロメタン/メタノール)によって精製した。

収率: 5.10 g (理論の69%)

HPLC-MS: log P (HCOOH): 1.21; 質量(m/z) 281.0 (M+H)⁺;

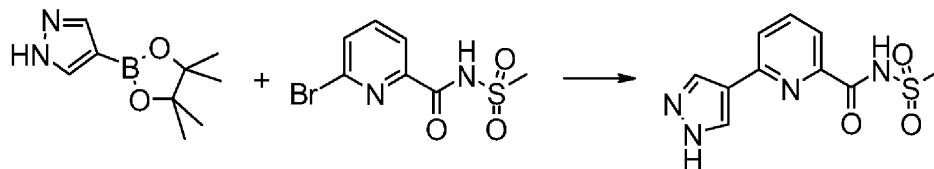
¹H NMR (d6-DMSO): 3.37 (s, 3H)、7.95 (m, 2H)、8.06 (m, 1H) ppm

段階2: N-(メチルスルホニル)-6-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-2-カルボキサミド

【0326】

50

【化 7 9】



285 mg (1.47ミリモル) の4-ピラゾールボロン酸エステル、410 mg (1.47ミリモル) のブロモピリジン、32 mg (0.04ミリモル) のビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム(II)塩化物および467 mg (4.41ミリモル) の炭酸カリウムを、アルゴン下で、10 ml のジメトキシエタン中で80℃にて16時間攪拌した。

10

【0327】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離剤: シクロヘキサン/酢酸エチル)によって精製した。

収率: 145 mg (理論の37%)

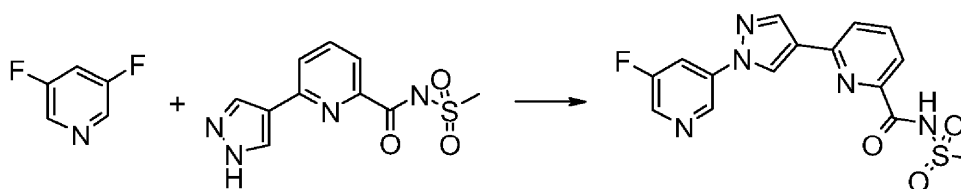
HPLC-MS: log P (HCOOH): 0.91; 質量(m/z): 267.0 (M+H)⁺;

段階3: 6-[1-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(メチルスルホニル)-ピリジン-2-カルボキサミド

【0328】

20

【化 8 0】



43 mg (0.37ミリモル) の3,5-ジフルオロピリジン、99 mg (0.37 mg) のピラゾリルピリジン、6 mg (0.01ミリモル) の二水素ジクロロビス(ジ-tert-ブチルホスフィニト-κP)パラジウム(II)酸塩(Combiphos, USAからのPOPd)および102 mg (0.74ミリモル) の炭酸カリウムを、アルゴン下で5 ml のジメチルホルムアミド中で120℃にて12時間攪拌した。

30

【0329】

仕上げ処理では、混合物を濃縮し、およびシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(溶離剤: ジクロロメタン/メタノール)によって精製した。

収率: 35 mg (理論の26%)

HPLC-MS: log P (HCOOH): 1.98; 質量(m/z): 362.1 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 3.40 (s, 3H)、7.98 (m, 1H)、8.08 (m, 2H)、8.2 (m, 1H)、8.58 (m, 1H)、8.70 (m, 1H)、9.08 (m, 1H)、9.40 (m, 1H) ppm。

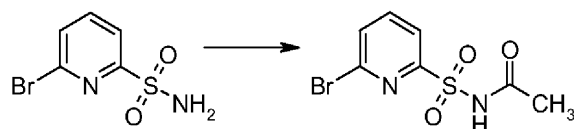
40

実施例E: N-({6-[2-(ピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-イル}スルホニル)アセタミド

段階1: N-[(6-ブロモピリジン-2-イル)スルホニル]アセタミド

【0330】

【化 8 1】



6-ブロモピリジン-2-スルホンアミド（0.5 g、2.11ミリモル、国際公開第2005/058299号パンフレットに記載された方法によって調製）および炭酸カリウム（2.92 g、21.1ミリモル）を、最初に、アセトニトリル（10 ml）中に投入した。氷で冷却しつつ、塩化アセチル（1.16 g、14.8ミリモル）を滴下し、およ

10

び反応混合物を室温にて16時間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、およ

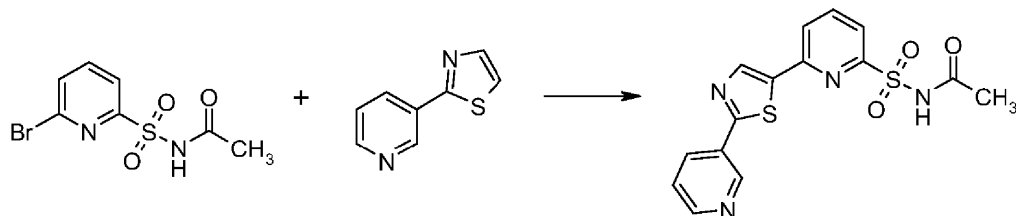
び残渣を水中に取り、およ

び希塩酸溶液で酸性化した。それを酢酸エチルで抽出し、およ

20

【0331】

【化 8 2】



30

N-[(6-ブロモピリジン-2-イル)スルホニル]アセタミド（0.112 g、0.4ミリモル）、3-（1，3-チアゾール-2-イル）ピリジン（0.065 g、0.4ミリモル、国際公開第2010/006713号パンフレットに記載された方法によ

って調製）、ジクロロ{ビス[ジ-tert-ブチル（ヒドロキシ）ホスホラミル]}パラジウム（0.006 g、0.012ミリモル）および炭酸セシウム（0.26 g、0.8

40

ミリモル）を、アルゴン下で、10 mlのN，N-ジメチルホルムアミド中で120℃で16時間攪拌した。冷却の後、溶媒を減圧下で除去し、およ

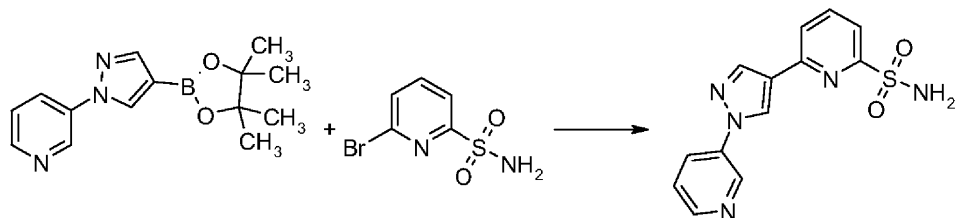
び残渣をクロマトグラフィーに付した（シリカゲル、ジクロロメタン/メタノール溶離剤）。これにより、0.024

g（理論の15%）のN-（{6-〔2-（ピリジン-3-イル）-1，3-チアゾール-5-イル〕ピリジン-2-イル}スルホニル）アセタミドを得た。

【0332】

50

【化 8 3】



アルゴン下で、3-[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)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリジン(0.2g、0.74ミリ
 モル、国際公開第2011/045224号パンフレットに記載された方法によって調製
)、6-ブロモピリジン-2-スルホンアミド(0.175g、0.74ミリモル)およ
 びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0.025g、0.022ミリモ
 ル)を、水中の炭酸ナトリウム溶液(2.9ml、2M/L)およびアセトニトリル(4
 ml)の、アルゴンによって脱気した、混合物に加えた。反応混合物を70℃にて18時
 間攪拌した。冷却の後、反応混合物を水にすすぎ、および沈澱した結晶を吸引濾過した。
 それらを、引き続いて、ジエチルエーテルと共に攪拌し、および吸引濾過した。これによ
 り、0.23g(理論の97%)の6-[1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-スルホンアミドを得た。

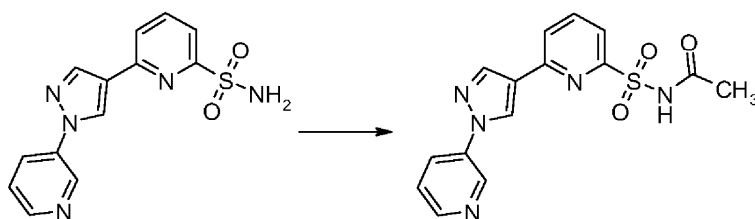
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 0.99; 質量(m/z): 302.1 (M
 +H)⁺

¹H NMR (d6-DMSO): 7.43 (s, 2H)、7.60-7.63 (m, 1
 H)、7.76 (d, 1H)、8.00 (d, 1H)、8.11 (t, 1H)、8.28
 -8.31 (m, 1H)、8.53 (s, 1H)、8.58-8.60 (m, 1H)、9
 .16-9.17 (m, 1H)、9.33 (s, 1H) ppm。

段階2: N-({6-[1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル} スルホニル) アセタミド

【0333】

【化 8 4】



6-[1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-ス
 ルホンアミド(0.15g、0.44ミリモル)を、最初に、アルゴン下で、アセトニト
 リル(1.5ml)に投入し、および水素化ナトリウム(0.026g、0.66ミリモ
 ル、60%)を、何回かに分けて加えた。反応混合物を室温で1時間攪拌し、次いで、塩
 化アセチル(0.052g、0.66ミリモル)を滴下した。反応混合物を82℃にて3
 3時間攪拌し、冷却の後、溶媒を減圧下で除去した。残渣を飽和炭酸水素ナトリウム溶液
 中に取り、ジクロロメタンを加え、および沈澱した固体を濾過した。濾液の相を分離し:
 水性相を塩酸でpH3に調整し、および16時間放置した。沈澱した結晶を吸引濾過した。
 収率0.02g(理論の12%)のN-({6-[1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-イル} スルホニル) アセタミド。

HPLC-MS: Log P (HCOOH): 1.17; 質量(m/z): 344.1 (M
 +H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 2.03 (s, 3H)、7.60-7.64 (m, 1
 H)、7.92-7.94 (m, 1H)、8.08-8.10 (m, 1H)、8.17-

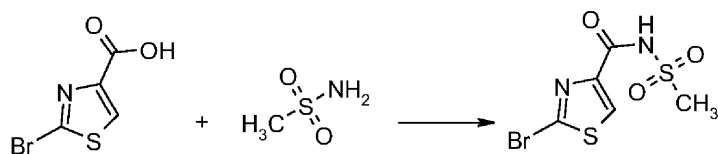
8.20 (m, 1H)、8.29–8.31 (m, 1H)、8.37 (s, 1H)、8.59–8.60 (m, 1H)、9.16–9.17 (m, 1H)、9.26 (s, 1H)、12.31 (s, 1H) ppm

実施例G：N-（メチルスルホニル）-2-[1-（ピリジン-3-イル）-1H-ピラゾール-4-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド

工程1：2-ブロモ-N-（メチルスルホニル）-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド

【0334】

【化85】



2-ブロモ-1, 3-チアゾール-4-カルボン酸（0.8 g、3.85ミリモル）を、最初に、テトラヒドロフラン（10 ml）に投入した。N, N'-カルボニルジイミダゾール（0.94 g、5.77ミリモル）を加え、および反応混合物を還流下で1時間加熱した。メタンスルホンアミド（0.55 g、5.77ミリモル）を加え、10分後に、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン（0.88 g、5.77ミリモル）を加えた。反応混合物を室温で16時間加熱し、次いで、溶媒を減圧下で除去した。残渣を水中に取り、および塩酸で酸性化した。沈澱した生成物を吸引濾過した。水性相をジクロロメタンで抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、および濾過し、溶媒を減圧下で除去した。これにより、合計1.0 g（理論の89%）の2-ブロモ-N-（メチルスルホニル）-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミドを得た。

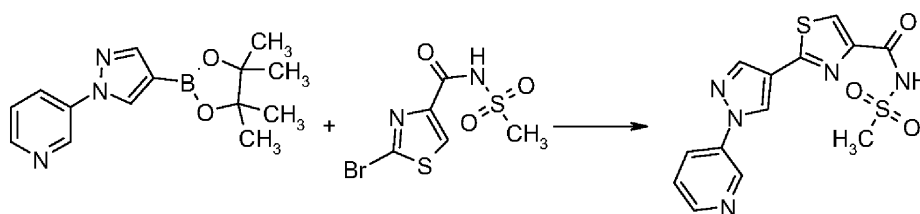
HPLC-MS：Log P（HCOOH）：0.83；質量（m/z）：284.9（M+H）⁺；

¹H NMR（d6-DMSO）：3.33（s, 3H）、8.61（s, 1H）、12.00（s, 1H）。

段階2：N-（メチルスルホニル）-2-[1-（ピリジン-3-イル）-1H-ピラゾール-4-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド

【0335】

【化86】



アルゴン下で、3-[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)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリジン（0.1 g、0.37ミリモル）、2-ブロモ-N-（メチルスルホニル）-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド（0.105 g、0.37ミリモル）およびテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0.013 g、0.011ミリモル）を、水中の炭酸ナトリウム溶液（1.5 ml、2 M/L）およびアセトニトリル（3.8 ml）の、アルゴンによって脱気した、混合物に加えた。反応混合物を70℃にて16時間攪拌した。冷却の後、反応混合物を水に注ぎ、およびジクロロメタンで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、および溶媒を減圧下で除去した。残渣をジエチルエーテルと共に引き続いて攪拌し、および吸引濾過した。これにより、0.23 g（理論の97%）の6-[1-（ピリジン-3-イル）-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-2-スルホンアミドを得た。

HPLC-MS: Log P (HCOOH): 1.25; 質量 (m/z): 350.1 ($M+H$)⁺;

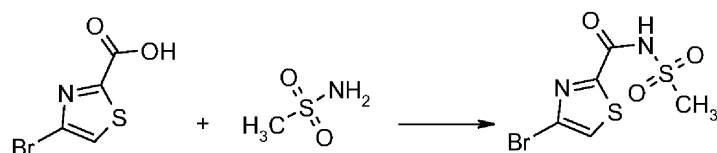
¹H NMR (d6-DMSO): 3.38 (s, 3H)、7.48–7.49 (m, 1H)、8.32–8.35 (m, 1H)、8.45 (s, 1H)、8.56 (s, 1H)、8.59–8.60 (m, 1H)、9.19–9.20 (m, 1H)、9.34 (s, 1H) ppm

実施例H: 4-[1-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(メチルスルホニル)-1,3-チアゾール-2-カルボキサミド

段階1: 4-ブロモ-N-(メチルスルホニル)-1,3-チアゾール-2-カルボキサミド

【0336】

【化87】



4-ブロモ-1,3-チアゾール-2-カルボン酸 (1.0 g、4.8ミリモル) を、最初に、テトラヒドロフラン (10 ml) 中に投入した。N,N'-カルボニルジイミダゾール (1.17 g、7.2ミリモル) を加え、反応混合物を還流下で1時間加熱した。メタンスルホンアミド (0.69 g、7.2ミリモル) を加え、10分後に、1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ-7-エン (1.10 g、7.2ミリモル) を加えた。反応混合物を室温で16時間攪拌し、次いで、溶媒を減圧下で除去した。残渣を水中に取り、および塩酸で酸性化した。沈澱した生成物を吸引濾過した。これにより、1.18 g (理論の84%) の4-ブロモ-N-(メチルスルホニル)-1,3-チアゾール-2-カルボキサミドを得た。

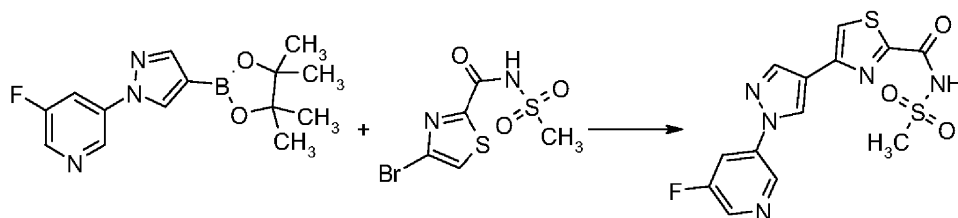
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 0.63; 質量 (m/z): 284.9 ($M+H$)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 3.31 (s, 3H)、8.31 (s, 1H)。

段階2: 4-[1-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-(メチルスルホニル)-1,3-チアゾール-2-カルボキサミド

【0337】

【化88】



アルゴン下で、3-フルオロ-5-[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)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリジン (0.2 g、0.69ミリモル、国際公開第2011/045224号パンフレットに記載された方法によって調製)、2-ブロモ-N-(メチルスルホニル)-1,3-チアゾール-4-カルボキサミド (0.2 g、0.69ミリモル) およびテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0.024 g、0.021ミリモル) を、水中の炭酸ナトリウム溶液 (2.8 ml、2 M/L) およびアセトニトリル (9.4 ml) の、アルゴンによって脱気された、混合物に添加した。反応混合物を70℃で16時間攪拌した。冷却の後、反応混合物を水に注ぎ、およびジクロロメタンで抽出した。水性相を塩酸で酸性化し、および

10

20

30

40

50

沈澱した固体を吸引濾過した。粗製生成物をシリカゲル上の酢酸エチル／２－プロパノールでのクロマトグラフィーに付した。これにより、０．２１ｇ（理論の８％）の４－〔１－（５－フルオロピリジン－３－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル〕－Ｎ－（メチルスルホニル）－１，３－チアゾール－２－カルボキサミドを得た。

HPLC-MS: Log P (HCOOH): １．６８；質量 (m/z): ３６８．１ (M+H)⁺；

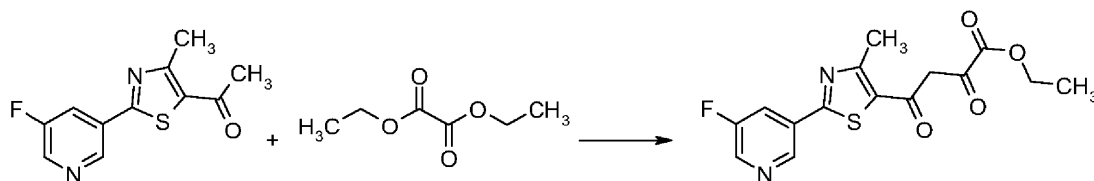
¹H NMR (d6-DMSO): ２．９９ (s, 3H)、７．９６ (s, 1H)、８．３３ (s, 1H)、８．３４ (s, 1H)、８．５５－８．５７ (m, 1H)、９．１０ (s, 1H)、９．１２ (s, 1H) ppm

実施例 I: ３－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕－１－メチル－Ｎ－（メチルスルホニル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド

段階 １: ４－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕－２，４－ジオキソブタン酸エチル

【０３３８】

【化８９】



アルゴン下で、リチウムビス（トリメチルシリル）アミミド（２１ｍｌ、テトラヒドロフラン中の１Ｍ／Ｌ）を、最初に、テトラヒドロフラン（１５０ｍｌ）中に投入した。－７８℃にて、ジエチルエーテルに溶解させた１－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕エタノン（５．０ｇ、２１ミリモル、Bior. & Med. Chem. Lett. １０５６（２００７）および２８２８（２０１０）と同様にして調製）をゆっくりと滴下し、および反応混合物を２時間攪拌した。エーテルに溶解させたシュウ酸ジエチル（３．１ｇ、２１ミリモル）を滴下し、および反応混合物を室温で１６時間攪拌した。引き続いて、硫酸水素カリウム溶液（５％）を加え、および混合物を酢酸エチルで反復して抽出した。合わせた有機相を乾燥し、および溶媒を減圧下で除去した。これにより、７．１ｇ（理論の９９％）の４－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕－２，４－ジオキソブタン酸エチルを得た。

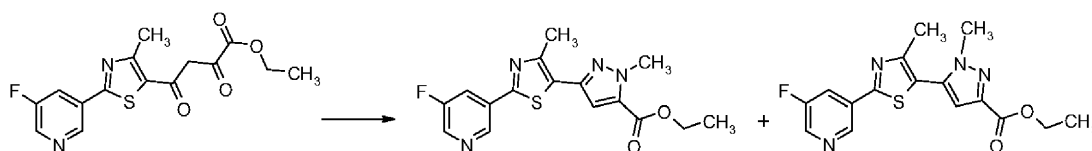
HPLC-MS: Log P (HCOOH): ３．３７；質量 (m/z): ３３７．１ (M+H)⁺；

¹H NMR (d6-DMSO): １．３１ (t, 3H)、２．７９ (s, 3H)、４．３１－４．３２ (m, 2H)、６．７１ (bs, 2H)、８．３３ (d, 1H)、８．７７ (s, 1H)、９．１０ (s, 1H) ppm

段階 ２: ３－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボン酸エチル

【０３３９】

【化９０】



４－〔２－（５－フルオロピリジン－３－イル）－４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル〕－２，４－ジオキソブタン酸エチル（６．９ｇ、２０．５ミリモル）およびメ

チルヒドラジン（0.65 g、20.5ミリモル）を還流下でエタノール（250 ml）中で2時間加熱した。形成された生成物を吸引濾過し、および濾液の溶媒を減圧下で除去した。残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル溶離剤）に付した。これにより、合計1.24 g（理論の17%）の3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸エチルを得た。副産物としては、4.8 g（理論の67%）の5-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチルを得た。

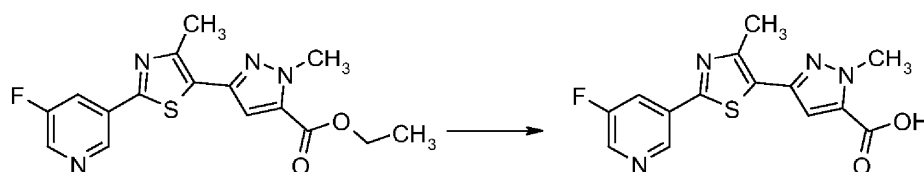
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 3.70; 質量 (m/z): 347.0 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 1.35 (t, 3H)、2.63 (s, 3H)、4.15 (s, 3H)、4.35 (q, 2H)、7.17 (s, 1H)、8.19-8.22 (m, 1H)、8.68-8.69 (m, 1H)、9.00-9.01 (m, 1H) ppm

段階3: 3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸

【0340】

【化91】



3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸エチル（1.1 g、3.1ミリモル）をテトラヒドロフラン（200 ml）および水（100 ml）に溶解させ、および水（100 ml）に溶解させた水酸化リチウム-水和物（0.26 g、6.2ミリモル）を加えた。反応混合物を室温で16時間攪拌し、次いで、塩酸で中和し、および溶媒を減圧下で除去した。沈殿した固体を吸引濾過した。これにより、0.96 g（理論の94%）の3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸を得た。

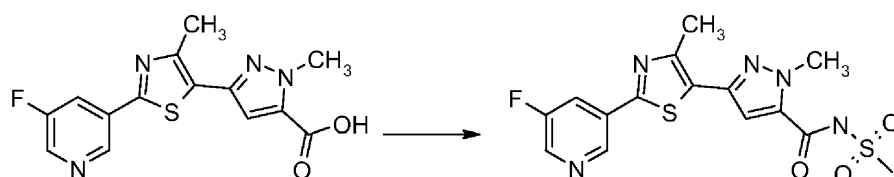
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 2.05; 質量 (m/z): 319.0 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 2.62 (s, 3H)、4.14 (s, 3H)、7.13 (s, 1H)、8.18-8.22 (m, 1H)、8.68-8.69 (m, 1H)、9.00-9.01 (m, 1H) ppm

段階4: 3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-N-（メチルスルホニル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド

【0341】

【化92】



3-〔2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル〕-1-メチル-1H-ピラゾール-5-カルボン酸（0.08 g、0.25ミリモル）およびメタンサルホンアミド（0.024 g、0.25ミリモル）を、最初に、

氷冷ジクロロメタン（10 ml）に投入した。4-ジメチルアミノピリジン（0.006 g、0.05ミリモル）およびN-（3-ジメチルアミノプロピル）-N'-エチルカルボジイミド塩酸塩（0.053 g、0.275ミリモル）を加えた。反応混合物を0℃で2時間攪拌し、次いで、室温で16時間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、および残渣をシリカゲル上のクロマトグラフィーに付した（ジクロロメタン／酢酸エチル溶離剤）。これにより、0.074 g（理論の72%）の3-[2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-4-メチル-1,3-チアゾール-5-イル]-1-メチル-N-（メチルスルホニル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドを得た。

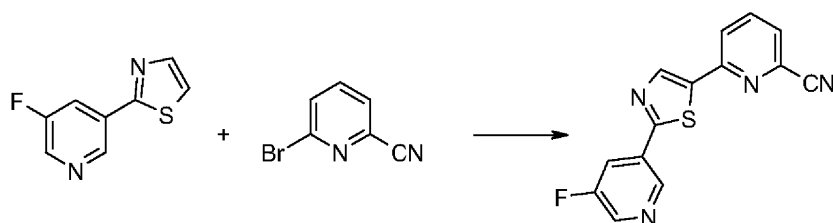
HPLC-MS：Log P（HCOOH）：2.04；質量（m/z）：396.0（M+H）⁺；

¹H NMR（d6-DMSO）：2.55（s, 3H）、3.40（s, 3H）、4.12（s, 3H）、7.68（m, 1H）、8.12（m, 1H）、8.69（m, 1H）、9.01（m, 1H）ppm

実施例J：メチル6-[2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシイミドエート（carboximidoate）
段階1：6-[2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボニトリル

【0342】

【化93】



アルゴン下で、3-フルオロ-5-（1,3-チアゾール-2-イル）ピリジン（0.99 g、5.47ミリモル）および6-ブロモピリジン-2-カルボニトリル（1.0 g、5.47ミリモル）を、最初に、DMF（15 ml）に投入した。10分後、室温にて、トリス（2-メチルフェニル）ホスフィン（0.13 g、0.23ミリモル）および塩化パラジウム（II）（0.1 g、0.55ミリモル）を加えた。反応混合物を130℃で14時間攪拌した。冷却の後、水および酢酸エチルを加え、および沈澱した生成物を吸引濾過した。濾液の有機相を除去し、水性相を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を硫酸マグネシウムで乾燥し、および溶媒を減圧下で除去した。残渣をジクロロメタンと共に攪拌し、および吸引濾過した。これにより、合計0.94 g（理論の61%）の6-[2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボニトリルを得た。

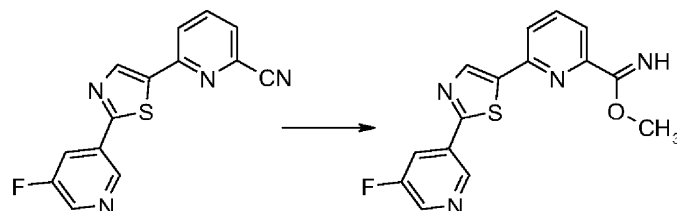
HPLC-MS：Log P（HCOOH）：2.51；質量（m/z）：283（M+H）⁺；

¹H NMR（d6-DMSO）：8.02（d, 1H）、8.20（t, 1H）、8.32-8.46（m, 1H）、8.44（d, 1H）、8.75（d, 1H）、8.84（s, 1H）、9.12（s, 1H）ppm

段階2：メチル6-[2-（5-フルオロピリジン-3-イル）-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシイミドエート

【0343】

【化 9 4】



6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボニトリル (0.33 g、1.17 ミリモル) およびナトリウムメトキシド (0.13 g、0.23 ミリモル) をメタノール (10 ml) およびジクロロメタン (10 ml) 中で室温にて3日間攪拌した。沈澱した固体を濾過し、濾液の溶媒を減圧下で除去した。残渣をジクロロメタンに溶解させ、およびCeliteを通して濾過した。濾液の溶媒を減圧下で除去した。これにより、0.32 g (理論の83%) のメチル6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシミドエートを得た。

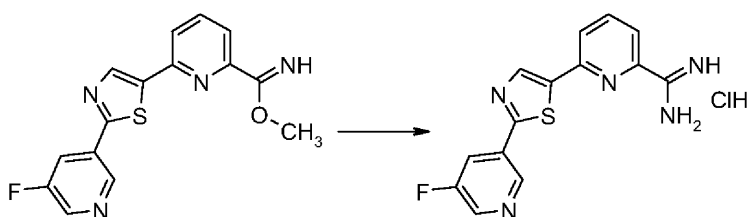
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 0.90; 質量 (m/z): 315 (M+H)⁺;

¹H NMR (d6-DMSO): 4.05 (s, 3H)、7.79-7.81 (m, 2H)、7.87-7.91 (m, 1H)、8.05-8.07 (m, 1H)、8.38 (s, 1H)、8.56 (s, 1H)、9.06 (s, 1H)、9.24 (s, 1H) ppm

実施例 K: 6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシイミドアミド塩酸塩 (1:1)

【0344】

【化 9 5】



メチル6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシイミドエート (0.1 g、0.32 ミリモル) および塩化アンモニウム (0.016 g、0.3 ミリモル) をメタノール (3 ml) およびジクロロメタン (2 ml) 中で室温にて2日間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、および残渣をメタノール中に取り、Celiteを通して濾過した。濾液の溶媒を減圧下で除去し、残渣をt-ブチルメチルエーテルと共に攪拌し、および吸引濾過した。これにより、0.07 g (理論の65%) の6-[2-(5-フルオロピリジン-3-イル)-1,3-チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキシイミドアミド塩酸塩 (1:1) を得た。

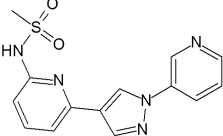
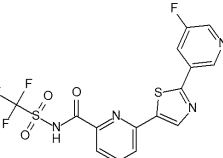
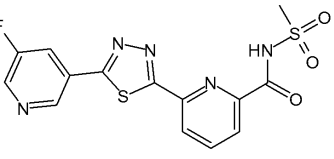
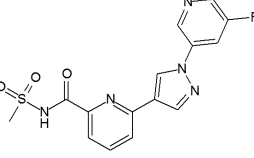
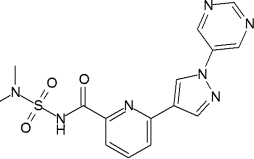
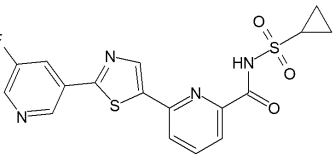
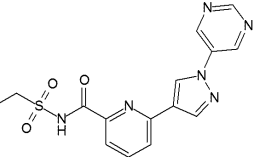
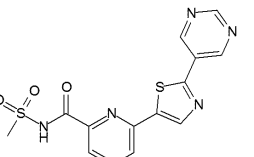
HPLC-MS: Log P (HCOOH): 0.71; 質量 (m/z): 300 (M+H)⁺

¹H NMR (d6-DMSO): 8.19-8.22 (m, 1H)、8.26-8.31 (m, 2H)、8.39-8.41 (m, 1H)、8.74-8.75 (m, 1H)、8.93 (s, 1H)、9.07-9.08 (m, 1H) ppm

式 (I) の以下の化合物は、先に記載した調製方法と同様に、またはそれによって得られた。

【0345】

【表 1】

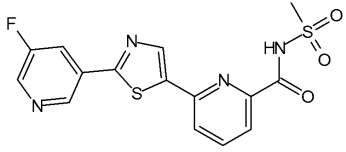
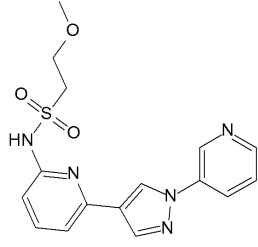
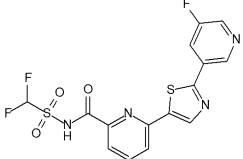
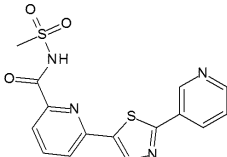
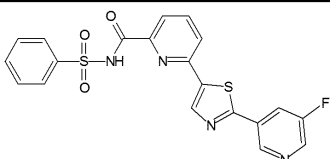
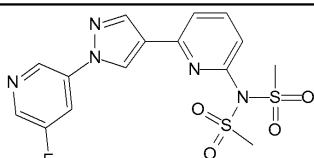
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
1 (PE A)		1.26	1H NMR (d6-DMSO): 6.82 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.59 (dd, 1H), 7.78 (t, 1H), 8.30 (m, 2H), 8.57 (dd, 1H), 9.09 (s, 1H), 9.17 (d, 1H), 10.55 ppm (s, 1H).	316.0
2 (PE B)		1.86	1H NMR (d6-DMSO): 7.60 (m,1H), 7.88 (m,1H), 7.96 (m,1H), 8.12 (m,1H), 8.30 (m,1H), 8.70 (m,1H), 8.89 (m,1H), 9.10 (m,1H) ppm.	433
3 (PE C)		1.79	1H NMR (d6-DMSO): 3.40 (s,3H), 8.22 (m,1H), 8.30 (m,1H), 8.48 (m,1H), 8.59 (m,1H), 8.82 (m,1H), 9.18 (m,1H), 12.1 (br) ppm.	380.1
4 (PE D)		1.98	1H NMR (d6-DMSO): 3.40 (s,3H), 7.98 (m,1H), 8.08 (m,2H), 8.2 (m,1H), 8.58 (m,1H), 8.70 (m,1H), 9.08 (m,1H), 9.40 (m,1H) ppm.	362.1
5		1.86	1H NMR(d6-DMSO):2.66(s,6H),7.78-7.85(m,3H),8.50(s,1H),9.17(s,1H), 9.26(s,1H),9.40(s,2H)	373
6		2.44	1H NMR (d6-DMSO): 1.18 (m,4H), 3.15 (m,1H), 8.04 (m,1H), 8.15 (m,1H), 8.33 (m,2H), 8.74 (s,1H), 8.91 (s,1H), 9.11 (s,1H), 11.8 (br) ppm.	404.9
7		1.63	1H NMR(d6-DMSO):1.31(t,3H),3.58 (q,2H),7.96-7.98(m,1H),8.07-8.14(m,2H),8.83(s,1H),9.20(s,1H),9.38(s,2H),9.52(s,1H),11.60(s,1H)	358
8		1.48	1H NMR (d6-DMSO): 3.40 (s,3H), 8.02 (m,1H), 8.18 (m,1H), 8.35 (m,1H), 8.95 (s,1H), 9.30 (s,1H), 9.40 (s,2H), 11.8 (br) ppm.	362

10

20

30

40

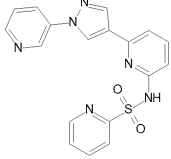
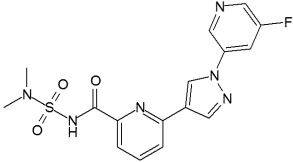
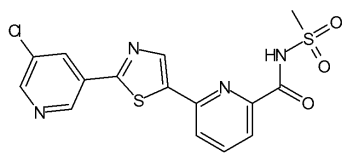
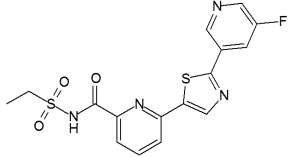
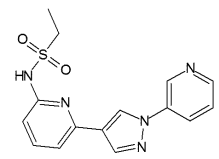
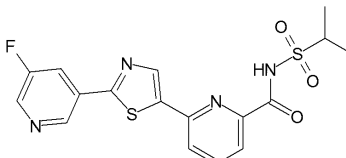
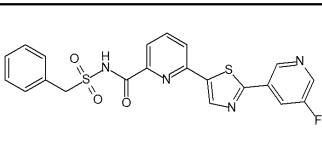
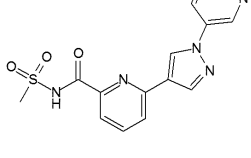
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
9		2.05	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 3.42 (s,3H), 8.02 (m,1H), 8.19 (m,1H), 8.34 (m,2H), 8.75 (m,1H), 8.93 (m,1H), 9.11 (m,1H), 11.8 (br) ppm.	379
10		1.43	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 3.21 (s, 3H), 3.78 (t, 2H), 3.92 (m, 2H), 6.79 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.78 (t, 1H), 8.29 (m, 2H), 8.58 (dd, 1H), 9.10 (s, 1H), 9.16 (d, 1H), 10.67 ppm (br. s, 1H).	360.2
11		1.79	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 6.75 (m,1H), 7.50 (m,1H), 7.93 (m,2H), 8.12 (m,1H), 8.32 (m,1H), 8.70 (m,2H), 9.10 (m,1H) ppm.	415
12		1.56	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 3.42 (s,3H), 7.78 (m,1H), 8.00 (m,1H), 8.18 (m,1H), 8.32 (m,1H), 8.50 (m,1H), 8.75 (m,1H), 8.90 (s,1H), 9.29 (m,1H), 11.8 (br) ppm.	361
13		2.94	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 7.70 (m,3H), 7.88 (m,1H), 8.08 (m,3H), 8.30 (m,2H), 8.75 (m,1H), 8.90 (s,1H), 9.12 (m,1H), 12.3 (br) ppm.	441
14		2.15	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}$: 3.74 (s, 6H), 7.59 (dd, 1H), 7.94 (dd, 1H), 8.07 (t, 1H), 8.35 (dt, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.60 (d, 1H), 9.13 (m, 1H), 9.26 ppm (d, 1H).	412

10

20

30

40

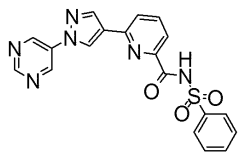
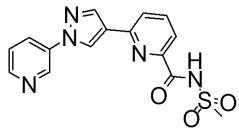
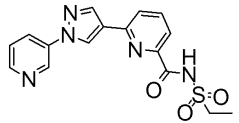
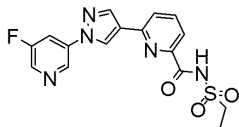
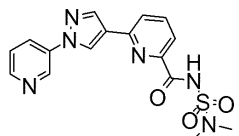
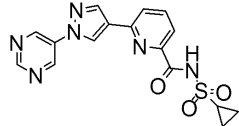
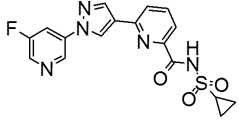
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
15		1.42	¹ H NMR (d6-DMSO): 6.86 (br. s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.59 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.72 (t, 1H), 7.94 (br. s, 1H), 8.15 (t, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.31 (br. s, 1H), 8.57 (m, 1H), 8.67 (d, 1H), 8.87 (br. s, 1H), 9.09 (d, 1H), 11.34 ppm (br. s, 1H).	379.1
16		2.42	¹ H NMR(d6-DMSO):2.65(s,6H),7.76-7.84(m,3H),8.30-8.34(m,1H),8.45(s,1H),8.57-8.58(m,1H),9.11(s,1H),9.24(s,1H)	390
17		2.4	¹ H NMR (d6-DMSO): 3.42 (s,3H), 8.01 (m,1H), 8.18 (m,1H), 8.32 (m,2H), 8.78 (s,1H), 8.92 (m,1H), 9.18 (s,1H), 11.8 (br) ppm.	395
18		2.33	¹ H NMR (d6-DMSO): 1.28 (t,3H), 3.55 (q,2H), 7.98 (m,1H), 8.15 (m,1H), 8.33 (m,2H), 8.72 (m,1H), 8.90 (m,1H), 9.11 (s,1H), 11.8 (br) ppm.	393
19		1.48	¹ H NMR (d6-DMSO): 1.29 (t, 3H), 3.61 (br. q, 2H), 6.83 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.77 (t, 1H), 8.29 (m, 1H), 8.58 (m, 1H), 9.07 (m, 1H), 9.16 (d, 1H), 10.45 ppm (br. s, 1H).	330.1
20		2.61	¹ H NMR (d6-DMSO): 1.38 (d,6H), 3.85 (m,1H), 7.99 (m,1H), 8.15 (m,1H), 8.35 (m,2H), 8.75 (s,1H), 8.92 (s,1H), 9.11 (s,1H), 11.8 (br) ppm.	407.1
21		2.97	¹ H NMR (d6-DMSO): 4.85 (s,2H), 7.48 (m,5H), 8.00 (m,1H), 8.18 (m,1H), 8.33 (m,2H), 8.72 (s,1H), 8.89 (s,1H), 9.10 (s,1H), 11.8 (br) ppm.	455.1
22		1.38	¹ H NMR(d6-DMSO):3.44(s,3H),7.98-8.00(m,1H),8.08-8.15(m,2H),8.84(s,1H);9.20(s,1H),9.38(s,2H),9.54(s,1H),11.75(s,1H)	344

10

20

30

40

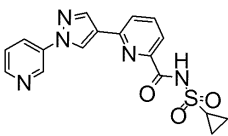
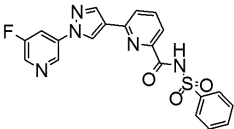
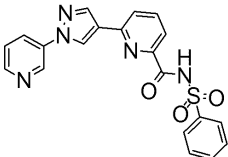
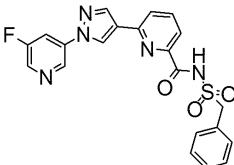
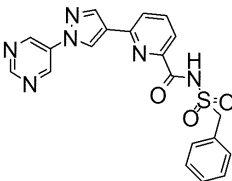
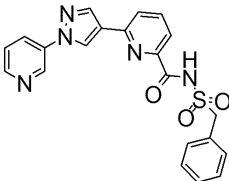
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
23		2.24	^1H NMR(D6-DMSO): 7.39-7.42(m,3H), 7.74-7.88(m,5H), 8.43(s,1H), 9.15(s,1H), 9.19-9.20(m,1H), 9.39(s,2H) ppm	406.0
24		1.48	^1H NMR(D6-DMSO): 3.43(s,3H), 7.61-7.64(m,1H), 7.96-7.99(m,1H), 8.09-8.11(m,2H), 8.28-8.31(m,1H), 8.58-8.60(m,1H), 8.75(s,1H), 9.17-9.18(m,1H), 9.50(s,1H), 11.70(s,1H) ppm	344.0
25		1.77	^1H NMR(D6-DMSO): 1.31(t,3H), 3.59(q,2H), 7.61-7.64(m,1H), 7.95-7.97(m,1H), 8.09-8.11(m,2H), 8.28-8.32(m,1H), 8.56-8.60(m,1H), 8.76(s,1H), 9.17-9.18(m,1H), 9.49(s,1H), 11.70(s,1H) ppm	358.1
26		2.21	^1H NMR(D6-DMSO): 1.16(t,3H), 2.49-2.52(m,2H), 7.79-7.89(m,3H), 8.33-8.36(m,1H), 8.47(s,1H), 8.57-8.58(m,1H), 9.11(s,1H), 9.25(s,1H) ppm	376.0
27		1.96	^1H NMR(D6-DMSO): 2.95(s,6H), 7.61-7.64(m,1H), 7.94-7.97(m,1H), 8.09-8.10(m,1H), 8.59-8.60(m,1H), 8.74(s,1H), 9.18-9.19(m,1H), 9.49(s,1H), 11.40(s,1H) ppm	373.1
28		1.76	^1H NMR(D6-DMSO): 1.14-1.17(M,2 H);1.24-1.26(m,2H),3.15-3.22(m,1 H),7.98-8.00(m,1H),8.08-8.15(m,2 H);8.83(s,1H),9.20(s,1H),9.38(s,1 H),9.52(s,1H),11.7(s,1H) ppm	371.0
29		2.35		388.0

10

20

30

40

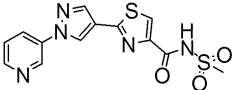
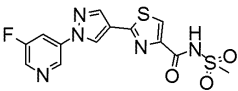
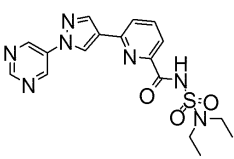
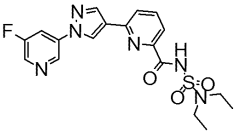
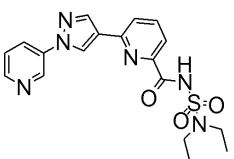
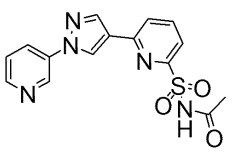
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
30		1.85	^1H NMR(D6-DMSO): 1.12-1.17(m, 2H), 1.23-1.27(m, 2H), 7.61-7.64(m, 1H), 7.95-8.00(m, 2H), 8.08-8.11(m, 2H), 8.28-8.32(m, 1H), 8.59-8.60(m, 1H), 8.75(s, 1H), 9.17-9.18(m, 1H), 9.48(s, 1H), 11.80(s, 1H) ppm	370.1
31		2.82	^1H NMR(D6-DMSO): 7.38-7.42(m, 3H), 7.74-7.88(m, 5H), 8.32-8.36(m, 1H), 8.39(s, 1H), 8.56-8.58(m, 1H), 9.10(s, 1H), 9.18(s, 1H) ppm	424.0
32		2.26	^1H NMR(D6-DMSO): 7.42-7.43(m, 3H), 7.55-7.59(m, 1H), 7.76-7.89(m, 5H), 8.31-8.34(m, 1H), 8.38(s, 1H), 8.54-8.56(m, 1H), 9.14(s, 1H), 9.17-9.18(m, 1H) ppm	406.0
33		2.89	^1H NMR(D6-DMSO): 4.48(s, 2H), 7.24-7.34(m, 5H), 7.72-7.90(m, 3H), 8.33-8.36(m, 1H), 8.46(s, 1H), 8.57-8.58(m, 2H), 9.11(s, 1H), 9.25(s, 1H) ppm	438.1
34		2.28	^1H NMR(D6-DMSO): 4.44(s, 2H), 7.24-7.34(m, 5H), 7.72-7.83(m, 3H), 8.47(s, 1H), 9.16(s, 1H), 9.24(s, 1H), 9.41(s, 2H) ppm	421.1
35		2.44	^1H NMR(D6-DMSO): 4.48(s, 2H), 7.24-7.34(m, 5H), 7.57-7.60(m, 1H), 7.73-7.84(m, 3H), 8.32-8.35(m, 1H), 8.42(s, 1H), 8.55-8.57(m, 1H), 9.19-9.20(m, 2H) ppm	420.2

10

20

30

40

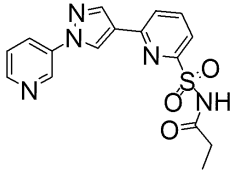
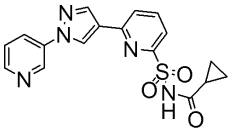
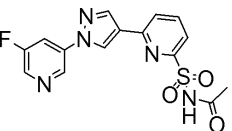
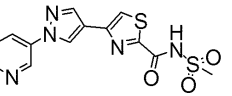
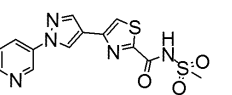
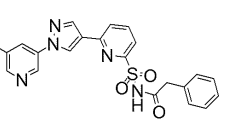
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
36 (PE G)		1.25	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 3.38(s,3H), 7.48-7.49(m,1H), 8.32-8.35(m,1H), 8.45(s,1H), 8.56(s,1H), 8.59-8.60(m,1H), 9.19-9.20(m,1H), 9.34(s,1H) ppm	350.1
37		1.66	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 8.33-8.37(m,1H), 8.46(s,1H), 8.51(s,1H), 8.61-8.62(m,1H), 9.11(s,1H), 9.39(s,1H) ppm	368.0
38		2.36	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 1.15(t,6H), 3.44(q,4H), 7.94-7.96(m,1H), 8.06-8.13(m,2H), 8.81(s,1H), 9.20(s,1H), 9.38(s,2H), 8.52(s,1H) ppm	402.1
39		2.98	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 1.14(t,6H), 3.43(q,4H), 7.93-7.95(m,1H), 8.05-8.12(m,2H), 8.27-8.31(m,1H), 8.61-8.62(m,1H), 8.77(s,1H), 9.10(s,1H), 9.50(s,1H) ppm	419.1
40		2.49	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 1.14(t,6H), 3.42(q,4H), 7.60-7.64(m,1H), 7.91-7.93(m,1H), 8.05-8.07(m,2H), 8.29-8.32(m,1H), 8.58-8.60(m,1H), 8.71(s,1H), 9.18-9.19(m,1H), 9.46(s,1H) ppm	401.1
41 (PE F)		1.17	$^1\text{H NMR(D6-DMSO)}$: 2.03 (s,3H), 7.60-7.64 (m,1H), 7.92-7.94 (m,1H), 8.08-8.10 (m,1H), 8.17-8.20 (m,1H), 8.29-8.31 (m,1H), 8.37 (s,1H), 8.59-8.60 (m,1H), 9.16-9.17 (m,1H), 9.26 (s,1H), 12.31 (s,1H) ppm	344.1

10

20

30

40

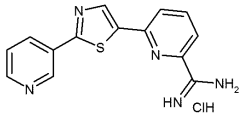
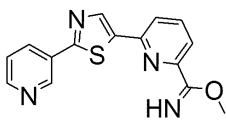
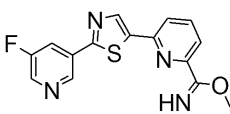
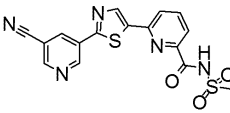
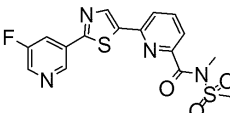
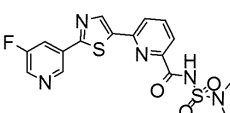
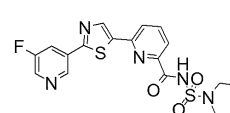
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
42		1.43	¹H NMR(D6-DMSO): 0.92(t,3H), 2.32(q,2H), 7.60-7.64(m,1H), 7.92-7.94(1H), 8.07-8.09(m,1H), 8.17-8.20(m,1H), 8.28-8.31(m,1H), 8.36(s,1H), 8.59-8.60(m,1H), 9.16-9.17(m,1H), 9.26(2H), 12.3(s,1H) ppm	358.1
43		1.49	¹H NMR(D6-DMSO): 0.66-0.70(m,2H), 0.83-0.86(m,2H), 1.84(m,1H), 7.60-7.64(m,1H), 7.89-7.91(m,1H), 8.05-8.10(m,1H), 8.16-8.19(m,1H), 8.29-8.32(m,1H), 8.36(s,1H), 8.58-8.60(m,1H), 9.17-9.18(m,1H), 9.28(s,1H), 12.6(br, 1H) ppm	370.1
44		1.55	¹H NMR(D6-DMSO): 2.08(s,3H), 7.93-7.95(m,1H), 8.06-8.08(m,1H), 8.18-8.22(m,1H), 8.30-8.32(m,1H), 8.39(s,1H), 8.62-8.63(m,1H), 9.09(s,1H), 9.31(s,1H) ppm	362.1
45		1.16	¹H NMR(D6-DMSO): 3.20(s,1H), 7.59-7.62(m,1H), 8.26(s,1H), 8.27-8.30(m,2H), 8.40(s,1H), 8.57-8.58(m,1H), 9.13(s,1H), 9.14-9.15(m,1H) ppm	305.1
46 (PE H)		1.68	¹H NMR(D6-DMSO): 2.99(s,3H), 7.96(s,1H), 8.33(s,1H), 8.34(s,1H), 8.55-8.57(m,1H), 9.10(s,1H), 9.12(s,1H) ppm	368.0
47		1.4	¹H NMR(D6-DMSO): 3.65(s,1H), 7.92-7.93(m,1H), 8.04-8.06(m,1H), 8.16-8.20(m,1H), 8.29-8.33(m,1H), 8.35(s,1H), 8.63-8.64(m,1H), 9.09(s,1H), 9.28(s,1H) ppm	438.1

10

20

30

40

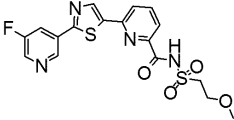
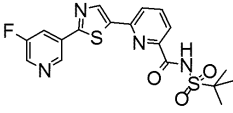
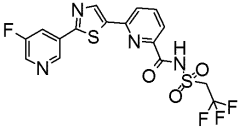
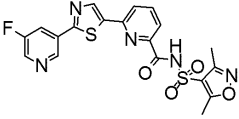
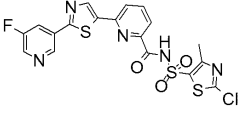
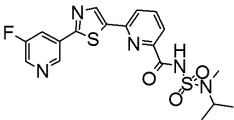
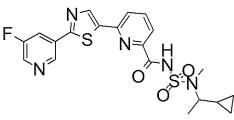
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
48			$^1\text{H NMR (DMSO-d}_6\text{): 7.60-7.62 (1\text{H, m}), 8.24-8.29 (2\text{H, m}), 8.38-8.41 (2\text{H, m}), 8.27-8.73 (1\text{H, s}), 9.20-9.21 (1\text{H, m}) \text{ ppm}$	282 (HCl salt-free)
49			$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{) } \delta: 9.27-9.25 (2\text{H, m}), 8.71-8.69 (1\text{H, m}), 8.37 (1\text{H, s}), 8.32-8.29 (1\text{H, m}), 7.89-7.77 (3\text{H, m}), 7.45-7.41 (1\text{H, m}), 4.04 (3\text{H, s}) \text{ ppm}$	
50 (PE J)			$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{) } \delta: 9.24 (1\text{H, s}), 9.06 (1\text{H, s}), 8.56 (1\text{H, s}), 8.38 (1\text{H, s}), 8.07-8.05 (1\text{H, m}), 7.91-7.87 (1\text{H, m}), 7.81-7.79 (2\text{H, m}), 4.05 (3\text{H, s}) \text{ ppm}$	
51		1.95	$^1\text{H NMR (d}_6\text{-DMSO) } = 3.4 (\text{s}, 3\text{H}), 8.02 (\text{m}, 1\text{H}), 8.20 (\text{m}, 1\text{H}), 8.33 (\text{m}, 1\text{H}), 8.95 (\text{m}, 2\text{H}), 9.15 (\text{m}, 1\text{H}), 9.48 (\text{m}, 1\text{H}), 11.80 (\text{br}, 1\text{H}) \text{ ppm.}$	386.0
52		2.27 5	$^1\text{H NMR (d}_6\text{-DMSO) } = 3.35 (\text{s}, 3\text{H}), 3.57 (\text{s}, 3\text{H}), 7.68 (\text{m}, 1\text{H}), 8.12 (\text{m}, 1\text{H}), 8.30 (\text{m}, 2\text{H}), 8.72 (\text{m}, 1\text{H}), 8.80 (\text{m}, 1\text{H}), 9.11 (\text{m}, 1\text{H}) \text{ ppm.}$	393.0
53		2.54	$^1\text{H NMR (d}_6\text{-DMSO) } = 2.95 (\text{s}, 6\text{H}), 8.00 (\text{m}, 1\text{H}), 8.17 (\text{m}, 1\text{H}), 8.35 (\text{m}, 2\text{H}), 8.75 (\text{m}, 1\text{H}), 8.95 (\text{m}, 1\text{H}), 9.11 (\text{m}, 1\text{H}), 11.5 (\text{br}, 1\text{H}) \text{ ppm.}$	408.0
54		3.29	$^1\text{H NMR (d}_6\text{-DMSO) } = 1.4-1.6 (\text{m}, 6\text{H}), 3.2-3.4 (\text{m}, 4\text{H}), 7.99 (\text{m}, 1\text{H}), 8.18 (\text{m}, 1\text{H}), 8.33 (\text{m}, 2\text{H}), 8.75 (\text{m}, 1\text{H}), 8.89 (\text{m}, 1\text{H}), 9.12 (\text{m}, 1\text{H}), 11.3 (\text{br}, 1\text{H}) \text{ ppm.}$	448.0

10

20

30

40

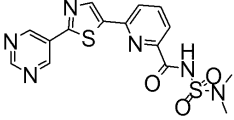
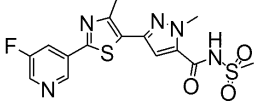
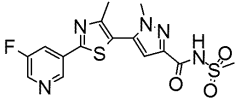
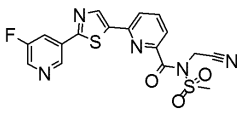
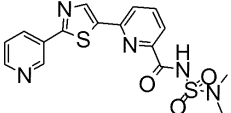
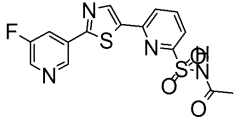
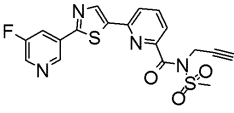
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
55		2.19	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 3.15$ (m,2H), 3.78 (m,2H), 7.97 (m,1H), 8.18 (m,1H), 8.33 (m,2H), 8.72 (m,1H), 8.90 (m,1H), 9.10 (m,1H), 11.7 (br,1H) ppm.	423.1
56		2.77	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 1.40$ (s,9H), 7.90 (m,1H), 8.10 (m,1H), 8.30 (m,2H), 8.71 (m,1H), 8.85 (m,1H), 9.09 (m,1H), 11.0 (br,1H) ppm.	421.1
57		2.58	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 4.71$ (m,2H), 7.99 (m,1H), 8.15 (m,1H), 8.33 (m,2H), 8.74 (m,1H), 8.88 (m,1H), 9.11 (m,1H) ppm.	447.0
58		3	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.69$ (s,6H), 7.90 (m,1H), 8.05 (m,1H), 8.25 (m,1H), 8.33 (m,1H), 8.71 (m,1H), 8.84 (m,1H), 9.11 (m,1H) ppm.	460.0
59		3.41	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.55$ (s,3H), 7.91 (m,1H), 8.05 (m,1H), 8.25 (m,1H), 8.32 (m,1H), 8.71 (m,1H), 8.81 (m,1H), 9.10 (m,1H) ppm.	495.9
60		3.09	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 1.05$ (d,6H), 2.85 (s,3H), 4.18 (m,1H), 7.98 (m,1H), 8.17 (m,1H), 8.32 (m,2H), 8.72 (m,1H), 8.90 (m,1H), 9.11 (m,1H) ppm.	436.0
61		3.47	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 0.3-1.2$ (m,8H), 2.99 (s,3H), 3.30 (m,1H), 7.98 (m,1H), 8.16 (m,1H), 8.31 (m,2H), 8.72 (m,1H), 8.90 (m,1H), 9.11 (m,1H) ppm.	462.0

10

20

30

40

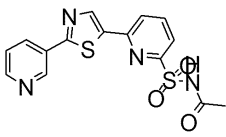
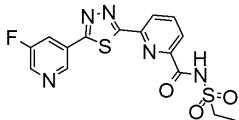
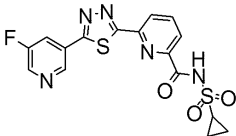
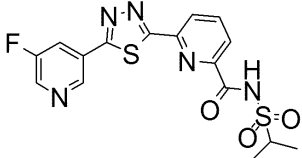
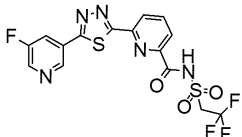
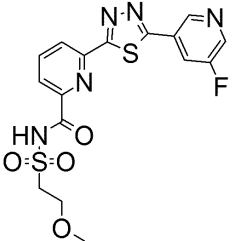
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
62		1.9	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.95$ (s,6H), 8.00 (m,1H), 8.17 (m,1H), 8.32 (m,1H), 8.95 (m,1H), 9.30 (m,1H), 9.40 (m,1H), 11.4 (m,1H) ppm.	391.0
63 (PE I)		2.04	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.55$ (s,3H), 3.40 (s,3H), 4.12 (s,3H), 7.68 (m,1H), 8.12 (m,1H), 8.69 (m,1H), 9.01 (m,1H) ppm.	396.0
64		1.84	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.45$ (s,3H), 3.25 (s,3H), 3.90 (s,3H), 7.12 (m,1H), 8.29 (m,1H), 8.72 (m,1H), 9.04 (m,1H) ppm.	396.0
65		2.28	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 3.71$ (s,3H), 4.98 (s,2H), 7.70 (m,1H), 8.17 (m,1H), 8.35 (m,2H), 8.75 (m,1H), 8.85 (m,1H), 9.09 (m,1H) ppm.	418.1
66		2.01	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.93$ (s,6H), 7.60 (m,1H), 8.00 (m,1H), 8.15 (m,1H), 8.32 (m,1H), 8.40 (m,1H), 8.73 (m,1H), 8.90 (m,1H), 9.23 (m,1H), 11.5 (br,1H) ppm.	390.0
67		1.72	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.01$ (s,3H), 8.03 (m,1H), 8.25 (m,2H), 8.40 (m,1H), 8.78 (m,1H), 8.80 (m,1H), 9.09 (m,1H), 12.3 (br,1H) ppm.	379.0
68		2.56	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 3.65$ (s,3H), 4.71 (s,2H), 7.70 (m,1H), 8.12 (m,1H), 8.32 (m,2H), 8.71 (m,1H), 8.81 (m,1H), 9.10 (m,1H) ppm.	417.0

10

20

30

40

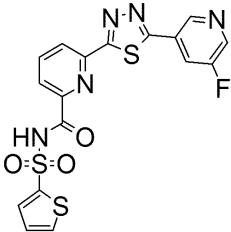
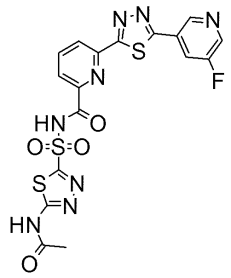
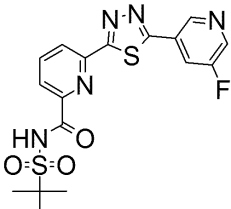
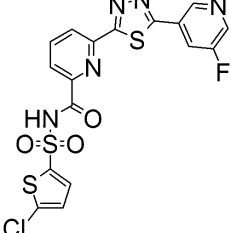
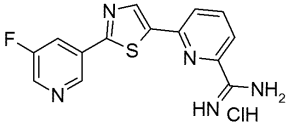
番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
69 (PE E)		1.3	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)} = 2.03$ (s,3H), 7.61 (m,1H), 8.02 (m,1H), 8.13 (m,1H), 8.30 (m,1H), 8.41 (m,1H), 8.71 (m,1H), 8.91 (m,1H), 9.20 (m,1H) ppm.	361.0
70		2.07	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}=1.3$ (t,3H), 3.6 (m,2H), 8.2 (m,1H), 8.3 (m,1H) 8.45 (m,1H), 8.6 (m,1H) 8.85 (s,1H) 9.2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	393.4
71		2.14	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}=1.15$ (m,2H), 1.25 (m,1.25), 3.15 (m,1H), 8.2 (m,1H), 8.3 (m,1H) 8.45 (m,1H), 8.6 (m,1H) 8.85 (s,1H) 9.2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	405
72		2.31	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}=1.35$ (d,6H), 3.8 (m,1H), 8.2 (m,1H), 8.3 (m,1H) 8.45 (m,1H), 8.6 (m,1H) 8.85 (s,1H) 9.2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	407
73		2.42		447
74		1.97	$^1\text{H NMR (d6-DMSO)}=3.2$ (m,3H), 3.75 (s,2H), 3.8 (m,2H) 8.2 (m,1H), 8.3 (m,1H), 8.5 (m,1H), 8.6 (m,1H) 8.85 (s,1H) 9.2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	423

10

20

30

40

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ	質量 $M^+ + 1$
75		2.38		447
76		1.43		506
77		2.38		421
78		3.08		482
79 (PE K)			^1H NMR (DMSO-D_6) δ: 9.08-9.07 (1H, m), 8.93 (1H, s), 8.75-8.74 (1H, m), 8.41-8.39 (1H, m), 8.31-8.26 (2H, m), 8.22-8.19 (1H, m) ppm	300 (HCl 塩-フリー)

P E = 調製例

前記した調製方法を用いて、式 (X I I) の以下の中間体を得た：
【 0 3 4 6 】

10

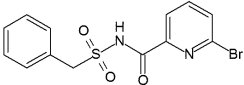
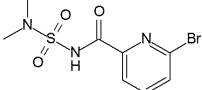
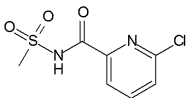
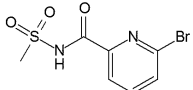
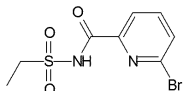
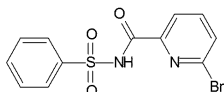
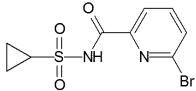
20

30

40

50

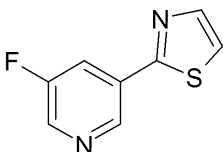
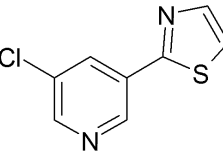
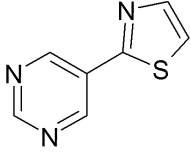
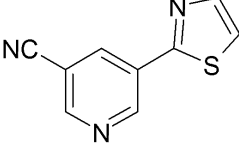
【表 2】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XII-1		2.4	¹ H NMR(D6-DMSO): 4.83 (s, 2H), 7.34-7.40 (m, 5H), 7.94-7.95 (m, 1H), 7.98-8.00 (m, 1H), 8.05-8.07 (m, 1H), 12.3(bs, 1H)
XII-2		1.82	¹ H NMR(D6-DMSO):2.90(s,6H), 7.93-8.00(m,2H), 8.04-8.06(m,1H), 11.80(s,1H)
XII-3		1.15	¹ H NMR (d6-DMSO): 3.33 (s,3H), 7.78 (m,1H), 8.05 (m,2H) ppm.
XII-4		1.28	¹ H NMR (d6-DMSO): 3.37 (s,3H), 7.95 (m,2H), 8.06 (m,1H) ppm.
XII-5		1.54	¹ H NMR(D6-DMSO):1.27(t,3H), 3.50(q,2H), 7.94-8.01(m,2H), 8.05-8.07(m,1H), 11.90(s,1H)
XII-6		2.32	¹ H NMR(DMSO):7.57-7.70(m,3H), 7.84-8.01(m,5H)
XII-7		1.7	¹ H NMR(D6-DMSO):1.07-1.21(m,4H), 3.05-3.11(m,1H), 7.93-8.01(m,3H), 8.06-8.08(m,2H),12.00(s,1H)

前記した調製方法を用いて、式 (X I I I) の以下の中間体を得た。

【 0 3 4 7 】

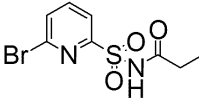
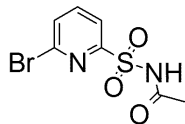
【表 3】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XIII-1		1.51	¹H NMR (DMSO): 7.93 (m,1H), 8.03 (m,1H), 8.17 (m,1H), 8.63 (m,1H), 9.02 (m,1H)
XIII-2		1.94	¹H NMR (DMSO): 7.96 (m,1H), 8.05 (m,1H), 8.42 (m,1H), 8.73 (m,1H), 9.11 (m,1H)
XIII-3		0.69	¹H NMR (DMSO): 7.95 (m,1H), 8.07 (m,1H), 9.25 (m,1H), 9.30 (m,2H)
XIII-4		1.34	¹H NMR (DMSO): 8.00 (m,1H), 8.08 (m,1H), 8.83 (m,1H) 9.12 (m,1H), 9.40 (m,1)

前記した調製方法を用いて、式 (XIV) の以下の中間体を得た：

【0348】

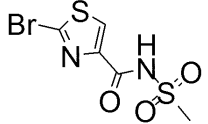
【表 4】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XIV-1		1.32	¹H NMR (d6-DMSO): 0.92(t,3H), 2.28(q,2H), 7.99(m,1H), 8.06-8.13(m,2H), 12.39(br,1H)
XIV-2		0.95	¹H NMR (d6-DMSO): 1.98 (s,3H), 7.98-8.12 (m,3H), 12.4 (br,1H) ppm

前記した調製方法を用いて、式 (XV) の以下の中間体を得た：

【0349】

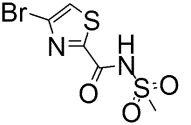
【表 5】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XV-1		0.82	¹ H NMR (d6-DMSO): 3.33 (s, 3H), 8.61 (s, 1H), 12.00 (s, 1H)

前記した調製方法を用いて、式 (X V I) の以下の中間体を得た：

【0350】

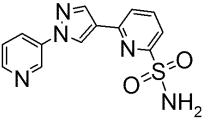
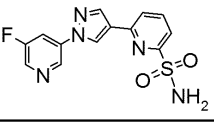
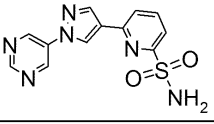
【表 6】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XVI-1		0.63	¹ H NMR (d6-DMSO): 3.31(s,3H), 8.31(s,1H)

前記した調製方法を用いて、式 (X V I I) の以下の中間体を得た：

【0351】

【表 7】

番号	化合物	logP (HCOOH)	NMR データ
XVII-1		0.99	¹ H NMR (d6-DMSO): 7.43 (s, 2H), 7.60-7.63 (m, 1H), 7.76 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.11 (t, 1H), 8.28-8.31 (m, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.58-8.60 (m, 1H), 9.16-9.17 (m, 1H), 9.33 (s, 1H)
XVII-2		1.44	¹ H NMR (d6-DMSO): 7.78(s,2H), 7.77-7.79(m,1H), 7.99-8.01(m,1H), 8.12-8.14(m,1H), 8.29-8.32(m,1H), 8.57(s,1H), 8.62-8.63(m,1H), 9.09(s,1H), 9.41(s,1H)
XVII-3		0.89	¹ H NMR (d6-DMSO): 7.48(s,2H), 7.78-7.80(m,1H), 7.99-7.80(m,1H), 8.12-8.16(m,1H), 8.60(s,1H), 9.21(s,1H), 9.38(s,2H), 9.41(s,1H)

1) log P 値の決定のための方法の記載 (ギ酸方法)

表に与えられた $\log P$ 値は、逆相カラム (C18) を用いて、HPLC (高速液体クロマトグラフィー) によって、EEC 指令 79/831 添付文書 V. A8 に従って決定した。温度: 55℃。

酸性範囲 (pH 3.4) における決定のための溶離剤:

溶離剤 A: アセトニトリル + 1 ml のギ酸 / リットル。溶離剤 B: 水 + 0.9 ml のギ酸 / リットル。

グラジエント: 4.25 分で 10% 溶離剤 A / 90% 溶離剤 B から 95% 溶離剤 A / 5% 溶離剤 B

キャリブレーションは、既知の $\log P$ 値を持つ (3 から 16 の炭素原子を有する) 分岐していないアルカン-2-オン類で行った ($\log P$ 値は、2つの連続するアルカノンの間の線形内挿によって保持時間に基づいて決定した)。ラムダ最大値は、200 nm から 400 nm の UV スペクトルを用いてクロマトグラフィーシグナルの最大において決定した。

10

2) NMR スペクトルの測定

NMR スペクトルは、流動プローブヘッド (容量 60 μ l) にフィットさせた Bruker Avance 400 で決定した。用いた溶媒は参照として用いたテトラメチルシラン (0.00 ppm) を含む、 CD_3CN または d_6 -DMSO であった。特別な場合においては、NMR スペクトルは Bruker Avance II 600 で決定した。用いた溶媒は、参照として用いたテトラメチルシラン (0.00 ppm) を含む CD_3CN または d_6 -DMSO であった。

20

【0352】

シグナルの分裂は以下のように記載した: s (シングレット)、d (ダブルット)、t (トリプレット)、q (カルテット)、quin (クインテット)、m (マルチプレット)。

生物学的実施例

アブラムシ (Myzus) テスト (スプレー処理)

溶媒: 78 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 0.5 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な有効成分製剤を調製するために、1 重量部の有効成分を示された量の溶媒および乳化剤と混合し、および濃縮物を乳化剤-含有水で希釈して、所望の濃度を得る。

30

【0353】

全ての段階のモモアカアブラムシ (Myzus persicae) によって寄生された白菜 (Brassica pekinensis) のディスクに、所望の濃度の有効成分製剤をスプレーする。

【0354】

所望の時間の後、% で表した効力を決定する。100% はアブラムシの全てが死滅したことを意味し; 0% はアブラムシのいずれも死滅しなかったことを意味する。

【0355】

このテストにおいては、例えば、調製例の以下の化合物は、500 g / ha の適用率において 80% の効力を示した: 1、10、15、21、28、62、63。

40

【0356】

このテストにおいては、例えば、調製例の以下の化合物は、500 g / ha の適用率にて、90% の効力を示した: 5、14、23、32、34、37、38、45、47、48、65、74。

【0357】

このテストにおいては、例えば、調製例の以下の化合物は、500 g / ha の適用率において、100% の効力を示した: 2、3、4、6、7、8、9、11、12、13、16、17、18、19、20、22、24、25、26、27、29、30、31、33、35、36、39、40、41、42、43、44、46、51、52、53、54、

50

55、56、57、58、59、60、61、64、66、67、68、69、70、71、72、73、75、76、77、78。

テトラニクス (Tetranychus) テスト、OP-抵抗性 (スプレー処理)

溶媒：78.0重量部のアセトン

1. 5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：0.5重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適当な有効成分製剤を調製するために、1重量部の有効成分を述べられた量の溶媒および乳化剤と混合し、および濃縮物を乳化剤-含有水で所望の濃度まで希釈する。全ての段階のナミハダニ (red spider mite) (Tetranychus urticae) によって寄生された豆葉 (Phaseolus vulgaris) のディスクに、所望の濃度の有効成分製剤をスプレーする。

10

【0358】

所望の時間の後、%で表した効力を決定する。100%は、該ナミハダニの全てが死滅したことを意味し；0%は、該ナミハダニのいずれも死滅しなかったことを意味する。

【0359】

このテストにおいては、例えば、調製例の以下の化合物は、500g/haの適用率にて、100の効力を示した：5。

ネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) テスト

溶媒：80.0重量部のアセトン

適当な有効成分製剤を調製するために、1重量部の有効成分を示された量の溶媒と混合し、および濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。

20

【0360】

容器に砂、有効成分の溶液、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) の卵/幼虫懸濁液およびレタス種子を充填する。レタスの種子は発芽し、および植物が発生する。こぶが根で発生する。

【0361】

所望の時間の後、殺線虫作用は%で表したこぶ形成によって決定される。100%はこぶが発生しなかったことを意味し；0%は処理された植物上のこぶの数が未処理の対象に対応することを意味する。

【0362】

このテストにおいて、例えば、調製例の以下の化合物は、20ppmの適用率において、100%の効力を示した：56、70、75、78。

Myzus スプレーテスト

予備的な混合物溶媒：Sorpol (登録商標) SD : Sorpol (登録商標) BDB : ジメチルホルムアミド = 3 : 3 : 14

適当な有効成分製剤を調製するために、10mgの有効成分を0.05mlの溶媒と混合し、および濃縮物を水で所望の濃度まで希釈する。各場合における溶液は1000ppmのRME (菜種油メチルエステル) およびAMS (硫酸アンモニウム) を含有する。

【0363】

全ての段階のモモアカアブラムシ (Myzus persicae 有機リン酸エステル/カルバメート抵抗性株) によって寄生されたナス植物 (Solanum melongena var. Senryō 2gou) に所望の濃度の有効成分製剤をスプレーする。

40

【0364】

6日後、%で表した効力を決定する：

100%：全ての昆虫は死滅し、

98%：1から4の昆虫が生き残り、

95%：5から20の昆虫が生き残り、

60%：未処理対象におけるよりも少数の昆虫が生き残り、および

0%：未処理対象とは差なし。

50

【0365】

このテストにおいては、例えば、調製例の以下の化合物は、100 ppmの適用率において、100%の効力を示した：49、50。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I
A 0 1 P 7/04	(2006.01)	A 0 1 P 7/04
C 0 7 D 213/71	(2006.01)	C 0 7 D 213/71
C 0 7 D 213/78	(2006.01)	C 0 7 D 213/78
C 0 7 D 417/12	(2006.01)	C 0 7 D 417/12
C 0 7 D 417/14	(2006.01)	C 0 7 D 417/14

(31)優先権主張番号 10167453.9

(32)優先日 平成22年6月28日(2010.6.28)

(33)優先権主張国 欧州特許庁(EP)

(74)代理人 100129713

弁理士 重森 一輝

(74)代理人 100137213

弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448

弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100183519

弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483

弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100203035

弁理士 五味渕 琢也

(74)代理人 100185959

弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 ブレトシユナイダー, トーマス

ドイツ国、5 3 7 9 7・ローマー、タールシュトラッセ・2 9・ベ

(72)発明者 フイツシャー, ライナー

ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ネリーザツクスーシュトラッセ・2 3

(72)発明者 フュースライン, マルティン

ドイツ国、4 0 2 2 5・ドゥツセルドルフ、ビツエルシュトラッセ・9

(72)発明者 ジェシユケ, ペーター

ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギツシュ・グラツドバツハ、カルミユンテネール・シュトラッセ・4
4アー

(72)発明者 ケーラー, アデリーネ

ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ハイムケンヴェーク・9

(72)発明者 クルート・ヨアヒム

ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ファイルネブルクシュトラッセ・6 9

(72)発明者 ミュールタウ, フリードリヒ・アウグスト

ドイツ国、6 5 8 1 2・バツド・ソーデン・アム・タウヌス、ヴァイスバーデナー・ヴェーク・8

(72)発明者 佐藤 善孝

〒3 0 0 - 2 6 4 8 茨城県つくば市豊里の杜2-10-10

(72)発明者 フェールステ, アルント
ドイツ国、50674・ケルン、モーツアルトシュトラッセ・3-5

(72)発明者 下城 英一
〒586-0018大阪府河内長野市千代田南町8-8 プレミアムコート千代田201号

合議体

審判長 中田 とし子

審判官 榎本 佳予子

審判官 木村 敏康

(56)参考文献 国際公開第2001/009098 (WO, A1)

特開平06-080653 (JP, A)

特開平04-247072 (JP, A)

米国特許第6610853 (US, B1)

国際公開第2010/006713 (WO, A2)

Database Registry, Chemical Abstracts Service, Accession No. RN1024343-62-1, [online], 収載日2008年6月1日

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D

A01N

REGISTRY (STN)

CAplus (STN)