

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2017-508753

(P2017-508753A)

(43) 公表日 平成29年3月30日 (2017. 3. 30)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 249/14 (2006. 01)	C 0 7 D 249/14 5 0 3	4 C 0 6 3
C 0 7 D 401/04 (2006. 01)	C 0 7 D 401/04 C S P	4 C 0 8 6
C 0 7 D 257/06 (2006. 01)	C 0 7 D 257/06 A	4 H 0 1 1
A 6 1 K 31/4196 (2006. 01)	A 6 1 K 31/4196	
A 6 1 K 31/4439 (2006. 01)	A 6 1 K 31/4439	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 169 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2016-555741 (P2016-555741)	(71) 出願人	507203353
(86) (22) 出願日	平成27年3月4日 (2015. 3. 4)		バイエル・クロップサイエンス・アクチェンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成28年11月7日 (2016. 11. 7)		ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム・アム・ライン、アルフレートーノベルーシュトラーセ・5 0
(86) 国際出願番号	PCT/EP2015/054550		
(87) 国際公開番号	W02015/132313	(74) 代理人	100091982
(87) 国際公開日	平成27年9月11日 (2015. 9. 11)		弁理士 永井 浩之
(31) 優先権主張番号	14157977.1	(74) 代理人	100091487
(32) 優先日	平成26年3月6日 (2014. 3. 6)		弁理士 中村 行孝
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)	(74) 代理人	100082991
			弁理士 佐藤 泰和
		(74) 代理人	100105153
			弁理士 朝倉 悟
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 殺虫剤としてのヘテロ環化合物

(57) 【要約】

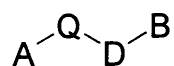
本出願は、新規のヘテロ環化合物、節足動物、昆虫類および線形動物を包含する動物の害虫を防除するための当該化合物の使用、および、当該新規化合物の調製のためのプロセスおよび中間体に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】

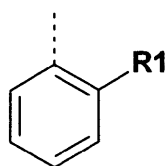


(I)

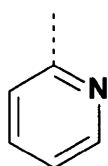
10

〔式中、
A は、次の群

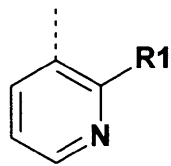
【化 2】



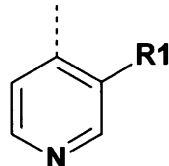
A-1



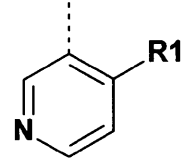
A-2



A-3

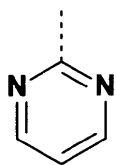


A-4

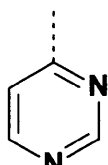


A-5

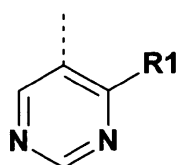
20



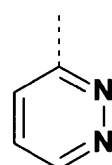
A-6



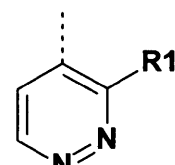
A-7



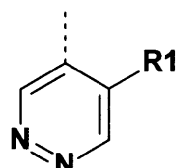
A-8



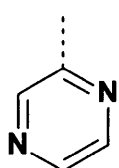
A-9



A-10



A-11



A-12

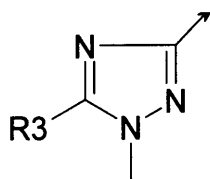
30

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線は Q との結合を指し、A はさらに m 個の R² 置換基を保有し、
Q は、次の群

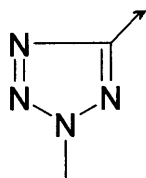
【化 3】

40



Q-1

【化 4】

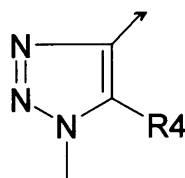


Q-2

10

および

【化 5】



Q-3

20

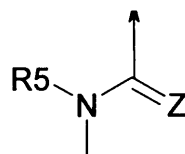
のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、および

、

D は、次の式

【化 6】



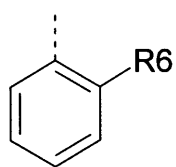
30

のラジカルであり、

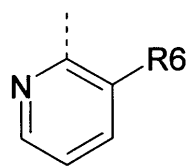
式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、

B は、次の群

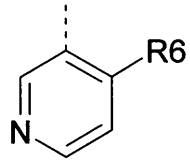
【化 7】



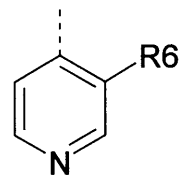
B-1



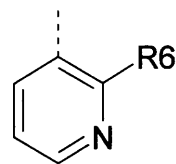
B-2



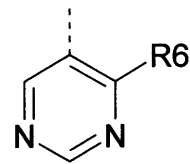
B-3



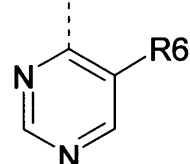
B-4



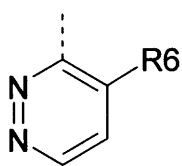
B-5



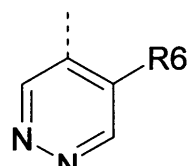
B-6



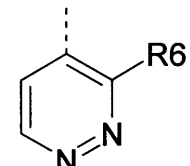
B-7



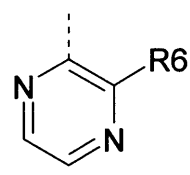
B-8



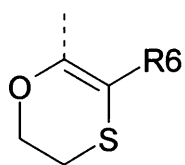
B-9



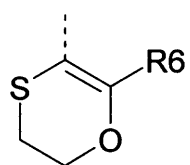
B-10



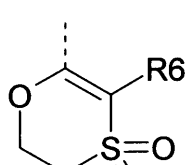
B-11



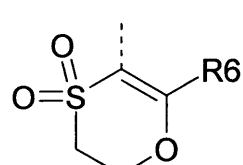
B-12



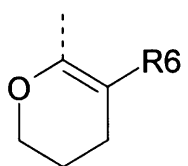
B-13



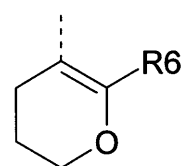
B-14



B-15



B-16

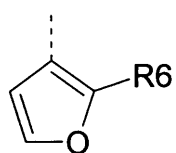


B-17

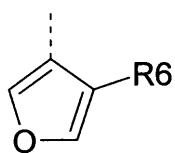
10

20

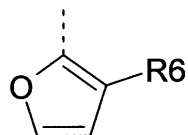
30



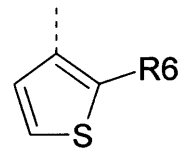
B-18



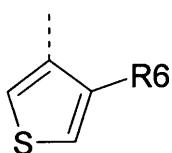
B-19



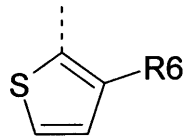
B-20



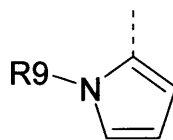
B-21



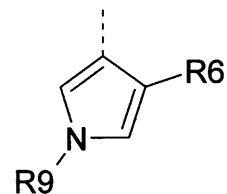
B-22



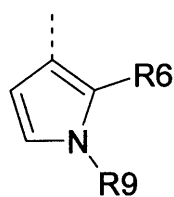
B-23



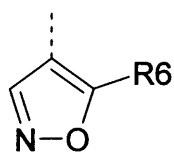
B-24



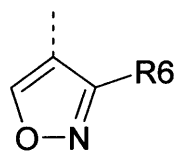
B-25



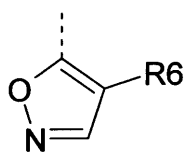
B-26



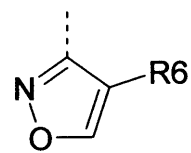
B-27



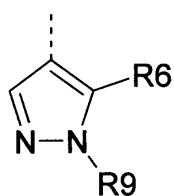
B-28



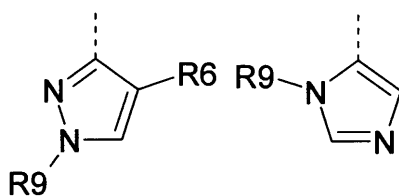
B-29



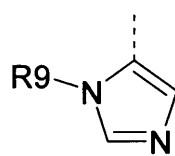
B-30



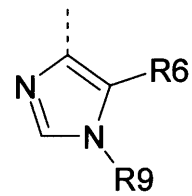
B-31



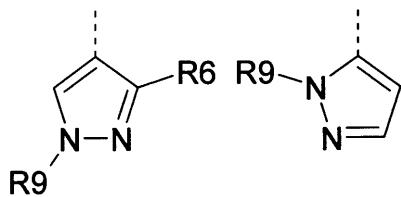
B-32



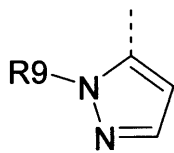
B-33



B-34



B-35



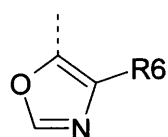
B-36

10

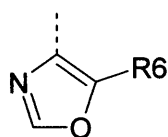
20

30

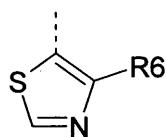
40



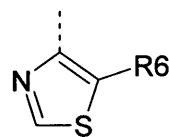
B-37



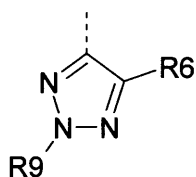
B-38



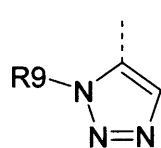
B-39



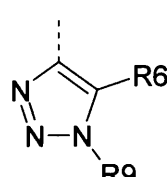
B-40



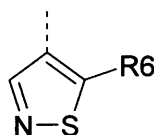
B-41



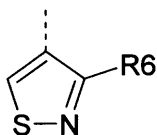
B-42



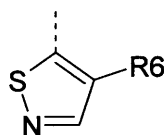
B-43



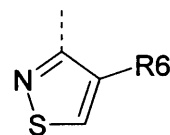
B-44



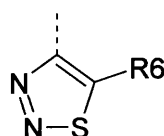
B-45



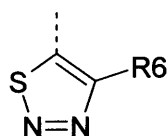
B-46



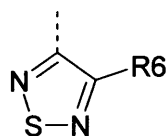
B-47



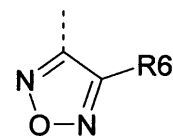
B-48



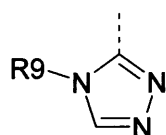
B-49



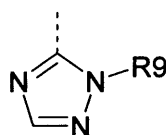
B-50



B-51



B-52



B-53

10

20

30

40

50

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、Zは、酸素または硫黄であり、

R1は、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよいC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルキニルカルボニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆アルキルアミノ、C₃-C₆アルケニルアミノ、C₃-C₆アルキニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ、C₂-C₆アルケニルカルボニルアミノ、C₂-C₆アルキニルカルボニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノ、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₆アルキルチオ、C₃-C₆アルケニルチオ、C₃-C₆アルキニルチオ、C₃-C₆シクロアルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ-（C₁-

C₆ アルキル) アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノスルホニル、C₁ - C₆ アルキルチオカルボニルアミノ、C₄ - C₁₂ ビシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、アリールアミノ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアミノおよびヘテロアリールチオの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシおよびヘテロアリールチオからそれぞれ独立して選択され、

R₂ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₂ - C₆ アルキニル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ アルケノキシ、C₃ - C₆ アルキノキシ、C₃ - C₆ シクロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルカルボニルオキシ、C₂ - C₆ アルケニルカルボニルオキシ、C₂ - C₆ アルキニルカルボニルオキシ、C₃ - C₆ シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ アルコキシカルボニルオキシ、C₁ - C₆ アルキルスルホニルオキシ、C₁ - C₆ アルキルアミノ、C₃ - C₆ アルケニルアミノ、C₃ - C₆ アルキニルアミノ、C₃ - C₆ シクロアルキルアミノ、C₁ - C₆ アルキルカルボニルアミノ、C₂ - C₆ アルケニルカルボニルアミノ、C₂ - C₆ アルキニルカルボニルアミノ、C₃ - C₆ シクロアルキルカルボニルアミノ、C₁ - C₆ アルコキシカルボニルアミノ、C₁ - C₆ アルキルスルホニルアミノ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₃ - C₆ アルケニルチオ、C₃ - C₆ アルキニルチオ、C₃ - C₆ シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、C₁ - C₆ アルコキシイミノ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆ アルキル) - アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノスルホニル、C₁ - C₆ アルキルチオカルボニルアミノ、C₄ - C₁₂ ビシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、アリールアミノ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアミノおよびヘテロアリールチオの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシおよび C₁ - C₆ アルキルチオ、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシおよびヘテロアリールチオからそれぞれ独立して選択され、

R₃ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルキルチオ、C₁ - C₆ ハロアルキルスルフィニルおよび C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R₄ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルキルおよび C₁ - C₆ ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり

R₅ は、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ アルキニル、C₃ - C₆ シクロアルキル - C₁ - C₆ アルキル、シアノ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、C₂ - C₆ アルケニルカルボニル、C₁ - C₆ ハロアルキルカルボニル、C₂ - C₆ ハロアルケニルカルボニル、C₁ - C₆ アルコキシ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニルおよび C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカル、または、C (=O) - B であり、

R₆ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、それぞれの場合で、単数または複数で、互いに同一または異なって置換されている C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆

10

20

30

40

50

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 アルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキノキシ、 C_3-C_6 シクロアルコキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロ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 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ-
(C_1-C_6 アルキル)-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、 C_4-C_{12} ビシクロアルキル、アリーール、アリーールオキシ、ヘテロアリーールおよびヘテロアリーールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシおよび C_1-C_6 アルキルチオからそれぞれ独立して選択され、

R 7 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、各場合で単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 アルケノキシ、 C_3-C_6 アルキノキシ、 C_3-C_6 シクロアルコキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロ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 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル)-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、 C_4-C_{12} ビシクロアルキル、アリーール、アリーールオキシ、ヘテロアリーールおよびヘテロアリーールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシおよび C_1-C_6 アルキルチオからそれぞれ独立して選択され、

R 9 は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、ハロアルキル、 C_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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の群のうちの一つのラジカルであり、

m は、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $m > 1$ の時、R 2 ラジカルは互いに同一または異なっているとしてもよく、ならびに、

n は、0、1、2 および 3 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $n > 1$ の時、R 7 ラジカルは、たがいに同一または異なっているとしてもよく、

ただし、次の式

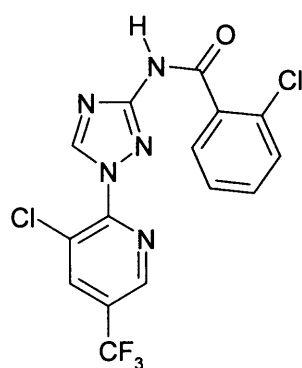
10

20

30

40

【化 8】



10

の化合物を除く〕。

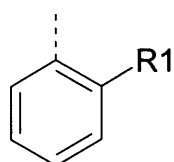
【請求項 2】

前記式 (I) の化合物において、
式中、

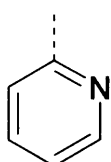
A が次の群

【化 9】

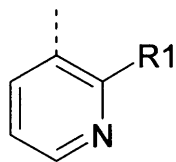
20



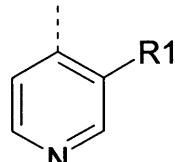
A-1



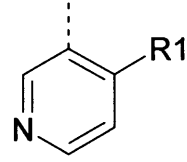
A-2



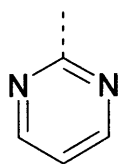
A-3



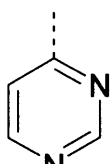
A-4



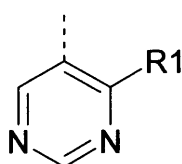
A-5



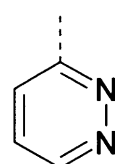
A-6



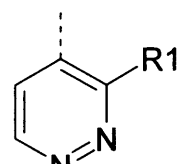
A-7



A-8

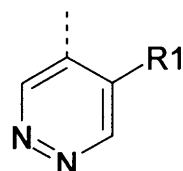


A-9

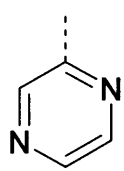


A-10

30



A-11



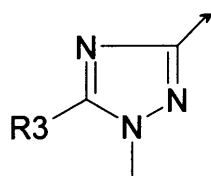
A-12

40

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線は Q との結合を指し、A はさらに m 個の R₂ 置換基を保有し、
Q が、次の群

【化 1 0】

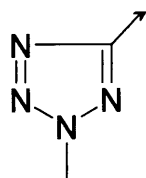


Q-1

10

および

【化 1 1】



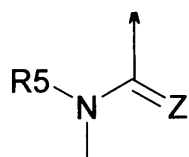
Q-2

20

のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、D が、次の式

【化 1 2】

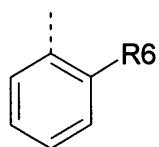


30

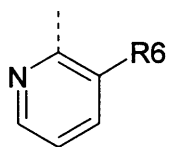
のラジカルであり、

式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、B が、次の群

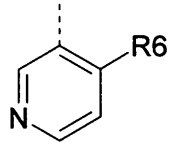
【化 1 3】



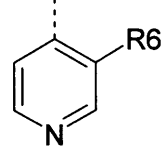
B-1



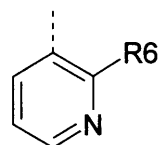
B-2



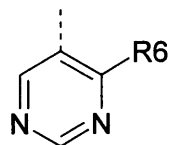
B-3



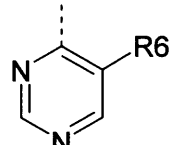
B-4



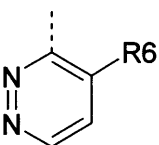
B-5



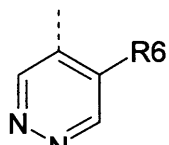
B-6



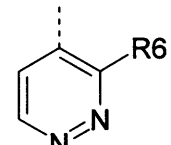
B-7



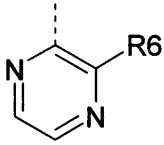
B-8



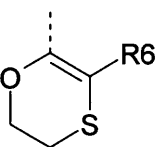
B-9



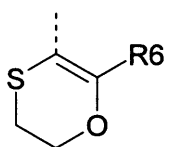
B-10



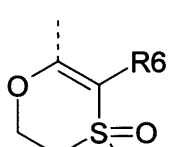
B-11



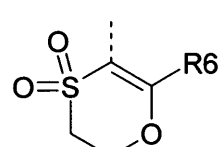
B-12



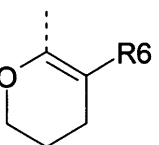
B-13



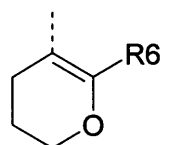
B-14



B-15



B-16

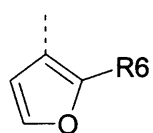


B-17

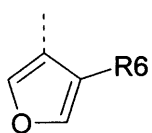
10

20

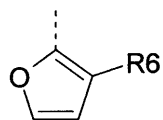
30



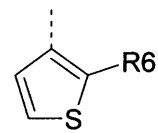
B-18



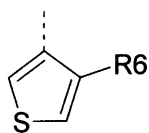
B-19



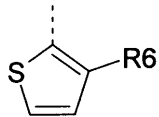
B-20



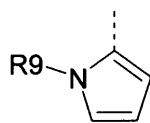
B-21



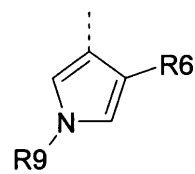
B-22



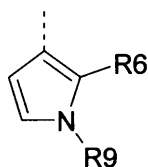
B-23



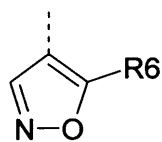
B-24



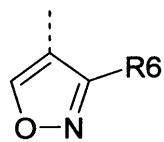
B-25



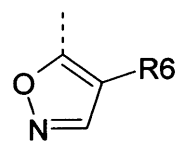
B-26



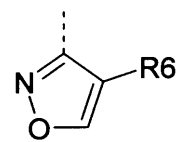
B-27



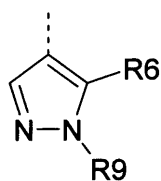
B-28



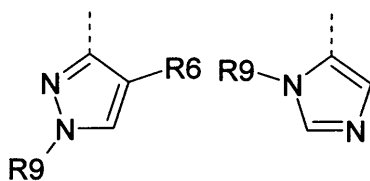
B-29



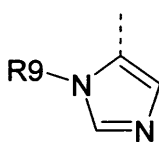
B-30



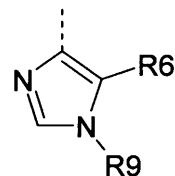
B-31



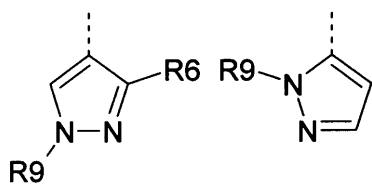
B-32



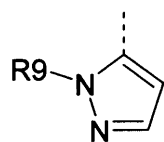
B-33



B-34



B-35



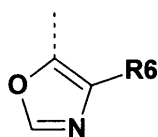
B-36

10

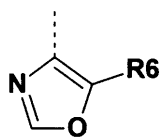
20

30

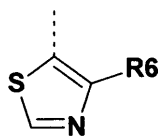
40



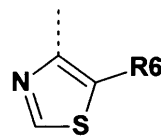
B-37



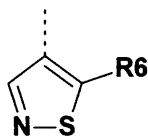
B-38



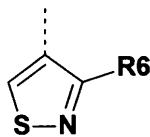
B-39



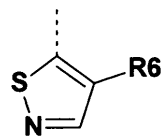
B-40



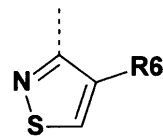
B-44



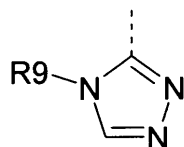
B-45



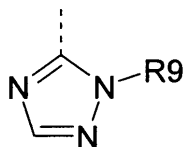
B-46



B-47



B-52



B-53

10

20

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、Zが、酸素または硫黄であり、

R1が、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルキニルカルボニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆アルキルアミノ、C₃-C₆アルケニルアミノ、C₃-C₆アルキニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆ハロアルキルチオ、C₃-C₆アルケニルチオ、C₃-C₆アルキニルチオ、C₃-C₆シクロアルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ-（C₁-C₆アルキル）-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノスルホニル、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R2が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルキニルカルボニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆アルコキシカルボ

30

40

50

ニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルアミノ、 C_3-C_6 アルケニルアミノ、 C_3-C_6 アルキニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 アルケニルチオ、 C_3-C_6 アルキニルチオ、 C_3-C_6 シクロアルキルチオ、 C_3-C_6 ハロシクロアルキルチオ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル)-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 3が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルスルフィニルおよび C_1-C_6 ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R 5が、水素、 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_2-C_6 アルケニル、 C_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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およびC (=O)-Bの群のうちの一つのラジカルであり

R 6が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 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 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_3-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルアミノ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル)-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 7が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 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 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_3-C_6 アルケニルカルボニルア

10

20

30

40

50

ミノ、 C_3-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルアミノ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 9 が、水素、 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_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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の群のうちの一つのラジカルであり、

m が、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $m > 1$ の時、R 2 ラジカルは互いに同一または異なってもよく、ならびに、

n が、0、1、2 および 3 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $n > 1$ の時、R 7 ラジカルは互いに同一または異なってもよい、

請求項 1 に記載の化合物。

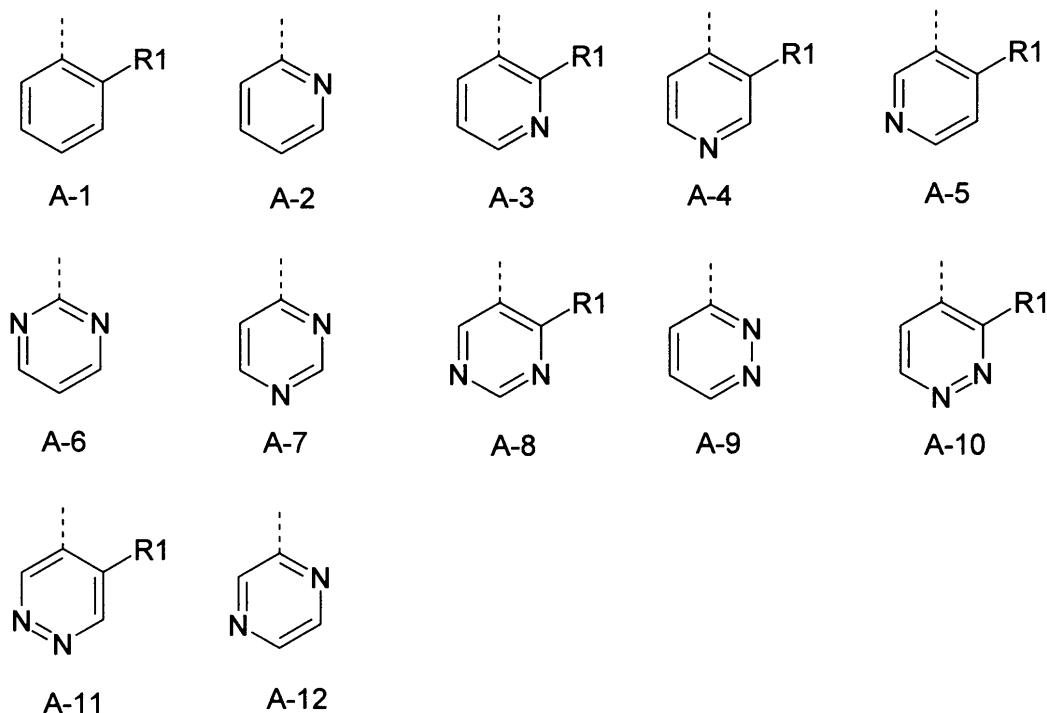
【請求項 3】

前記式 (I) の化合物において、

式中、

A が、次の群

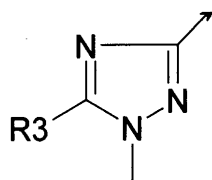
【化 1 4】



のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線は Q との結合を指し、A はさらに m 個の R 2 置換基を保有し、

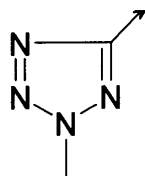
Q が、次の群
【化 1 5】



Q-1

10

および
【化 1 6】



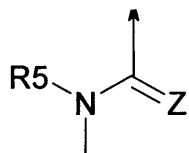
Q-2

20

のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、
D が、次の式

【化 1 7】

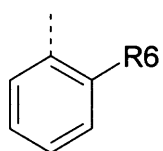


30

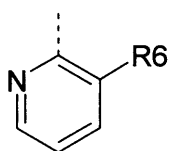
のラジカルであり、

式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、
B が、次の群

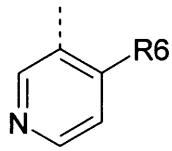
【化 18】



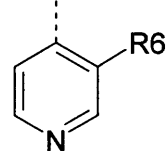
B-1



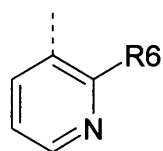
B-2



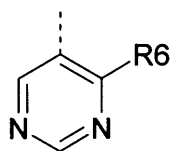
B-3



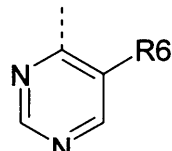
B-4



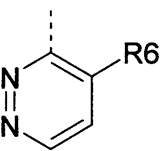
B-5



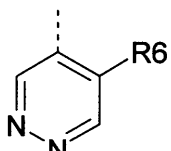
B-6



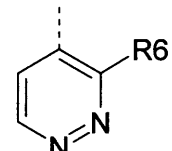
B-7



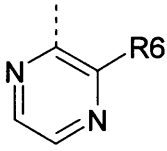
B-8



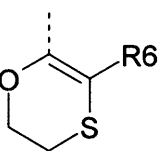
B-9



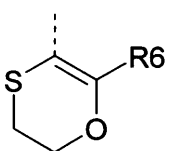
B-10



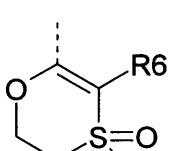
B-11



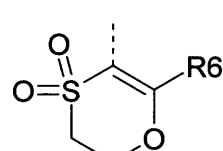
B-12



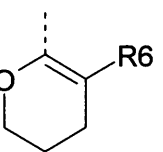
B-13



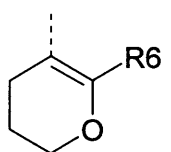
B-14



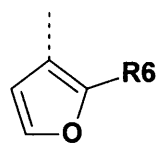
B-15



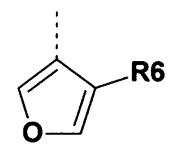
B-16



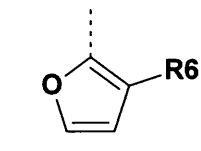
B-17



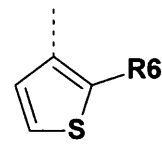
B-18



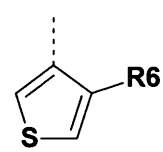
B-19



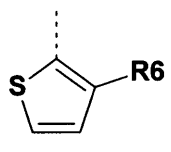
B-20



B-21



B-22



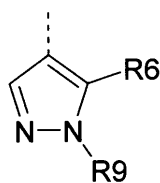
B-23

10

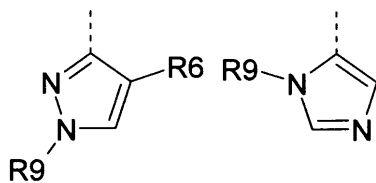
20

30

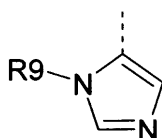
40



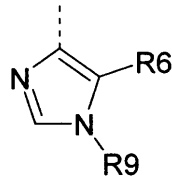
B-31



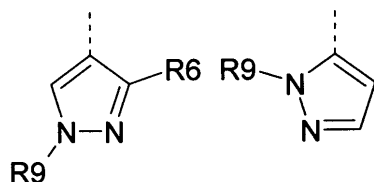
B-32



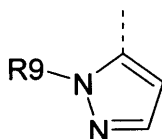
B-33



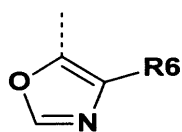
B-34



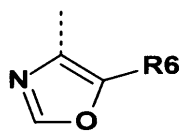
B-35



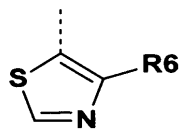
B-36



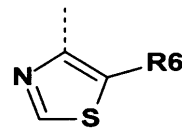
B-37



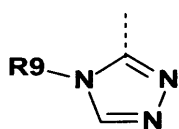
B-38



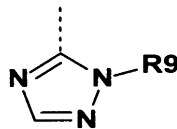
B-39



B-40



B-52



B-53

10

20

30

40

50

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、Zが、酸素または硫黄であり、

R1が、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、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アルキルスルホニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R2が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、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ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆アルコキシ

シイミノ-C₁-C₆アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 3が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキルおよびC₁-C₆ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルであり、

R 5が、水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆ハロアルキル、C₂-C₆アルケニル、C₃-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、C₁-C₆ハロアルキルカルボニル、C₂-C₆ハロアルケニルカルボニル、C₁-C₆アルコキシ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆ハロアルキルスルホニルおよびC (= O) - Bの群のうちの一つのラジカルであり、

R 6が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、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アルキルスルホニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 7が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、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アルキルスルホニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R 9が、水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキルおよびC₁-C₆ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルであり、

mが、0、1、2、3および4の群のうちの一つの数であり、ここで、m > 1の時、R 2ラジカルは互いに同一または異なっているとしてもよく、ならびに、

nが、0、1および2の群のうちの一つの数であり、ここで、n > 1の時、R 7ラジカルは互いに同一または異なっているとしてもよい、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記式 (I) の化合物において、

式中、

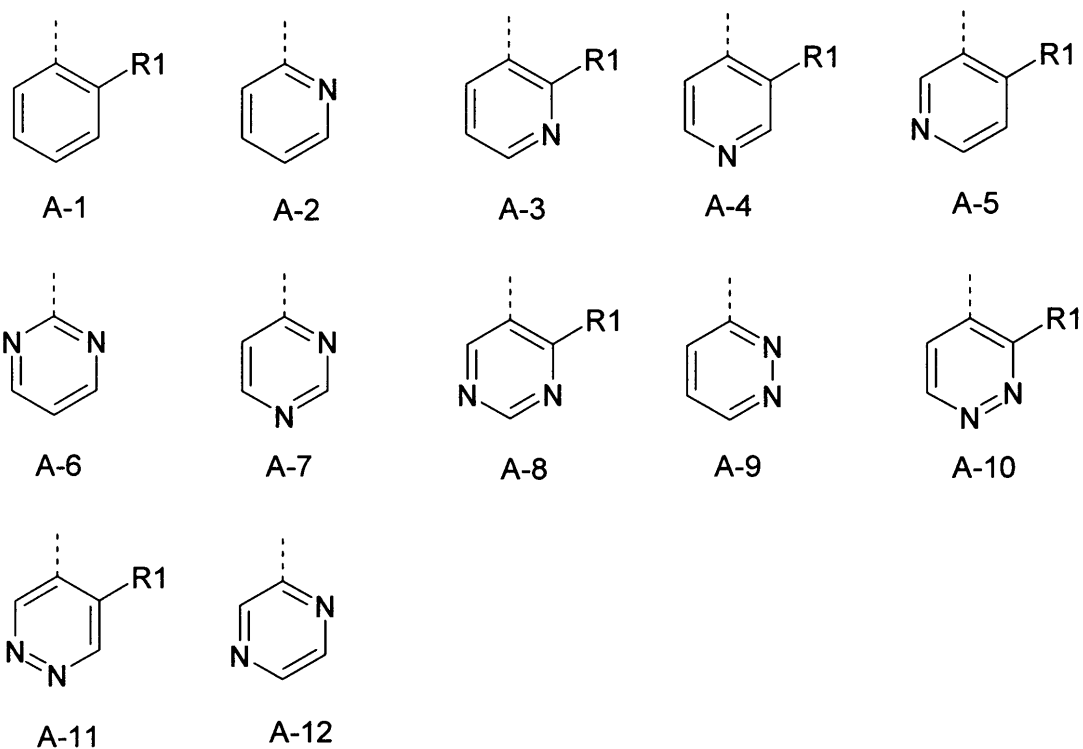
A が、次の群

10

20

30

【化 19】



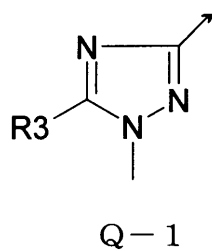
10

20

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はQとの結合を指し、Aはさらにm個のR₂置換基を保有し、Qが、次の群

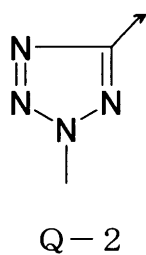
【化 20】



30

および

【化 21】

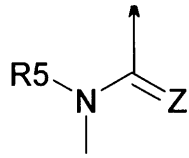


40

のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環Aと結合し、それぞれの場合における矢印はDとの結合を指し、Dが、次の式

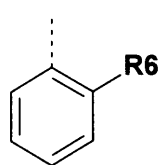
【化 2 2】



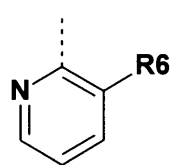
のラジカルであり、

式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、
B が、次の群

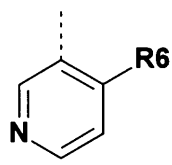
【化 2 3】



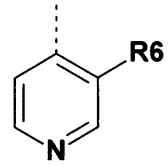
B-1



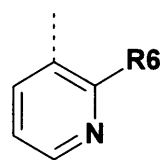
B-2



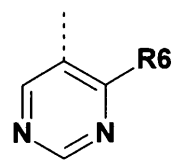
B-3



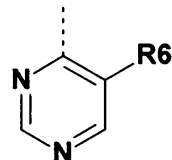
B-4



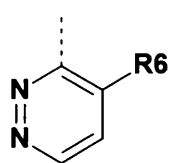
B-5



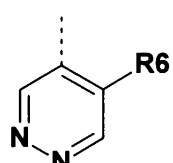
B-6



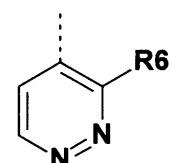
B-7



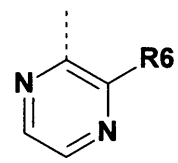
B-8



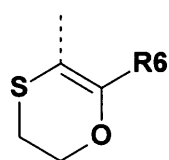
B-9



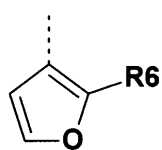
B-10



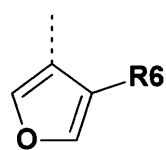
B-11



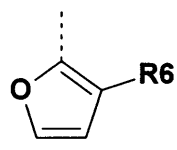
B-13



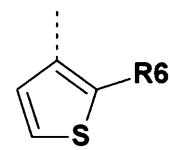
B-18



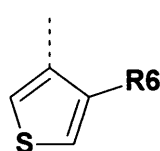
B-19



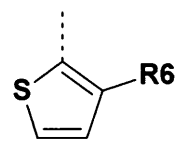
B-20



B-21



B-22



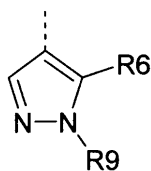
B-23

10

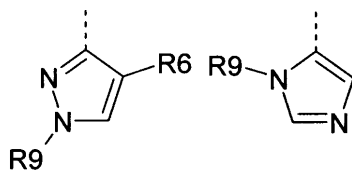
20

30

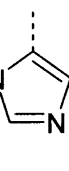
40



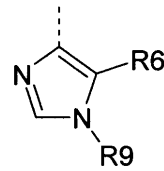
B-31



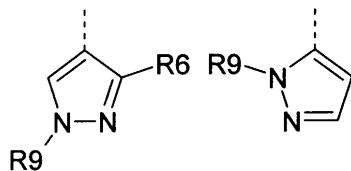
B-32



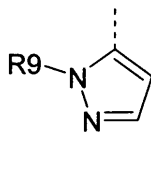
B-33



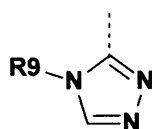
B-34



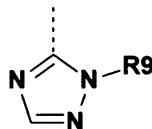
B-35



B-36



B-52



B-53

10

20

30

40

50

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、

Zが、酸素または硫黄であり、

R1が、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄ハロアルコキシおよびC₁-C₄アルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R2が、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、C₁-C₄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ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニルおよびC₁-C₆ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R3が、水素、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルであり、

R5が、水素、C₁-C₄アルキル、C₃-C₄アルケニル、C₃-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、シアノ-C₁-C₄アルキルおよびC(=O)-Bの群のうちの一つのラジカルであり、

R6が、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、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アルキルスルホニルおよびヘテロアリーの群のうちの一つのラジカルであり、

R7が、ハロゲン、C₁-C₄アルキルおよびC₁-C₄ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルであり、

R9が、C₁-C₄アルキルであり、

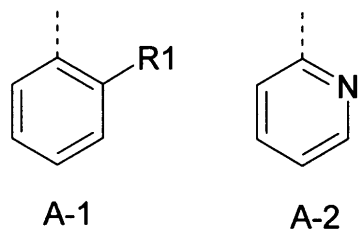
mが、0、1、2、3および4の群のうちの一つの数であり、ここで、m>1の時、R2ラジカルは互いに同一または異なってもよく、ならびに、

nが、0および1の群のうちの一つの数である、

請求項1に記載の化合物。

【請求項 5】

前記式 (I) の化合物において、
 式中、
 A が、次の群
 【化 2 4】

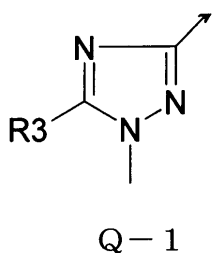


10

のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線は Q との結合を指し、A はさらに m 個の R₂ 置換基を保有し、
 Q が、次の群

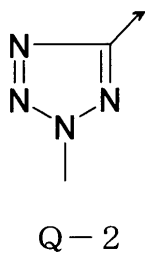
【化 2 5】



20

および

【化 2 6】

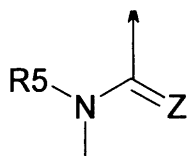


30

のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、
 D が、次の式

【化 2 7】

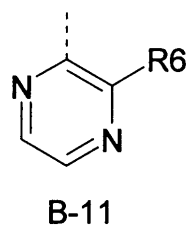
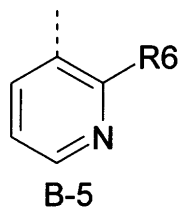
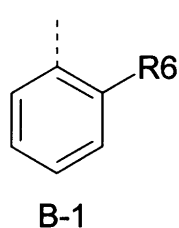


40

のラジカルであり、

式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、
 B が、次の群

【化 2 8】



のうちの一つのラジカルであり、

10

式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、Zが、酸素であり、

R1が、ハロゲン、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキル、C₁－C₄アルコキシおよびC₁－C₄ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R2が、ハロゲン、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキル、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ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₆アルキルスルホニルおよびC₁－C₆ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R3が、水素であり、

R5が、水素であり、

20

R6が、ハロゲン、ニトロ、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキルおよびC₁－C₄ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R7が、ハロゲンであり、

mが、0、1、2、3および4の群のうちの一つの数であり、ここで、m>1の時、R2ラジカルは互いに同一または異なってもよく、ならびに、

nが、0および1の群のうちの一つの数である、

請求項1、2、3または4に記載の化合物。

【請求項6】

請求項1～5のいずれか一項に記載の式(I)の化合物を少なくとも1つ含有することを特徴とする、組成物。

30

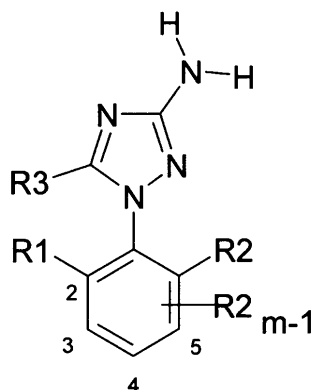
【請求項7】

請求項1～5のいずれか一項に記載の式(I)の一つの化合物または請求項6に記載の組成物が害虫および／またはそれらの生息地に作用することが可能であることを特徴とする、害虫の防除方法。

【請求項8】

式(I I a-1-a)の化合物：

【化 2 9】



10

(IIa-1-a)

〔式中、R1、R2およびR3はそれぞれすでに定義された通りであり、およびmは1、2および3の群のうちの一つの数である〕。

【請求項 9】

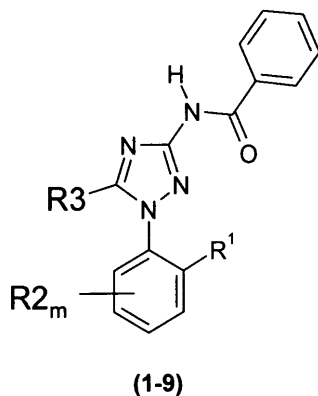
前記式 (IIa-1-a) の化合物において、R3が水素である、請求項 8 に記載の化合物。

20

【請求項 10】

式 (1-9) の化合物：

【化 30】



30

〔式中、R1、R2、R3およびmはそれぞれすでに定義された通りである〕。

【請求項 11】

前記式 (1-9) の化合物において、R3が水素である、請求項 10 に記載の化合物。

40

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

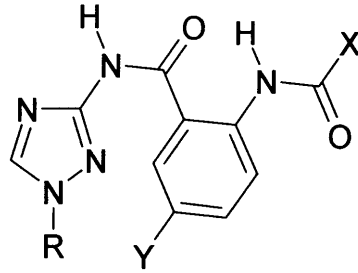
本出願は、新規のヘテロ環化合物、節足動物、昆虫類および線形動物といった動物の害虫を防除するための当該ヘテロ環化合物の使用、ならびに、当新規化合物調製のためのプロセスおよび中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

1-アリール-3-アロイルアミノ-1,2,4-トリアゾールの誘導体がW02012/006473により知られている。

【化 1】



10

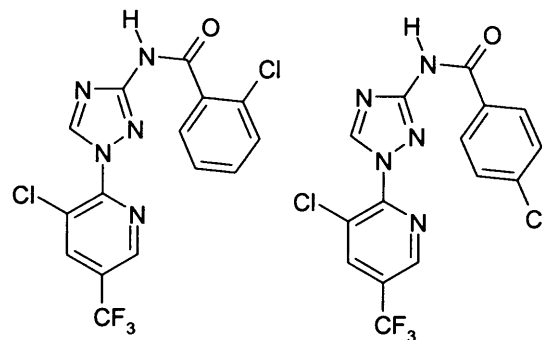
【0003】

ここに開示される化合物は、ホスファターゼ阻害剤としての作用を有する。

【0004】

さらに、いかなる使用の説明もないが、次の化合物が、Scifinderで「Commercial Source」として知られている（2-Cl化合物のCAS番号＝321434-03-1、4-Cl化合物のCAS番号＝303144-57-2）：

【化 2】



20

【0005】

殺虫剤を包含する作物保護剤は、たとえば、効能、残留性、ならびに作用および可能な使用の範囲に関連した、満たすべき要求が多い。毒性の問題および他の有効成分または製剤補助剤との組合せが可能かどうかの問題や、有効成分の合成がもたらす費用の問題も存在する。さらに、耐性が生じ得る。これらの理由により、新規の作物保護組成物の研究は完全と見なされるはずがなく、公知の化合物と比較して、少なくともそれぞれの側面に関して改善された特性を有する新規化合物が絶えず必要とされている。

30

【発明の概要】

【0006】

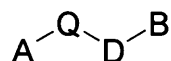
様々な点において殺虫剤の範囲を広げる化合物を提供することが本発明の目的の1つであった。

【0007】

この目的、および、明確に記述はされないものの本明細書の考察に関連して認識または引き出され得るさらなる目的は、式（I）の化合物によって達成される。

40

【化 3】

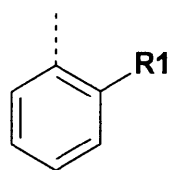


(I)

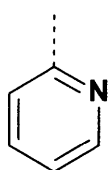
【0008】

50

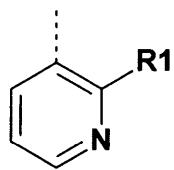
式中、
A は、
【化 4】



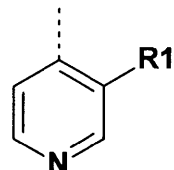
A-1



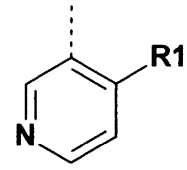
A-2



A-3

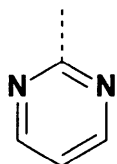


A-4

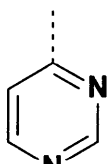


A-5

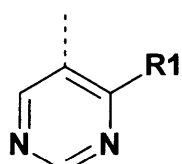
10



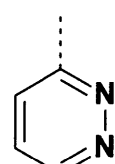
A-6



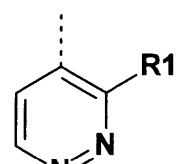
A-7



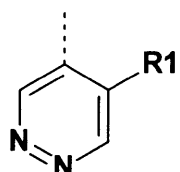
A-8



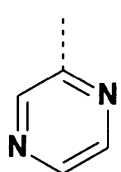
A-9



A-10



A-11



A-12

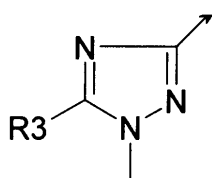
20

の群のうちの一つのラジカルであり、

ここで、破線はQとの結合を指し、Aはさらにm個のR²置換基を保有し、
Qは、

【化 5】

30

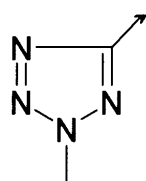


Q-1

、

【化 6】

40

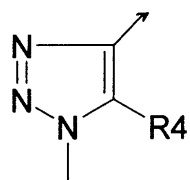


Q-2

および

50

【化 7】



Q-3

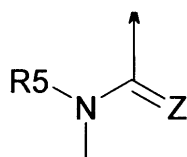
10

の群のうちの一つのラジカルであり、

ここで、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、および、

D は、次の式：

【化 8】



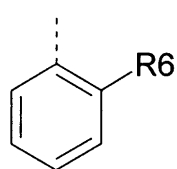
20

のラジカルであり、

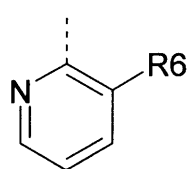
ここで、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指し、

B は、

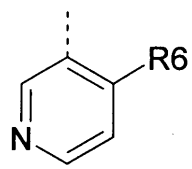
【化 9】



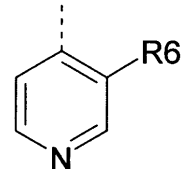
B-1



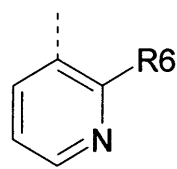
B-2



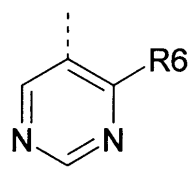
B-3



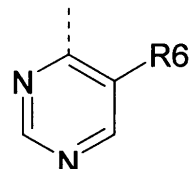
B-4



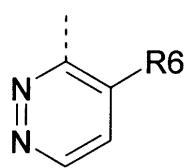
B-5



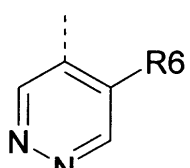
B-6



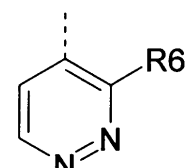
B-7



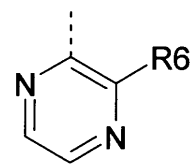
B-8



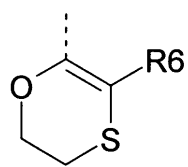
B-9



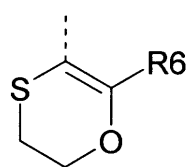
B-10



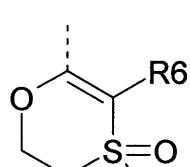
B-11



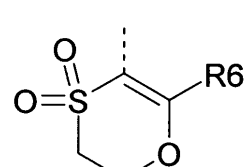
B-12



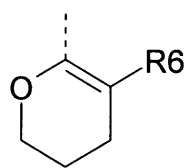
B-13



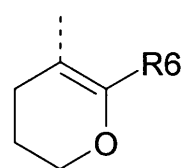
B-14



B-15



B-16

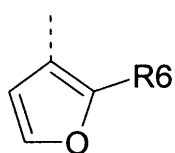


B-17

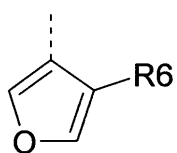
10

20

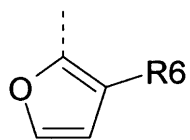
30



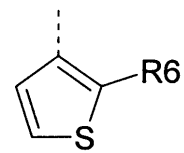
B-18



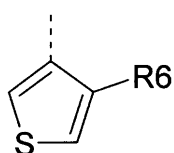
B-19



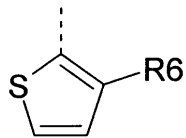
B-20



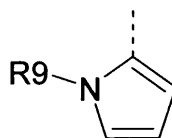
B-21



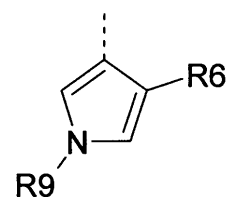
B-22



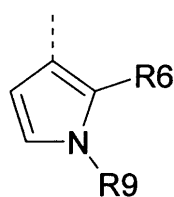
B-23



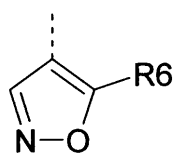
B-24



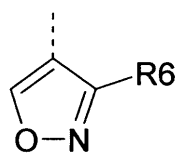
B-25



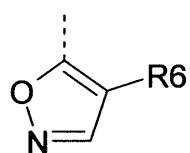
B-26



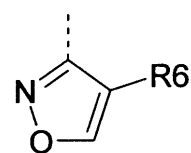
B-27



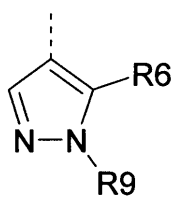
B-28



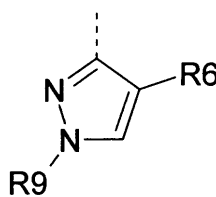
B-29



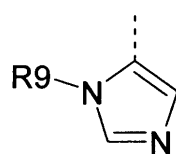
B-30



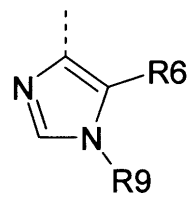
B-31



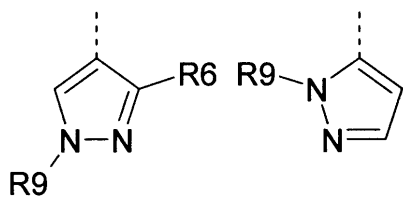
B-32



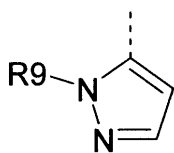
B-33



B-34



B-35



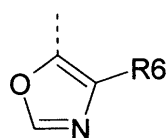
B-36

10

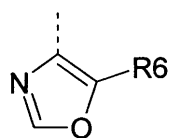
20

30

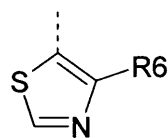
40



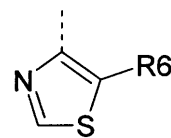
B-37



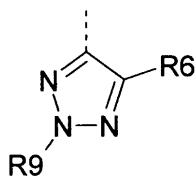
B-38



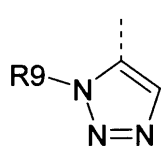
B-39



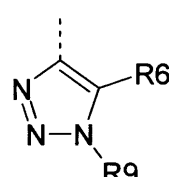
B-40



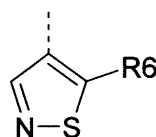
B-41



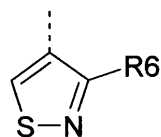
B-42



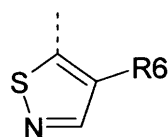
B-43



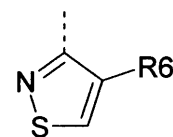
B-44



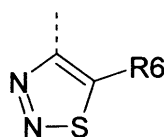
B-45



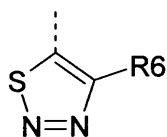
B-46



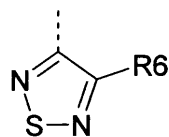
B-47



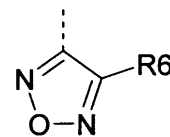
B-48



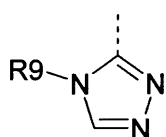
B-49



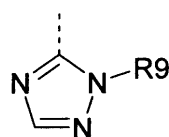
B-50



B-51



B-52



B-53

10

20

30

40

50

の群のうちの一つのラジカルであり、

ここで、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、Zは酸素または硫黄であり、

R1は、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよいC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルキニルカルボニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆アルキルアミノ、C₃-C₆アルケニルアミノ、C₃-C₆アルキニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ、C₂-C₆アルケニルカルボニルアミノ、C₂-C₆アルキニルカルボニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノ、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₆アルキルチオ、C₃-C₆アルケニルチオ、C₃-C₆アルキニルチオ、C₃-C₆シクロアルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ-（C₁-

C₆ アルキル) アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノスルホニル、C₁ - C₆ アルキルチオカルボニルアミノ、C₄ - C₁₂ ビシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、アリールアミノ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアミノおよびヘテロアリールチオの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシおよびヘテロアリールチオからそれぞれ独立して選択され、

R₂ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₂ - C₆ アルキニル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ アルケノキシ、C₃ - C₆ アルキノキシ、C₃ - C₆ シクロアルコキシ、C₁ - C₆ アルキルカルボニルオキシ、C₂ - C₆ アルケニルカルボニルオキシ、C₂ - C₆ アルキニルカルボニルオキシ、C₃ - C₆ シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ アルコキシカルボニルオキシ、C₁ - C₆ アルキルスルホニルオキシ、C₁ - C₆ アルキルアミノ、C₃ - C₆ アルケニルアミノ、C₃ - C₆ アルキニルアミノ、C₃ - C₆ シクロアルキルアミノ、C₁ - C₆ アルキルカルボニルアミノ、C₂ - C₆ アルケニルカルボニルアミノ、C₂ - C₆ アルキニルカルボニルアミノ、C₃ - C₆ シクロアルキルカルボニルアミノ、C₁ - C₆ アルコキシカルボニルアミノ、C₁ - C₆ アルキルスルホニルアミノ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₃ - C₆ アルケニルチオ、C₃ - C₆ アルキニルチオ、C₃ - C₆ シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、C₁ - C₆ アルコキシイミノ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆ アルキル) - アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁ - C₆ アルキルアミノスルホニル、C₁ - C₆ アルキルチオカルボニルアミノ、C₄ - C₁₂ ビシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、アリールアミノ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアミノおよびヘテロアリールチオの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシおよび C₁ - C₆ アルキルチオ、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシおよびヘテロアリールチオからそれぞれ独立して選択され、

R₃ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルキルチオ、C₁ - C₆ アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルキルチオ、C₁ - C₆ ハロアルキルスルフィニルおよび C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R₄ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルキルおよび C₁ - C₆ ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R₅ は、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ アルキニル、C₃ - C₆ シクロアルキル - C₁ - C₆ アルキル、シアノ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルキルカルボニル、C₂ - C₆ アルケニルカルボニル、C₁ - C₆ ハロアルキルカルボニル、C₂ - C₆ ハロアルケニルカルボニル、C₁ - C₆ アルコキシ - C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ アルキルスルホニル、C₁ - C₆ ハロアルキルスルホニルおよび C (=O) - B の群のうちの一つのラジカルであり、

R₆ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、各場合で単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよい C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケ

10

20

30

40

50

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 アルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルコキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロ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 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジー (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、 C_4-C_{12} ビシクロアルキル、アリーール、アリーールオキシ、ヘテロアリーールおよびヘテロアリーールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシおよび C_1-C_6 アルキルチオからそれぞれ独立して選択され、

R 7 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、各場合で単数または複数で互いに同一または異なって置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 アルケノキシ、 C_3-C_6 アルキノキシ、 C_3-C_6 シクロアルコキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロ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 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジー (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、 C_4-C_{12} ビシクロアルキル、アリーール、アリーールオキシ、ヘテロアリーールおよびヘテロアリーールオキシの群のうちの一つのラジカルであり、ここで、置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシおよび C_1-C_6 アルキルチオからそれぞれ独立して選択され、

R 9 は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル、ハロアルキル、 C_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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の群のうちのラジカルであり、

m は、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $m > 1$ の時、R 2 ラジカルは互いに同一または異なっているとしてもよく、ならびに、

n は、0、1、2 および 3 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $n > 1$ の時、R 7 ラジカルは、たがいに同一または異なっているとしてもよく、

ただし、次の式：

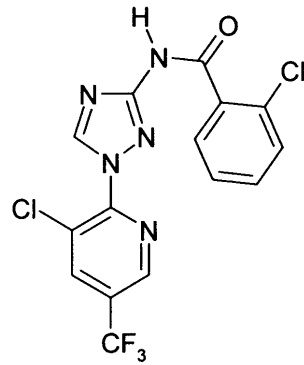
10

20

30

40

【化 1 0】



10

の化合物を除く。

【0009】

式（I）の化合物は、突出した生物学的な特性を有し、動物の害虫、具体的には、農業、森林、保管製品および材料の保護、動物の保健ならびに衛生セクターで遭遇する昆虫類、蛛形類および線形動物の防除にとりわけ適していることがわかった。

【発明の具体的説明】

【0010】

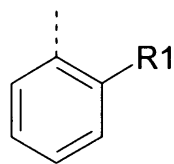
式（I）の化合物に示すラジカルに関して好ましい置換基または範囲を以下に示す。これらの組合せは、好ましいエリア（1）を形成する。

20

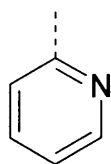
【0011】

Aは、

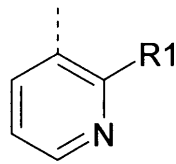
【化 1 1】



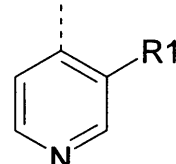
A-1



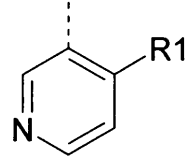
A-2



A-3

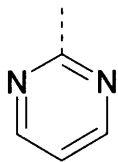


A-4

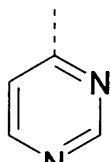


A-5

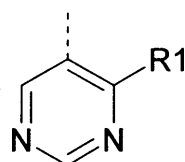
30



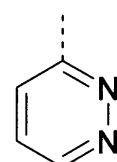
A-6



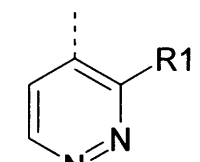
A-7



A-8

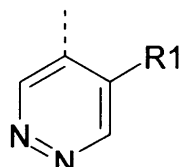


A-9

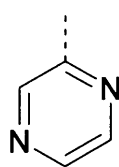


A-10

40



A-11



A-12

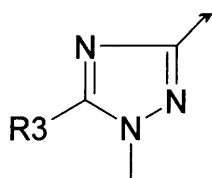
の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はQとの結合を指し、Aはさらにm個のR₂置換基を保有する。

【0012】

50

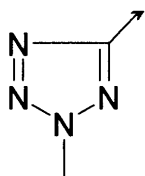
Q は、
【化 1 2】



Q-1

10

および
【化 1 3】



Q-2

20

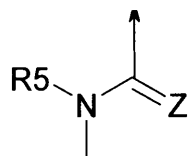
の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指す。

【0 0 1 3】

D は、次の式：

【化 1 4】



30

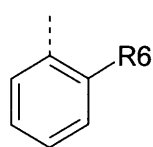
のラジカルであり、

式中、窒素は Q と結合し、矢印は B との結合を指す。

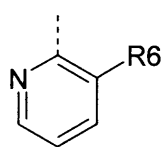
【0 0 1 4】

B は、

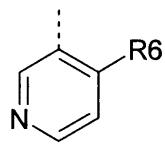
【化 1 5】



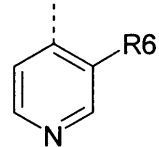
B-1



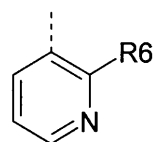
B-2



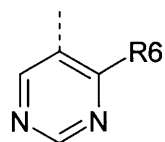
B-3



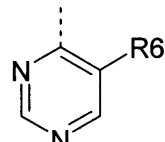
B-4



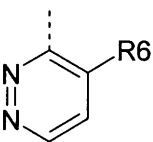
B-5



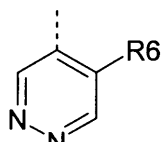
B-6



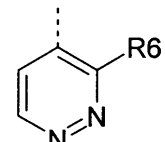
B-7



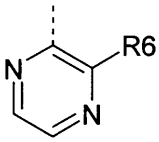
B-8



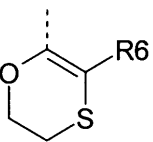
B-9



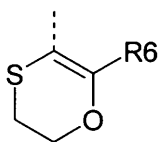
B-10



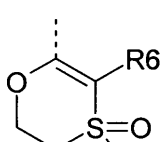
B-11



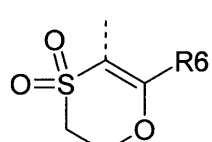
B-12



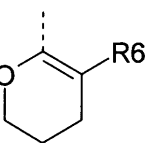
B-13



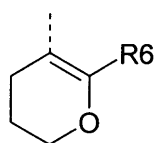
B-14



B-15



B-16

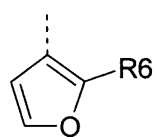


B-17

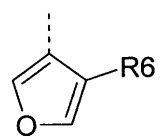
10

20

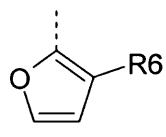
30



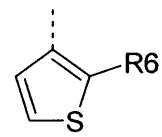
B-18



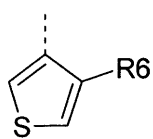
B-19



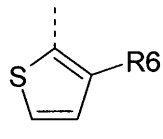
B-20



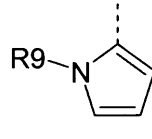
B-21



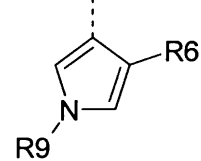
B-22



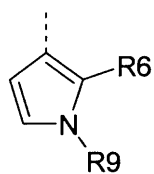
B-23



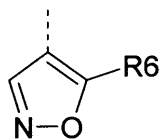
B-24



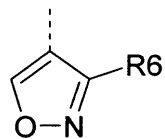
B-25



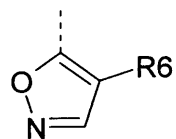
B-26



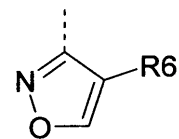
B-27



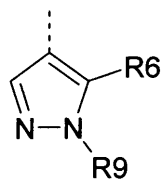
B-28



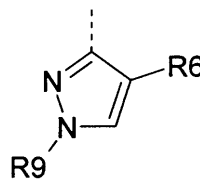
B-29



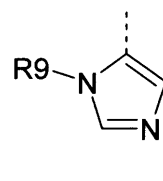
B-30



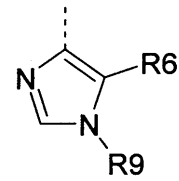
B-31



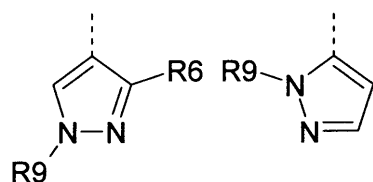
B-32



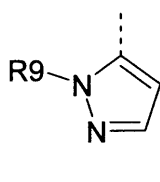
B-33



B-34



B-35



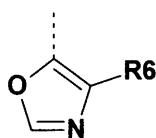
B-36

10

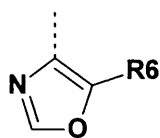
20

30

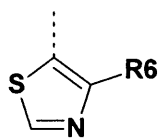
40



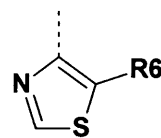
B-37



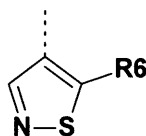
B-38



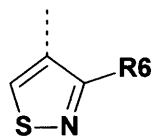
B-39



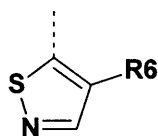
B-40



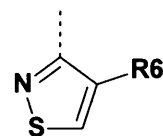
B-44



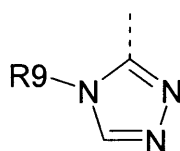
B-45



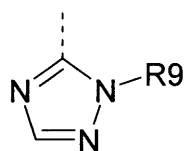
B-46



B-47



B-52



B-53

10

20

の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはさらにn個のR7置換基を保有する。

【0015】

Zは、酸素または硫黄である。

【0016】

R1は、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆アルキニルカルボニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆アルキルアミノ、C₃-C₆アルケニルアミノ、C₃-C₆アルキニルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆ハロアルキルチオ、C₃-C₆アルケニルチオ、C₃-C₆アルキニルチオ、C₃-C₆シクロアルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ-（C₁-C₆アルキル）-アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₆アルキルアミノスルホニル、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

【0017】

R2は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アル

30

40

50

キル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルアミノ、 C_3-C_6 アルケニルアミノ、 C_3-C_6 アルキニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 アルケニルチオ、 C_3-C_6 アルキニルチオ、 C_3-C_6 シクロアルキルチオ、 C_3-C_6 ハロシクロアルキルチオ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

10

【0018】

R 3は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルコキシ、 C_1-C_6 ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 ハロアルキルスルフィニルおよび C_1-C_6 ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルである。

20

【0019】

R 5は、水素、 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_2-C_6 アルケニル、 C_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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およびC (=O) -Bの群のうちの一つのラジカルである。

30

【0020】

R 6は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 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 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_3-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルアミノ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

40

【0021】

50

R 7 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 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 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルケニルカルボニルオキシ、 C_2-C_6 アルキニルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルコキシカルボニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、 C_3-C_6 アルケニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 アルキニルカルボニルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルカルボニルアミノ、 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、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6 アルキル) -アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルカルボニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

10

【0022】

R 9 は、水素、 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_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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の群のうちの一つのラジカルである。

20

【0023】

m は、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $m > 1$ の時、R 2 ラジカルは互いに同一または異なってもよい。

【0024】

n は、0、1、2 および 3 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $n > 1$ の時、R 7 ラジカルは互いに同一または異なってもよい。

30

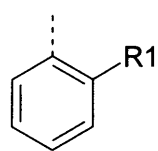
【0025】

式 (I) の化合物に示すラジカルに関して特に好ましい置換基または範囲を以下に示す。これらの組合せは、好ましいエリア (2) を形成する。

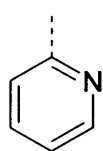
【0026】

A は、

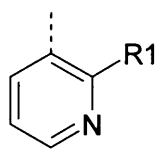
【化 1 6】



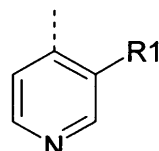
A-1



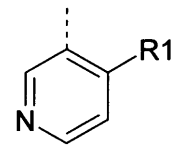
A-2



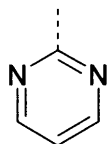
A-3



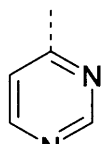
A-4



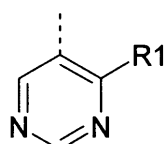
A-5



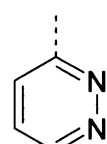
A-6



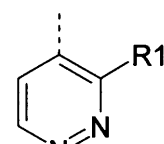
A-7



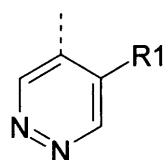
A-8



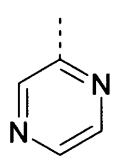
A-9



A-10



A-11



A-12

10

20

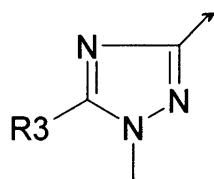
の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はQとの結合を指し、Aはさらにm個のR₂置換基を保有する。

【0027】

Qは、

【化 1 7】

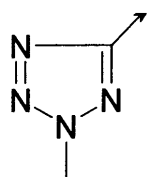


Q-1

30

および

【化 1 8】



Q-2

40

の群のうちの一つのラジカルであり、

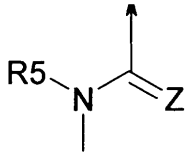
式中、窒素が環Aと結合し、それぞれの場合における矢印はDとの結合を指す。

【0028】

Dは、次の式：

50

【化 1 9】



のラジカルであり、

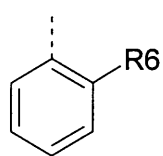
式中、窒素はQと結合し、矢印はBとの結合を指す。

10

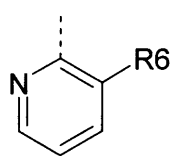
【0029】

Bは、

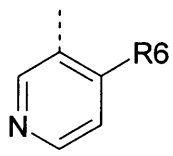
【化 20】



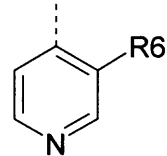
B-1



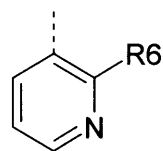
B-2



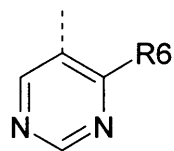
B-3



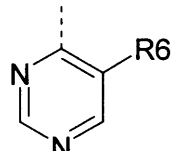
B-4



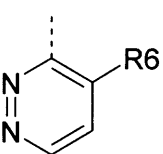
B-5



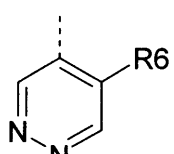
B-6



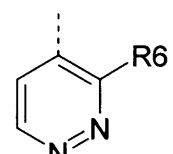
B-7



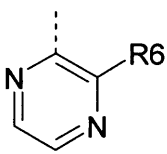
B-8



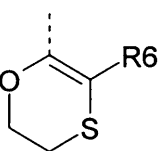
B-9



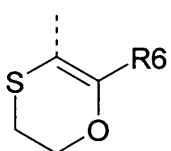
B-10



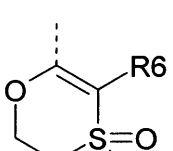
B-11



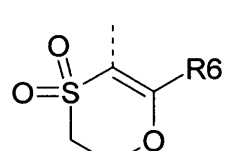
B-12



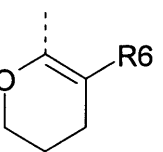
B-13



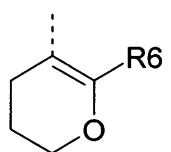
B-14



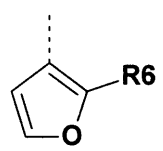
B-15



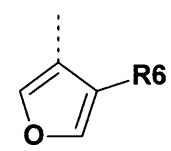
B-16



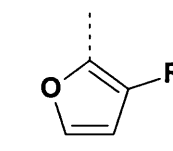
B-17



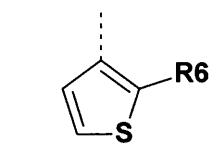
B-18



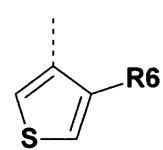
B-19



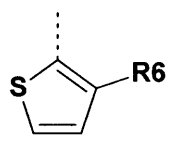
B-20



B-21



B-22



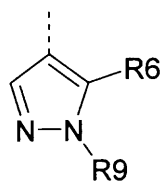
B-23

10

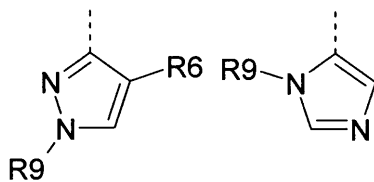
20

30

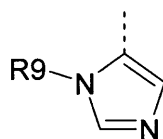
40



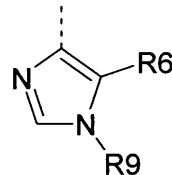
B-31



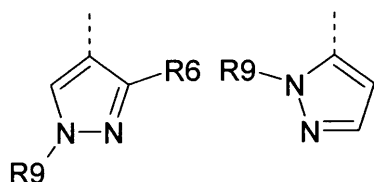
B-32



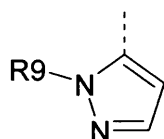
B-33



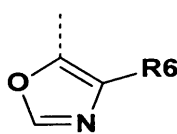
B-34



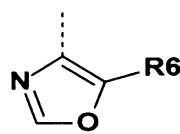
B-35



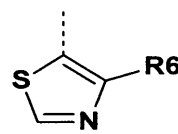
B-36



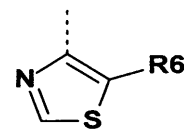
B-37



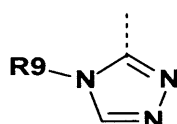
B-38



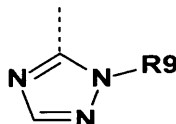
B-39



B-40



B-52



B-53

10

20

30

40

50

の群のうちの一つのラジカルであり、
 式中、破線はDとの結合を指し、Bはさらにn個のR7置換基を保有する。

【0030】

Zは、酸素または硫黄である。

【0031】

R1は、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆ハロアルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₃-C₆シクロアルキルオキシ、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アルキルスルホニル、C₁-C₆アルコキシイミノ-C₁-C₆アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

【0032】

R2は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、シアノ-C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル-C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコ

キシ、 C_1-C_6 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 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、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

【0033】

R 3 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、 C_1-C_6 アルキルおよび C_1-C_6 ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルである。

【0034】

R 5 は、水素、 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_2-C_6 アルケニル、 C_3-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、シアノ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルケニルカルボニル、 C_1-C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_6 ハロアルケニルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシ- C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、 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および $C(=O)-B$ の群のうちの一つのラジカルである。

【0035】

R 6 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 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 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 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 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

【0036】

R 7 は、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、シアノ- 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_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 ハロアルコキシ、 C_3-C_6 アルケニルオキシ、 C_3-C_6 アルキニルオキシ、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ、 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 アルキルスルホニル、 C_1-C_6 アルコキシイミノ- C_1-C_6 アルキル、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシの群のうちの一つのラジカルである。

【0037】

R 9 は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_3-C_6 シクロアルキルおよび C_1-C_6 ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルである。

【0038】

m は、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $m > 1$ の時、R 2 ラジカルは互いに同一または異なってもよい。

【0039】

n は、0、1 および 2 の群のうちの一つの数であり、ここで、 $n > 1$ の時、R 7 ラジカルは互いに同一または異なってもよい。

【0040】

式 (I) の化合物に示すラジカルに関してさらに特に好ましい置換基または範囲を以下に説明する。これらの組合せは、好ましいエリア (3) を形成する。

【0041】

A は、

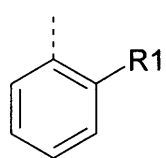
10

20

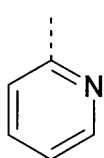
30

40

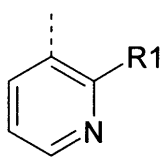
【化 2 1】



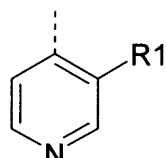
A-1



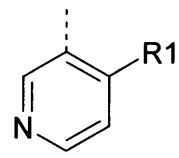
A-2



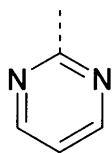
A-3



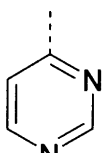
A-4



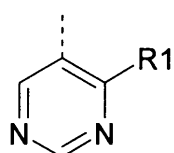
A-5



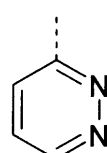
A-6



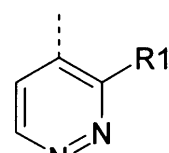
A-7



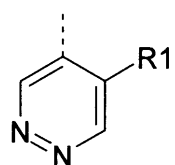
A-8



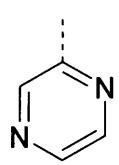
A-9



A-10



A-11



A-12

10

20

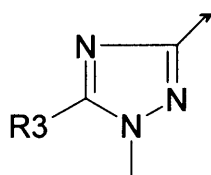
の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はQとの結合を指し、Aはさらにm個のR₂置換基を保有する。

【0042】

Qは、

【化 2 2】

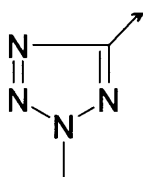


Q-1

30

および

【化 2 3】



Q-2

40

の群のうちの一つのラジカルであり、

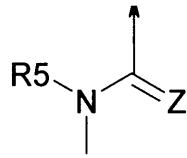
式中、窒素が環Aと結合し、それぞれの場合における矢印はDとの結合を指す。

【0043】

Dは、次の式：

50

【化 2 4】



のラジカルであり、

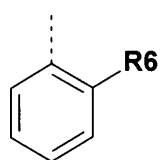
式中、窒素はQと結合し、矢印はBとの結合を指す。

【0 0 4 4】

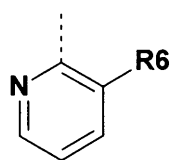
10

Bは、

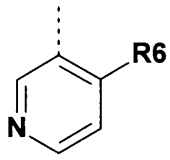
【化 2 5】



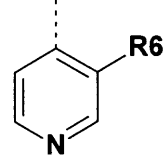
B-1



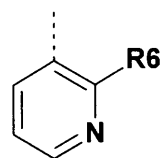
B-2



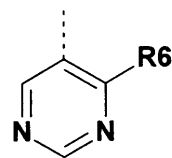
B-3



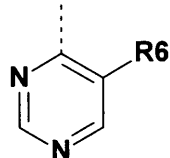
B-4



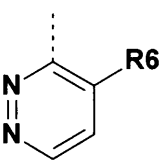
B-5



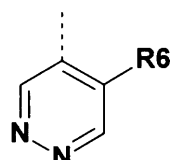
B-6



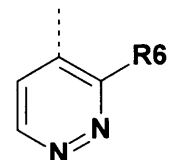
B-7



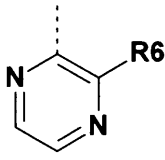
B-8



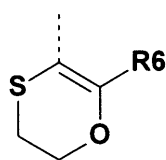
B-9



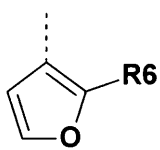
B-10



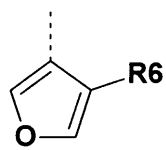
B-11



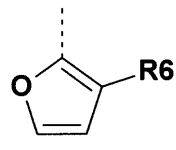
B-13



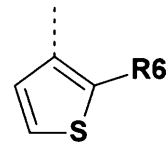
B-18



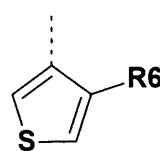
B-19



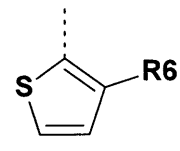
B-20



B-21



B-22



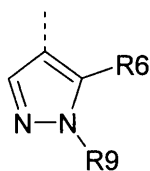
B-23

10

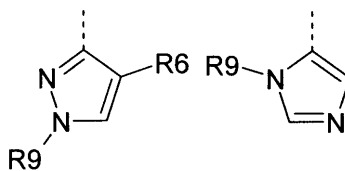
20

30

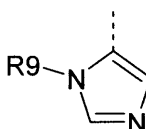
40



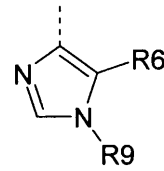
B-31



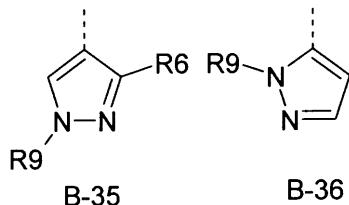
B-32



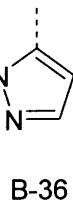
B-33



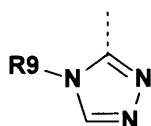
B-34



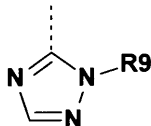
B-35



B-36



B-52



B-53

10

20

の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、破線はDとの結合を指し、Bはさらにn個のR7置換基を保有する。

【0045】

Zは、酸素または硫黄である。

【0046】

R1は、水素（ただし、A-1とQ-2の組合せの場合のみ）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄ハロアルコキシおよびC₁-C₄アルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルである。

30

【0047】

R2は、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、C₁-C₄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ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニルおよびC₁-C₆ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルである。

【0048】

R3は、水素、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルである。

40

【0049】

R5は、水素、C₁-C₄アルキル、C₃-C₄アルケニル、C₃-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、シアノ-C₁-C₄アルキルおよびC(=O)-Bの群のうちの一つのラジカルである。

【0050】

R6は、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、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アルキルスルホニルおよびヘテロアリーの群のうちの一つのラジカルである。

【0051】

50

R 7 は、ハロゲン、C₁ - C₄ アルキルおよび C₁ - C₄ ハロアルキルの群のうちの一つのラジカルである。

【0052】

R 9 は、C₁ - C₄ アルキルである。

【0053】

m は、0、1、2、3 および 4 の群のうちの一つの数であり、ここで、m > 1 の時、R₂ ラジカルは互いに同一または異なってもよい。

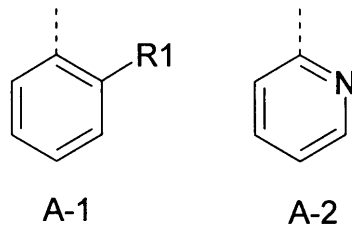
【0054】

n は、0 および 1 の群のうちの一つの数である。

【0055】

式 (I) の好ましい化合物のさらなる群は、
A が

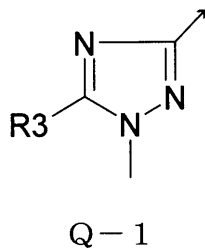
【化 26】



の群のうちの一つのラジカルであり、

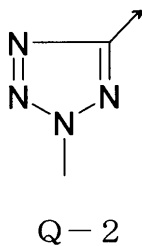
式中、破線は Q との結合を指し、A はさらに m 個の R₂ 置換基を保有し、
Q が、

【化 27】



および

【化 28】



の群のうちの一つのラジカルであり、

式中、窒素が環 A と結合し、それぞれの場合における矢印は D との結合を指し、
D が、次の式

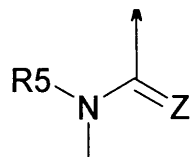
10

20

30

40

【化 2 9】



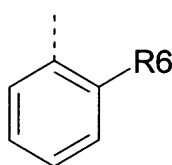
のラジカルであり、

式中、窒素はQと結合し、矢印はBとの結合を指し、

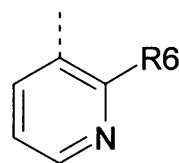
Bが、

10

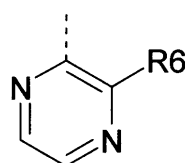
【化 3 0】



B-1



B-5



B-11

の群のうちの一つのラジカルであり、式中、破線はDとの結合を指し、Bはn個のR7置換基をさらに保有し、

20

Zが、酸素であり、

R1が、ハロゲン、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキル、C₁－C₄アルコキシおよびC₁－C₄ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R2が、ハロゲン、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキル、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ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₆アルキルスルホニルおよびC₁－C₆ハロアルキルスルホニルの群のうちの一つのラジカルであり、

R3が、水素であり、

R5が、水素であり、

30

R6が、ハロゲン、ニトロ、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキルおよびC₁－C₄ハロアルコキシの群のうちの一つのラジカルであり、

R7が、ハロゲンであり、

mが、0、1、2、3および4の群のうちの一つの数であり、ここで、m>1の時、R2ラジカルは互いに同一または異なってもよく、ならびに

nが、0および1の群のうちの一つの数である、

化合物の群である。

【0056】

別で明記されない限り、好ましい定義では、

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

40

アリール（より大きいユニットの一部として、たとえば、アリールアルキルを包含する）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、

ヘタリール（ヘテロアリールと同義語であり、より大きいユニットの一部として、たとえば、ヘテロアリールオキシを包含する）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

50

アゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニルおよびピラジニルの群から選択される。

【0057】

別で明記されない限り、特に好ましい定義では、

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

アリール（より大きいユニットの一部として、たとえば、アリールアルキルを包含する）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、

ヘタリール（ヘテロアリール）（より大きいユニットの一部として、たとえば、ヘテロアリールオキシを包含する）、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサジアゾリル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリルおよびチアゾリルの群から選択される。

【0058】

別で明記されない限り、さらに特に好ましい定義では、

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

ヘタリール（ヘテロアリール）（より大きいユニットの一部として、たとえば、ヘテロアリールオキシを包含する）は、1, 2, 4-トリアゾリルである。

【0059】

ハロゲン-置換ラジカル、たとえばハロアルキルは、モノハロゲン化、または、可能な最大数以下の置換基でポリハロゲン化している。ポリハロゲン化の場合は、ハロゲン原子は、互いに同一であっても異なってもよい。ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素、とりわけ、フッ素、塩素および臭素である。

【0060】

mおよびnの可能な最大値は、AおよびBラジカルの結合部位の数に当然依存する。

【0061】

アルキルまたはアルケニルといった飽和または不飽和炭化水素ラジカルは、それぞれ直鎖または可能であれば分岐鎖であり得、たとえばアルコキシにおけるといった、ヘテロ原子との組合せも包含する。

【0062】

別で明記しない限り、置換されてもよいラジカルは、一または多置換されていてもよく、多置換の場合の置換基は、互いに同一であっても異なってもよい。

【0063】

一般的な用語または好ましいエリアの範疇で示されるラジカルの定義または説明は、上記および後述の最終産物、出発材料および中間体に対応して適用される。ラジカルのこれらの定義は、所望の通りに互いに組合せられ得、すなわち、それぞれの好ましい範囲間での組合せを包含する。

【0064】

本発明に従うと、上で好ましいとして列挙した定義の組合せが存在する式(I)の化合物（好ましいエリア(1)）が好ましい。

【0065】

本発明に従うと、上で特に好ましいとして列挙した定義の組合せが存在する式(I)の化合物（好ましいエリア(2)）が特に好ましい。

【0066】

本発明に従うと、上でさらに特に好ましいとして列挙した定義の組合せが存在する式(I)の化合物（好ましいエリア(3)）がさらに特に好ましい。

【0067】

以下の化合物の群では、R1～R7およびZのラジカルは、それぞれすでに定義した通りである。

10

20

30

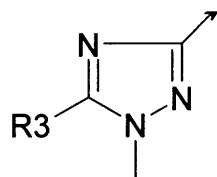
40

50

【0068】

式（I）の本発明の化合物の具体的な群では、QはQ－1であり、

【化31】

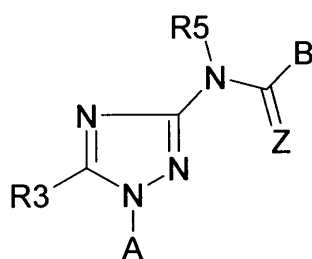


Q－1

10

これにより、Dの定義を考慮して、式（I－1）：

【化32】



(I-1)

20

の化合物が得られる。

【0069】

好ましいエリア（1）によって定義され、QがQ－1である化合物が、さらに好ましい。

【0070】

30

好ましいエリア（2）によって定義され、QがQ－1である化合物が、さらに好ましい。

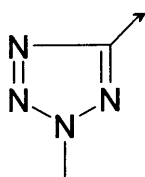
【0071】

好ましいエリア（3）によって定義され、QがQ－1である化合物が、さらに好ましい。

【0072】

式（I）の本発明の化合物のさらに具体的な群では、QはQ－2であり、

【化33】

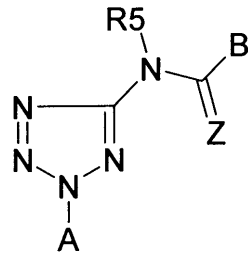


Q－2

40

これにより、Dの定義を考慮して、式（I－2）：

【化 3 4】



(I-2)

10

の化合物が得られる。

【0073】

好ましいエリア（１）によって定義され、QがQ－２である化合物が、さらに好ましい。

【0074】

好ましいエリア（２）によって定義され、QがQ－２である化合物が、さらに好ましい。

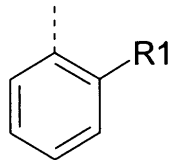
【0075】

好ましいエリア（３）によって定義され、QがQ－２である化合物が、さらに好ましい。

20

式（I）の本発明の化合物のさらに具体的な群では、AはA－１であり、

【化 3 5】



30

式中、このラジカルはm個のR 2 置換基を保有する。

【0076】

好ましいエリア（１）によって定義され、AがA－１である化合物が、さらに好ましい。

【0077】

好ましいエリア（２）によって定義され、AがA－１である化合物が、さらに好ましい。

【0078】

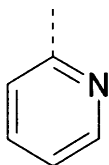
好ましいエリア（３）によって定義され、AがA－１である化合物が、さらに好ましい。

40

【0079】

式（I）の本発明の化合物のさらに具体的な群では、AはA－２であり、

【化 3 6】



式中、このラジカルはm個のR 2 置換基を保有する。

50

【0080】

好ましいエリア（１）によって定義され、AがA－２である化合物が、さらに好ましい。

【0081】

好ましいエリア（２）によって定義され、AがA－２である化合物が、さらに好ましい。

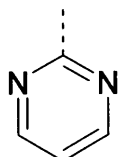
【0082】

好ましいエリア（３）によって定義され、AがA－２である化合物が、さらに好ましい。

【0083】

10

式（Ｉ）の本発明の化合物のさらに具体的な群では、AはA－６であり、
【化３７】



式中、このラジカルはm個のR₂置換基を保有する。

【0084】

20

好ましいエリア（１）によって定義され、AがA－６である化合物が、さらに好ましい。

【0085】

好ましいエリア（２）によって定義され、AがA－６である化合物が、さらに好ましい。

【0086】

好ましいエリア（３）によって定義され、AがA－６である化合物が、さらに好ましい。

【0087】

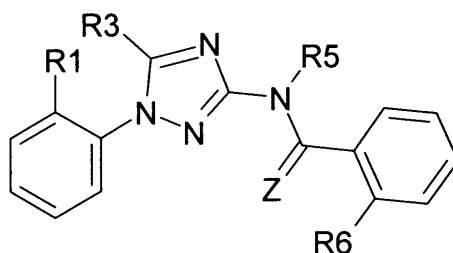
以下に示す式（Ｉ）の化合物の具体的な群（G－１）～（G－８）はそれぞれ好ましい実施態様を構成し、AおよびBのラジカルはそれぞれ、上記の通り、R₂およびR₇置換基をさらに保有し得る。

30

【0088】

式（Ｉ）の化合物の具体的な群G－１は、式（A－１）－（Q－１）－D－（B－１）の化合物である。

【化３８】



40

G－１

【0089】

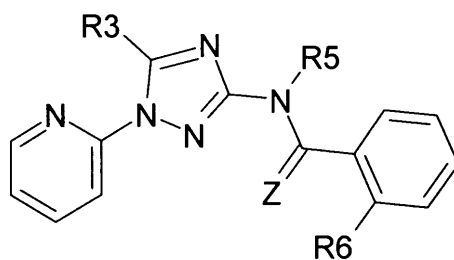
群G－１内では、R₃およびR₅がそれぞれ水素であり、Zが酸素である化合物のものが好ましい。

50

【0090】

式（I）の化合物のさらに具体的な群G-2は、式（A-2）-（Q-1）-D-（B-1）の化合物である。

【化39】



10

G-2

【0091】

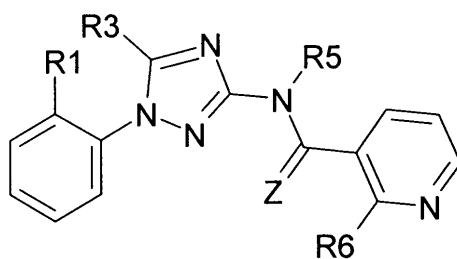
群G-2内では、R3およびR5がそれぞれ水素であり、Zが酸素である化合物のものが好ましい。

【0092】

式（I）の化合物のさらに具体的な群G-3は、式（A-1）-（Q-1）-D-（B-5）の化合物である。

20

【化40】



30

G-3

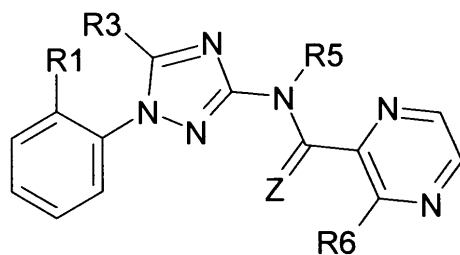
【0093】

群G-3内では、R3およびR5がそれぞれ水素であり、Zが酸素である化合物のものが好ましい。

【0094】

式（I）の化合物のさらに具体的な群G-4は、式（A-1）-（Q-1）-D-（B-11）の化合物である。

【化 4 1】



G-4

10

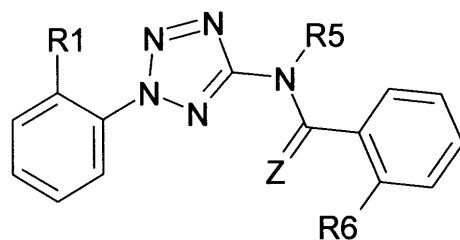
【0095】

群 G-4 内では、R3 および R5 がそれぞれ水素であり、Z が酸素である化合物のものが好ましい。

【0096】

式 (I) の化合物のさらに具体的な群 G-5 は、式 (A-1) - (Q-2) - D - (B-1) の化合物である。

【化 4 2】



G-5

20

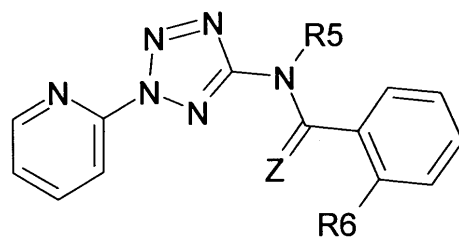
【0097】

群 G-5 内では、R5 が水素であり、Z が酸素である化合物のものが好ましい。

【0098】

式 (I) の化合物のさらに具体的な群 G-6 は、式 (A-2) - (Q-2) - D - (B-1) の化合物である。

【化 4 3】



G-6

40

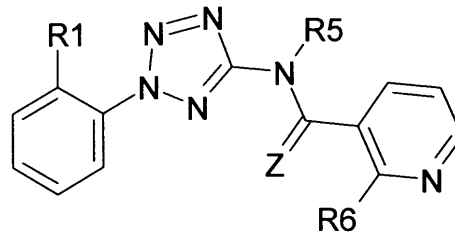
【0099】

群 G-6 内では、R5 が水素であり、Z が酸素である化合物のものが好ましい。

【0100】

式 (I) の化合物のさらに具体的な群 G-7 は、式 (A-1) - (Q-2) - D - (B-5) の化合物である。

【化 4 4】



G-7

10

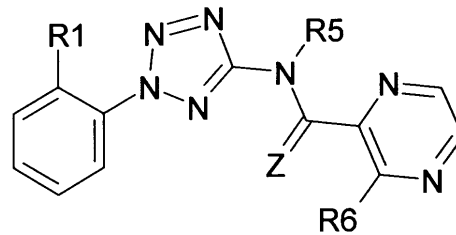
【0101】

群 G-7 内では、R5 が水素であり、Z が酸素である化合物のものが好ましい。

【0102】

式 (I) の化合物のさらに具体的な群 G-8 は、式 (A-1) - (Q-2) - D - (B-11) の化合物である。

【化 4 5】



G-8

20

【0103】

群 G-8 内では、R5 が水素であり、Z が酸素である化合物のものが好ましい。

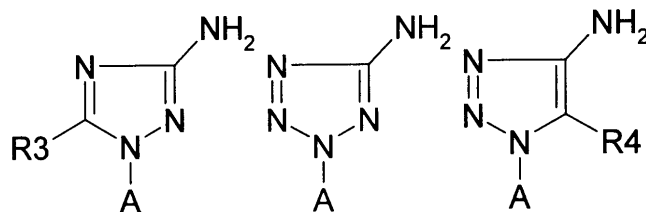
【0104】

式 (I) の化合物は、以下で説明するプロセスによって得られることがさらに分かっている。 30

【0105】

したがって、本発明は、Z が O である式 (I) の化合物を調製するプロセスにも関し、当該化合物は、式 (III-1)、(III-2) および (III-3) :

【化 4 6】



(II-1)

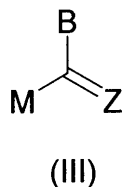
(II-2)

(III-2)

40

のアミンを、式 (III) :

【化 4 7】



の化合物と反応させることで調製され、
式 (I I I) 中、

Mはハロゲン、アルコキシ、アルキルスルファニル、アシルオキシ、スルホニルオキシ、N-ヘテロシクリル（たとえば、イミダゾリル）またはヒドロキシルであり、
Bはすでに定義した通りであり、ならびに、
ZはOである。

10

【0106】

ここで、式 (I I I) の化合物を、すでに活性化させたか、または、インサイツで活性化することが可能である。たとえば、式 (I I I) の化合物を酸ハロゲン化物（たとえば、M=塩素）として使用することが可能である。この場合、反応は、トリエチルアミンまたは水酸化ナトリウムといった塩基の存在下で有利に実行される。代替的に、カルボン酸（M=OH）を、ジシクロヘキシルカルボジイミドといったカップリング試薬、および1-ヒドロキシ-1H-ベンゾトリアゾールといった添加剤の存在下で使用することも可能である（W. Koenig, R. Geiger, Chem. Ber. 1970, 103, 788）。1-エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド、1, 1'-カルボニル-1H-イミダゾール、O-（ベンゾトリアゾール-1-イル）-N, N, N', N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロフォスフェートおよび類似した化合物といったカップリング試薬を使用することもさらに可能である。調製プロセスの実行に適したカップリング試薬は、原則、アミド結合の形成を可能にするすべての化合物である（たとえば、E. Valeur, M. Bradley, Chem. Soc. Rev. 2009, 38, 606; S.-Y. Han, Y.-A. Kim, Tetrahedron 2004, 60, 2447を参照）。さらに、式 (I) の化合物の調製に対称無水物または混成無水物を使用するのも可能である（G. W. Anderson, J. E. Zimmerman, F. M. Calahan, J. Am. Chem. Soc. 1967, 89, 5012）。ここで、たとえば、i s o-ブチルクロロホルメートおよびs e c-ブチルクロロホルメートといった各種クロルギ酸エステルを用いるのも可能である。同様に、たとえば、イソ吉草酸クロリドおよびピバロイルクロリドを用いるのも可能である。

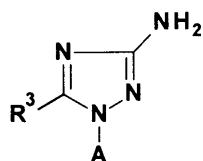
20

30

【0107】

式 (I I - 1) :

【化 4 8】



(II-1)

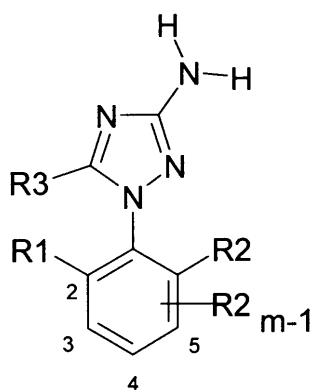
40

のアミンは、市販されており、または、文献により公知であり、または、文献から知られているプロセスで合成され得る。たとえば、WO 2012/006473、US 6083965 (2000)、Anales de Quimica 70,986 (1974)、J. Het. Chem. 8, 137-139 (1971)、US 2010/120874、Gazz. Chimica Italiana 29, 105 (1899)、J. Chem. Soc. Perkin Trans 1, 81-85 (1974)、Arch. Pharm. 322, 583-587 (1989)、Synthesis 45, 1093 (2013)を参照されたい。

【0108】

50

本発明の主題の一部を形成もする本発明の新規化合物は、式 (I I a - 1 - a) :
【化 4 9】



10

(I I a - 1 - a)

の化合物であり、

式中、R 1 および R 2 はそれぞれすでに定義された通りであり、および m は 1、2 および 3 の群のうちの数である。

【0109】

20

式 (I - 1) の化合物は、以下のように、N - (5 - アリール - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) - N' - アリールホルムアミジンの転位によっても調製され得る：

【化 5 0】



30

(I-1)

【0110】

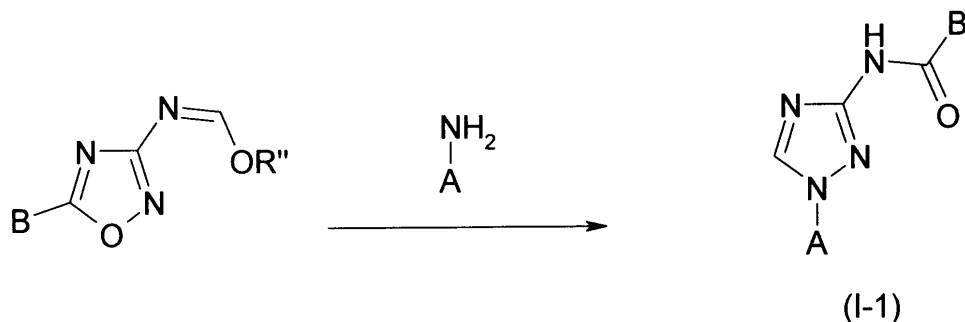
たとえば、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2 1339-1343 (1993)、Tetrahedron 50, 7315-7326 (1994)、J. Het. Chem. 8, 137-139 (1971)、K. H. Baumann US 2010/120874を参照されたい。

【0111】

式 (I - 1) の化合物は、アルキル [5 - アリール - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] イミドホルメートを、適切に置換されたアニリンと反応させることでも得られる (J. Het. Chem. 8, 137-139 (1971)を参照)：

40

【化 5 1】

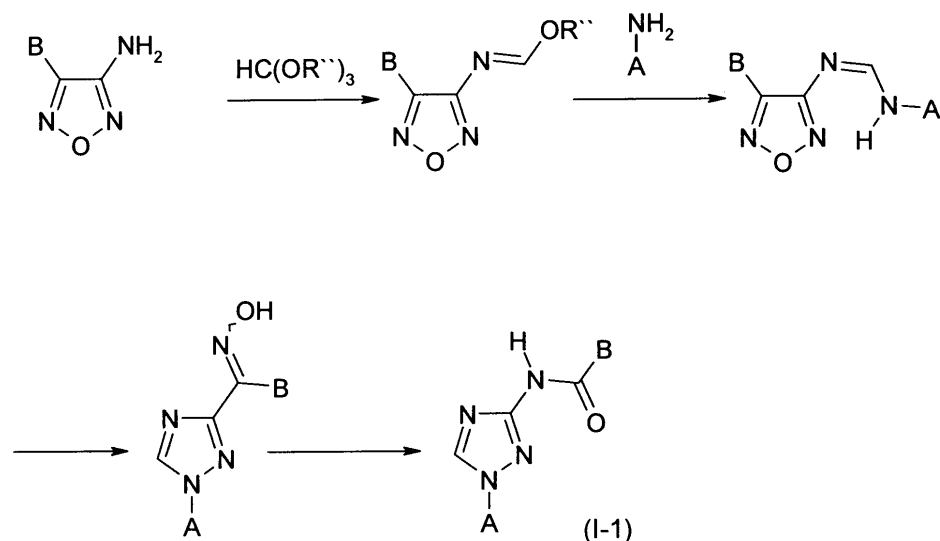


10

【0 1 1 2】

式 (I-1) の化合物は、N-(4-アリール-1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル)-N'-アリールホルムアミジンの転位によっても得られる (J. Chem. Soc. Perkin Trans 1, 589-591 (1977) を参照) :

【化 5 2】



20

30

【0 1 1 3】

この合成の順序で反応物として使用するアミノオキサジアゾールは、市販されており、または、文献から知られている方法で調製され得る。たとえば、WO 2009/0011850、Heterocycles 57, 811 (2002)、WO 2011/132017、J. Med. Chem. 23, 690-692 (1980)、Heterocycles 34, 2313-2322 (1992)、Tetrahedron 57, 5865-5871 (2001)、J. Chem. Soc. Perkin Trans 1, 1313 (1988)、Z. Chem. 14, 94 (1974) を参照されたい。

【0 1 1 4】

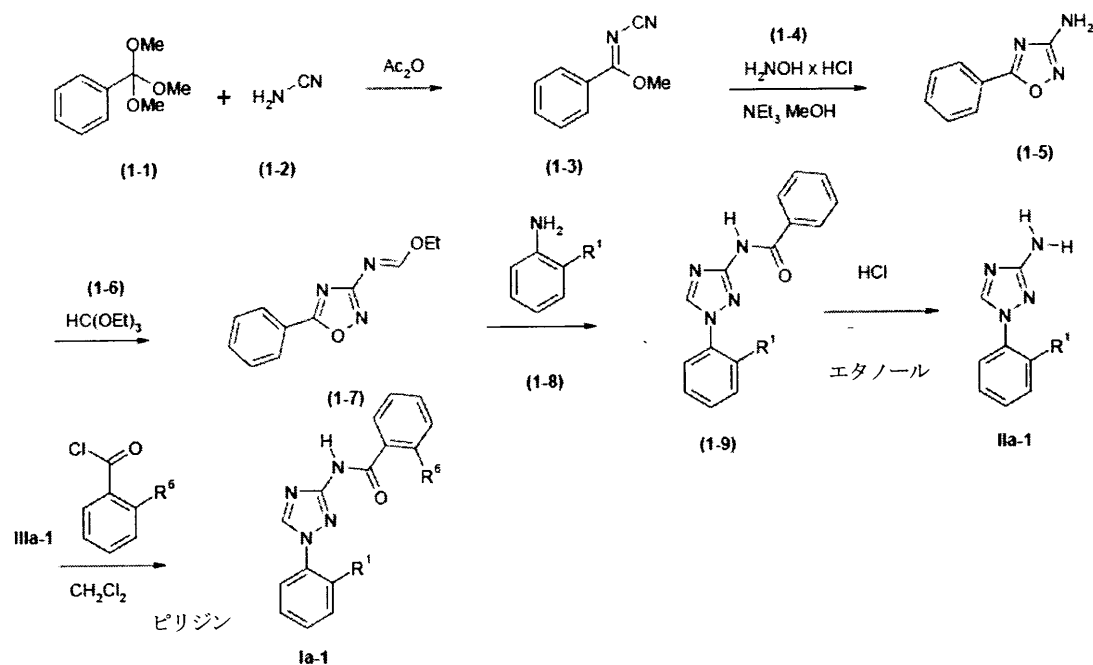
式 (I a-1) の化合物の調製に関して、本発明の化合物の合成 (分かりやすくするため、可能性のある R₂、R₃ および R₇ ラジカルは、示していない) を、合成スキーム 1 の例を参照して示す (調製実施例も参照されたい)。

40

【0 1 1 5】

合成スキーム 1 :

【化 5 3】



10

20

【0116】

このように合成した 3-ベンズアミド-1-アリール-1, 2, 4-オキサジアゾール (1-9) は新規であり、また、本発明の主題の一部を形成する。

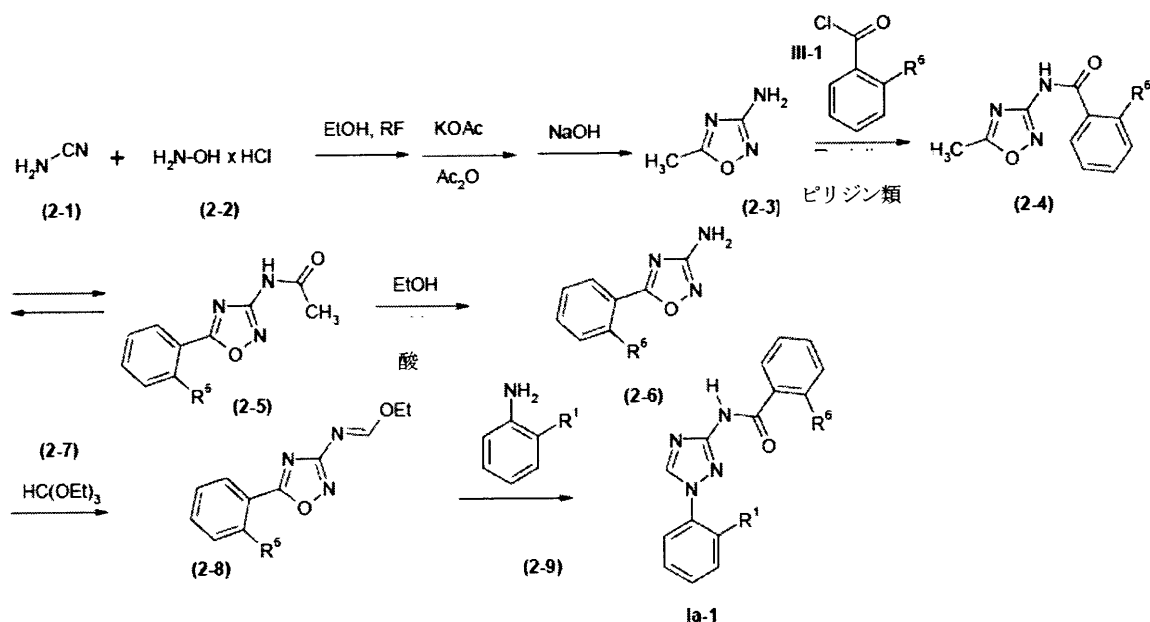
【0117】

文献 (Heterocycles, 57, 811-823を参照) により公知の方法を利用して調製され得る、式 (2-6) の置換 3-アミノ-5-アリール-1, 2, 4-オキサジアゾールを処理して、合成スキーム 2 にしたがって式 (2-8) の適切に置換されたアルキル [5-アリール-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメートを式 (2-9) のアニリン類で反応させることで、式 (Ia-1) の化合物を調製することが可能である。

【0118】

合成スキーム 2 :

【化 5 4】



40

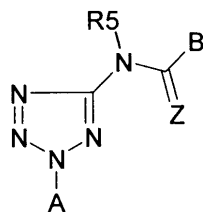
50

ZがO（酸素原子）である式（I）の化合物を、チオ化試薬（thionating reagent）、たとえば、五硫化二リンまたはローソン試薬と反応させ（C. P. Dell in Comprehensive Organic Functional Group Transformations, vol. 5, eds.: A. L. Katritzky, O. Meth-Cohn, C. W. Rees, Pergamon, Oxford, 1995, p. 565; Synthesis 2003, 13, 1929を参照されたい）、ZがS（硫黄原子）である式（I）の化合物を提供し得る。

【0119】

式（I-2）の化合物：

【化55】



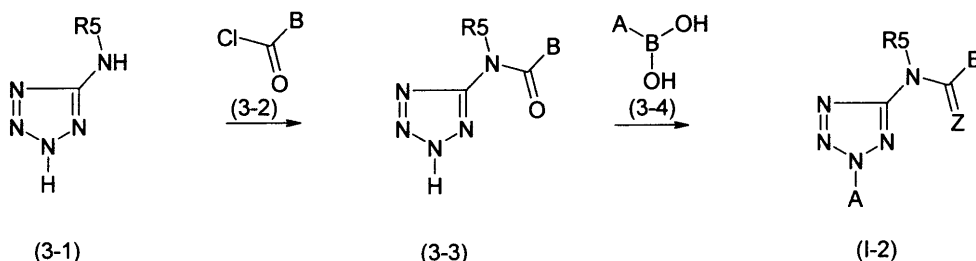
(I-2)

10

はまた、合成スキーム3：

合成スキーム3：

【化56】



(3-1)

(3-3)

(I-2)

30

を介して提供され得る。

【0120】

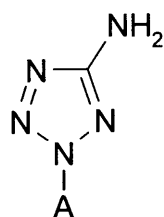
式（3-1）のアミノテトラゾールを、式（3-2）の塩化カルボニルと反応させ、構造（3-3）を有するアミドを提供し得る。式（3-3）の2H-テトラゾールを、銅（II）化合物（たとえば、酢酸銅（II）およびピリジン；Tetrahedron 1998, 39, 2941を参照されたい）の存在下で式（3-4）のボロン酸と反応させ、式（I-2）の化合物を得る。

【0121】

式（II-2）：

40

【化 5 7】



(II-2)

10

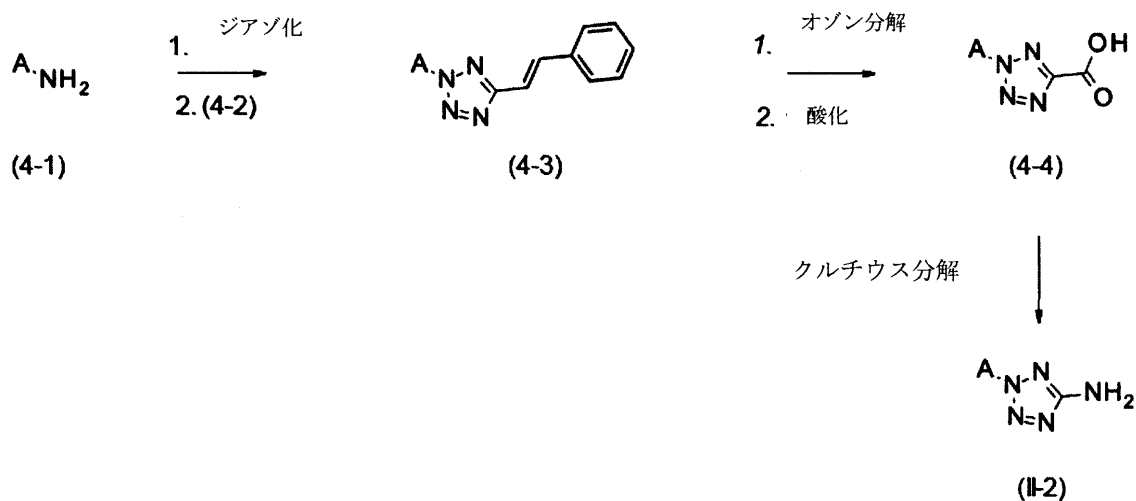
のいくつかのアミンは、市販されている。一例として、2-フェニル-2H-テトラゾール-5-アミンが挙げられる。

【0122】

新規である式 (II-2) のアミンは、合成スキーム 4 :

合成スキーム 4 :

【化 5 8】



20

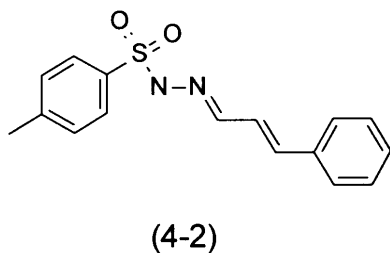
30

に従って得られ得る。

【0123】

式 (4-1) の芳香族アニリン類は、第 1 の工程で、たとえば、塩酸中の亜硝酸ナトリウムとジアゾ化され得、次いで、トシルヒドラゾン、たとえば式 (4-2) :

【化 5 9】



(4-2)

40

と、ピリジンの存在下で環化させ得、式 (4-3) のテトラゾール (J. Med. Chem. 2000, 43, 953を参照されたい) を得る。オゾン分解および次に続く酸化 (たとえば、クロム酸ナトリウム (VI) で、Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations; Larock, R. C., Ed.; Wiley-VCH: New York, 1999を参照) の後に、式 (4-3) の化合物から式 (4-4) のカルボン酸を得て、これを、クルチウス

50

分解によって式 (I I - 2) の 5 - アミノテトラゾールに転化され得る (Org. React. 19 46, 337)。

【0124】

本発明に従った、式 (I) の新規化合物を調製するプロセスは、好ましくは希釈剤を用いて実行される。本発明に従ったプロセスの実行に有用な希釈剤は、水だけでなく、全ての不活性溶媒である。たとえば：ハロ炭化水素（たとえば、テトラクロロエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1, 2 - ジクロロエタン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼンといった塩化炭化水素）、アルコール（たとえば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール）、エーテル（たとえば、エチルプロピルエーテル、メチル *tert* - ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ *n* - ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4 - ジオキサン、ジクロロジエチルエーテルおよびエチレンオキシドおよび／またはプロピレンオキシドのポリエーテル）、アミン（たとえば、トリメチルー、トリエチルー、トリプロピルー、トリブチルアミン、*N* - メチルモルホリン、ピリジンおよびテトラメチレンジアミン）、ニトロ炭化水素（たとえば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、*o* - ニトロトルエン）；ニトリル（たとえば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、*m* - クロロベンゾニトリル）、テトラヒドロチオフェンジオキシド、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン（たとえば、ジメチル、ジエチル、ジプロピル、ジブチル、ジフェニル、ジヘキシル、メチルエチル、エチルプロピル、エチルイソブチルおよびペンタメチレンスルホン）、脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素（たとえば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナンおよび工業用炭化水素）、ならびに、たとえば 40 °C ~ 250 °C の範囲に沸点を有する成分を有する「ホワイトスピリット (white spirits)」と呼ばれるもの、シメン、70 °C ~ 190 °C の沸騰範囲内にある石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、エステル（たとえば、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチルおよび酢酸イソブチル、炭酸ジメチル、炭酸ジブチルおよび炭酸エチレン）；アミド（たとえば、ヘキサメチレンホスホラミド、ホルムアミド、*N* - メチルホルムアミド、*N*, *N* - ジメチルホルムアミド、*N*, *N* - ジプロピルホルムアミド、*N*, *N* - ジブチルホルムアミド、*N* - メチルピロリジン、*N* - メチルカプロラクタム、1, 3 - ジメチル - 3, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - 2 (1H) - ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリンジオン、*N* - ホルミルピペリジン、*N*, *N* ' - ジホルミルピペラジン) およびケトン（たとえば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン）が挙げられる。

【0125】

本発明に従ったプロセスを上記の溶媒および希釈剤の混合物中で実施することももちろん可能である。

【0126】

本発明に従ったプロセスを実施する際に、反応温度は、比較的広い範囲内で異なり得る。通常は、-30 °C および +150 °C の間、好ましくは -10 °C および +100 °C の間の温度を用いる。

【0127】

本発明に従ったプロセスは通常、大気圧下で実施される。しかし、上昇または低下した気圧下、通常は 0.1 bar および 15 bar の間の絶対圧で本発明のプロセスを実施す

ることも可能である。

【0128】

本発明に従ったプロセスを実施するために、出発材料は、通常、およその等モル量で使用される。しかし、成分の1つを比較的多く過剰に使用することも可能である。反応は通常、反応補助剤の存在下で、適切な希釈剤中で実施され、また、保護ガス雰囲気下（たとえば、窒素、アルゴンまたはヘリウム下）で実施されてもよく、反応混合物は通常、必要とされる温度で数時間攪拌される。ワークアップは、従来の方法で実施される（調製実施例を参照）。

【0129】

本発明に従ったプロセスを実施するのに用いられる塩基性反応補助剤は、適切なすべての酸結合剤であり得る。たとえば：アルカリ土類金属またはアルカリ金属化合物（たとえば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよびバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物および炭酸塩）、アミジン塩基またはグアニジン塩基（たとえば、7-メチル-1, 5, 7-トリアザビシクロ[4. 4. 0]デカ-5-エン(MTBD)；ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン(DBN)、ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン(DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン(DBU)、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン(CyTBG)、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン(CyTMG)、N, N, N, N-テトラメチル-1, 8-ナフタレンジアミン、ペンタメチルピペリジン)およびアミン、とりわけ三級アミン（たとえば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジメチルトルイジン、N, N-ジメチル-p-アミノピリジン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルイミダゾール、N-メチルピラゾール、N-メチルモルホリン、N-メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、2-ピコリン、3-ピコリン、ピリミジン、アクリジン、N, N, N', N'-テトラメチレンジアミン、N, N, N', N'-テトラエチレンジアミン、キノキサリン、N-プロピルジイソプロピルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、N, N'-ジメチルシクロヘキシルアミン、2, 6-フルチジン、2, 4-フルチジンまたはトリエチルジアミン)が挙げられる。

【0130】

本発明に従ったプロセスを実施するのに用いられる酸性反応補助剤は、全ての鉱酸（たとえば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸またはヨウ化水素酸といったハロゲン化水素酸、および硫酸、リン酸、亜リン酸、硝酸）、ルイス酸（たとえば、塩化アルミニウム(III)、三フッ化ホウ素またはそのエーテラート、塩化チタン(IV)、塩化スズ(IV))、および、有機酸（たとえば、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、マロン酸、乳酸、シュウ酸、フマル酸、アジピン酸、ステアリン酸、酒石酸、オレイン酸、メタンスルホン酸、安息香酸、ベンゼンスルホン酸またはパラトルエンスルホン酸)が挙げられる。

【0131】

異性体

置換基の性質によって、式(I)の化合物は、幾何異性体および／または光学活性な異性体の形態であり得、または、異なる組成での対応する異性体混合物の形態であり得る。立体異性体は、たとえば、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、アトロプ異性体または幾何異性体である。したがって、本発明は、純立体異性体およびこれら異性体のあらゆる所望される混合物を包含する。

【0132】

方法および使用

本発明はまた、動物の害虫を防除する方法にも関し、当該方法では、式(I)の化合物が動物の害虫および／またはその生息地に作用することが可能になる。動物の害虫の防除は、好ましくは農業および森林ならびに材料保護で実行される。好ましくは、ヒトまたは動物の身体の外科的または治療的処置のための方法およびヒトまたは動物の身体に実施さ

れる診断的方法は除外される。

【0133】

本発明はさらに、式（I）の化合物を殺虫剤、とりわけ作物保護剤として使用することに関する。

【0134】

本明細書の文脈では、「殺虫剤」という用語は、「作物保護剤」という用語も常に含んでなる。

【0135】

式（I）の化合物は、良好な植物耐性、好ましい恒温動物毒性および良好な環境適合性を踏まえると、植物および植物の器官を生物学的および非生物学的ストレス要因から保護すること、収穫率を上げること、収穫物の質を改善すること、および、農業、園芸、畜産、水産養殖、森林、庭園および娯楽施設、保管製品および材料の保護ならびに衛生セクターで遭遇する動物の害虫、とりわけ昆虫類、蛛形類、蠕虫類、線形動物および軟体動物を防除することに適している。式（I）の化合物は、好ましくは殺虫剤として使用され得る。式（I）の化合物は、正常に感応性および耐性を有する種に対して、および、全てまたはいくつかの発達段階に対して効果的である。上記の害虫としては：

Arthropoda門、とりわけArachnida綱の害虫、たとえば、*Acarus* spp.、たとえば*Acarus siro*、*Aceria kuko*、*Aceria sheldoni*、*Aculops* spp.、*Aculus* spp.、たとえば*Aculus fockeui*、*Aculus schlechtendali*、*Amblyomma* spp.、*Amphitetranychus viennensis*、*Argas* spp.、*Boophilus* spp.、*Brevipalpus* spp.、たとえば*Brevipalpus phoenicis*、*Bryobia graminum*、*Bryobia praetiosa*、*Centruroides* spp.、*Chorioptes* spp.、*Dermanyssus gallinae*、*Dermatophagoides pteronyssinus*、*Dermatophagoides farinae*、*Dermacentor* spp.、*Eotetranychus* spp.、たとえば*Eotetranychus hicoriae*、*Epitrimerus pyri*、*Eutetranychus* spp.、たとえば*Eutetranychus banksi*、*Eriophyes* spp.、たとえば*Eriophyes pyri*、*Glycyphagus domesticus*、*Halotydeus destructor*、*Hemitarsonemus* spp.、たとえば*Hemitarsonemus latus*(=*Polyphagotarsonemus latus*)、*Hyalomma* spp.、*Ixodes* spp.、*Latrodectus* spp.、*Loxosceles* spp.、*Neutrombicula autumnalis*、*Nuphessa* spp.、*Oligonychus* spp.、たとえば*Oligonychus coniferarum*、*Oligonychus ilicis*、*Oligonychus indicus*、*Oligonychus mangiferus*、*Oligonychus pratensis*、*Oligonychus punicae*、*Oligonychus yothersi*、*Ornithodorus* spp.、*Ornithonyssus* spp.、*Panonychus* spp.、たとえば*Panonychus citri*(=*Metatetranychus citri*)、*Panonychus ulmi*(=*Metatetranychus ulmi*)、*Phyllocoptruta oleivora*、*Platytetranychus multidigituli*、*Polyphagotarsonemus latus*、*Psoroptes* spp.、*Rhipicephalus* spp.、*Rhizoglyphus* spp.、*Sarcoptes* spp.、*Scorpio maurus*、*Steneotarsonemus* spp.、*Steneotarsonemus spinki*、*Tarsonemus* spp.、たとえば*Tarsonemus confusus*、*Tarsonemus pallidus*、*Tetranychus* spp.、たとえば*Tetranychus canadensis*、*Tetranychus cinnabarinus*、*Tetranychus turkestani*、*Tetranychus urticae*、*Trombicula alfreddugesi*、*Vaejovis* spp.、*Vasates lycopersici*；
Chilopoda綱から、たとえば、*Geophilus* spp.、*Scutigera* spp.；
Collembola目または綱から、たとえば、*Onychiurus armatus*；*Sminthurus viridis*；
Diplopoda綱から、たとえば、*Blaniulus guttulatus*；
Insecta綱、たとえばBlattodea目から、たとえば、*Blatta orientalis*、*Blattella asahinai*、*Blattella germanica*、*Leucophaea maderae*、*Panchlora* spp.、*Parcoblatta* spp.、*Periplaneta* spp.、たとえば*Periplaneta americana*、*Periplaneta australasiae*、*Supella longipalpa*；
Coleoptera目から、たとえば、*Acalymma vittatum*、*Acanthoscelides obtectus*、*Adoretus* spp.、*Agelastica alni*、*Agriotes* spp.、たとえば*Agriotes linneatus*、*Agriotes mancus*、*Alphitobius diaperinus*、*Amphimallon solstitialis*、*Anobium punctatum*、*Anoplophora* spp.、*Anthonomus* spp.、たとえば*Anthonomus grandis*、*Anthrenus* spp.、*Apion* spp.、*Apogonia* spp.、*Atomaria* spp.、たとえば*Atomaria linearis*、*Attagenus* spp.、*Baris caerulescens*、*Bruchidius obtectus*、*Bruchus* spp.、たとえば*Bruchus pisorum*、Br

uchus rufimanus, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., とな
 ば*Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Cha*
etocnema spp., となば*Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnem*
a ectypa, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., となば*Cosmopoli*
tes sordidus, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., となば*Curc*
ulio caryae, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes*
ferrugineus, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorrhynchus lapathi*, *Cryptorrhynchus mang*
iferae, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furn*
issi, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., となば*Diabrotica balteata*, *Diabrotica b*
arberi, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpu* 10
nctata, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zaeae*, *Dichocrocis s*
pp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., となば*Epilachna bo*
realis, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., となば*Epitrix cucumeris*, *Epitrix f*
uscula, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp.
 、*Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*
 、*Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypome*
ces squamosus, *Hypothenemus* spp., となば*Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obsc*
urus, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*,
Latheticus oryzae, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucop*
tera spp., となば*Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., 20
Luperomorpha xanthodera, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus*
 spp., となば*Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp
 ., となば*Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xant*
hographus, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus su*
rinamensis, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., となば*Otiorhynchus cribrico*
llis, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*,
Otiorhynchus sulcatus, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp.
 、*Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., となば*Phyllotreta armoraciae*, *Phyllot*
reta pusilla, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Prem*
notrypes spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., となば*Psylliodes affin* 30
is, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius vent*
ralis, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., となば*Sitophilus granarius*, *Sito*
philus linearis, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stego*
bium paniceum, *Sternechus* spp., となば*Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp.,
Tanymecus spp., となば*Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus pal*
liatus, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., となば*Tri*
bolium audax, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius*
 spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., となば*Zabrus tenebrioides* ;
 Diptera目から、となば、*Aedes* spp., となば*Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Ae*
des sticticus, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., となば*Agromyza frontella*, *Agromyza* 40
parvicornis, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., となば*Anopheles quadrimaculatus*
 、*Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., となば*Bactrocera cucur*
bitae, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora eryth*
rocephala, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp
 ., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., とな
 ば*Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia sch*
ulzi, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Crico*
topus sylvestris, *Culex* spp., となば*Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Cul*
icoides spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., とな
 ば*Dasineura brassicae*, *Delia* spp., となば*Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia* 50

florilega, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp.,
 たとえば *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Fannia* sp
 p., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrell*
ia griseola, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., た
 とえば *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp.
 、たとえば *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., たとえば *Mu*
sca domestica, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytar*
sus spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* spp., たとえば *Pegomya betae*, *Pe*
gomya hyoscyami, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp.
 、*Piophil*
casei, *Prodipl*
osis spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., たとえば *Rhagol*
etis cingulata, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*,
Rhagoletis mendax, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., た
 とえば *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp.
 、たとえば *Tipula paludosa*, *Tipula simplex* ;
 Hemiptera 目から、たとえば、*Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia*
uncatoides, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., たとえば *Acyrtosiphon pisum*, *Acr*
ogonia spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosce*
na spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus*
barodensis, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., た
 とえば *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp.,
 たとえば *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostig*
ma piri, *Aphis* spp., たとえば *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aph*
is forbesi, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis heder*
ae, *Aphis illinoisensis*,
Aphis middletoni, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Ap*
his viburniphila, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidio*
tus spp., たとえば *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tab*
aci, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichr*
ysi, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., たとえば *Cacopsyll*
a pyricola, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*
 、*Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*
 、*Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus fic*
us, *Cicadulina mbila*, *Cocco*
mytilus halli, *Coccus* spp., たとえば *Coccus hesperidum*
 、*Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*,
Cryptoneossa spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes citri*, *Diaphori*
na citri, *Diaspis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., たとえば *Dysaphis apiifolia*
 、*Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., た
 とえば *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasc*
a stevensi, *Eriosoma* spp., たとえば *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Erio*
soma pyricola, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis*
bilobatus, *Ferrisia* spp., *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*
 、*Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopte*
rus pruni, *Icerya* spp., たとえば *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp.
 、*Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., たとえば *Lecanium corni* (= *Parthenolecani*
m corni), *Lepidosaphes* spp., たとえば *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lycorm*
a delicatura, *Macrosiphum* spp., たとえば *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lili*
i, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*
 、*Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costali*
s, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., たとえば *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *My*
zus ligustri, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisni*
gri, *Nephotettix* spp., たとえば *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*,
Nilaparvata lugens, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachyp*

sylla spp., Parabemisia myricae, ParatRIOza spp., たとえばParatRIOza cockerelli
 、Parlatoria spp., Pemphigus spp., たとえばPemphigus bursarius, Pemphigus populi
 venae, Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., たとえばPhenacoccus madeirensis, Phl
 oemyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., たとえばPhylloxera devast
 atrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., たとえばPl
 anococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacas
 pis pentagona, Pseudococcus spp., たとえばPseudococcus calceolariae, Pseudococcu
 s comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus vibu
 rni, Psyllopsis spp., Psylla spp., たとえばPsylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri
 、Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., たとえばQuadraspidiotus j 10
 uglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesad
 a gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., たとえばRhopalosiphum maidis, Rh
 opalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saiss
 etia spp., たとえばSaissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Sai
 ssetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus
 、Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictoceph
 ala festina, Siphoninus phillyrae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephala spp.
 、Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., たとえばToxoptera aura
 ntii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., たとえばTrio
 za diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyгина spp.; 20
 Heteroptera 亜目から、たとえば、Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Bl
 issus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., た
 とえばCimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Coll
 aria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris
 hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., たとえばEuschistus heros, Euschistus
 servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurygaster spp., Halyomor
 pha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocorisa spp., Leptocorisa v
 aricornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp., た
 とえばLygocoris pabulinus, Lygus spp., たとえばLygus elisus, Lygus hesperus, Lyg
 us lineolaris, Macropes excavatus, Monalonion atratum, Nezara spp., たとえばNeza 30
 ra viridula, Oebalus spp., Piesma quadrata, Piezodorus spp., たとえばPiezodorus
 guildinii, Psallus spp., Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singula
 ris, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., T
 riatoma spp. ;
 Hymenoptera 目から、たとえば、Acromyrmex spp., Athalia spp., たとえばAthalia rosa
 e, Atta spp., Diprion spp., たとえばDiprion similis, Hoplocampa spp., たとえばHo
 plocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema humile, Monomor
 ium pharaonis, Sirex spp., Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Urocerus spp., Ves
 pa spp., たとえばVespa crabro, Xeris spp. ;
 Isopoda 目から、たとえば、Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scabe 40
 r ;
 Isoptera 目から、Coptotermes spp., たとえばCoptotermes formosanus, Cornitermes cu
 mulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Microtermes obesi, Odontotermes sp
 p., Reticulitermes spp., たとえばReticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperu
 s ;
 Lepidoptera 目から、たとえば、Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp.
 、たとえばAdoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., たとえばAgrotis sege
 tum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., たとえばAlabama argillacea, Amyelois transit
 ella, Anarsia spp., Anticarsia spp., たとえばAnticarsia gemmatalis, Argyroploce
 spp., Barathra brassicae, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus pinia 50

rius, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia* *theivora*, *Capua* *reticulana*, *Carpocapsa* *pomonella*, *Carposina* *niponensis*, *Cheimatobia* *brumata*, *Chilo* spp., たとえば *Chilo* *plejadellus*, *Chilo* *suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia* *ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis* *medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., たとえば *Cydia* *nigricana*, *Cydia* *pomonella*, *Dalaca* *noctuides*, *Diaphania* spp., *Diatraea* *saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha* *aurantium*, *Elasmopalpus* *lignosellus*, *Eldana* *saccharina*, *Ephestia* spp., たとえば *Ephestia* *elutella*, *Ephestia* *kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas* *postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia* *ambiguella*, *Euproctis* spp., たとえば *Euproctis* *chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria* *mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., たとえば *Grapholitha* *molesta*, *Grapholitha* *prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., たとえば *Helicoverpa* *armigera*, *Helicoverpa* *zea*, *Heliothis* spp., たとえば *Heliothis* *virescens*, *Hofmannophila* *pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta* *padella*, *Kakivoria* *flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Leucinodes* *orbonalis*, *Leucoptera* spp., たとえば *Leucoptera* *coffeella*, *Lithocolletis* spp., たとえば *Lithocolletis* *blancardella*, *Lithophane* *antennata*, *Lobesia* spp., たとえば *Lobesia* *botrana*, *Loxagrotis* *albicosta*, *Lymantria* spp., たとえば *Lymantria* *dispar*, *Lyonetia* spp., たとえば *Lyonetia* *clerkella*, *Malacosoma* *neustria*, *Maruca* *testulalis*, *Mamestra* *brassicae*, *Melanitis* *leda*, *Mocis* spp., *Monopis* *obviella*, *Mythimna* *separata*, *Nemapogon* *cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., たとえば *Ostrinia* *nubilalis*, *Oulema* *melanopus*, *Oulema* *oryzae*, *Panolis* *flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., たとえば *Pectinophora* *gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., たとえば *Phthorimaea* *operculella*, *Phyllocnistis* *citrella*, *Phyllonorycter* spp., たとえば *Phyllonorycter* *blancardella*, *Phyllonorycter* *crataegella*, *Pieris* spp., たとえば *Pieris* *rapae*, *Platynota* *stultana*, *Plodia* *interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella* *xylostella*(=*Plutella* *maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., たとえば *Pseudaletia* *unipuncta*, *Pseudoplusia* *inclusens*, *Pyrausta* *nubilalis*, *Rachiplusia* *nu*, *Schoenobius* spp., たとえば *Schoenobius* *bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., たとえば *Scirpophaga* *innotata*, *Scotia* *segetum*, *Sesamia* spp., たとえば *Sesamia* *inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., たとえば *Spodoptera* *eradiana*, *Spodoptera* *exigua*, *Spodoptera* *frugiperda*, *Spodoptera* *praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx* *subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia* *solanivora*, *Thermesia* *gemmatalis*, *Tinea* *cloacella*, *Tinea* *pellionella*, *Tineola* *bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga* *tapetzella*, *Trichoplusia* spp., たとえば *Trichoplusia* *ni*, *Tryporyza* *incertulas*, *Tuta* *absoluta*, *Virachola* spp. ;

Orthoptera目またはSaltatoria目から、たとえば、*Acheta* *domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., たとえば *Gryllotalpa* *gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., たとえば *Locusta* *migratoria*, *Melanoplus* spp., たとえば *Melanoplus* *devastator*, *Paratlanticus* *ussuriensis*, *Schistocerca* *gregaria* ;

Phthiraptera目から、たとえば、*Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera* *vastatrix*, *Phthirus* *pubis*, *Trichodectes* spp. ;

Psocoptera目から、たとえば、*Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp. ;

Siphonaptera目から、たとえば、*Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., たとえば *Ctenocephalides* *canis*, *Ctenocephalides* *felis*, *Pulex* *irritans*, *Tunga* *penetrans*, *Xenopsylla* *cheopis* ;

Thysanoptera目から、たとえば、*Anaphothrips* *obscurus*, *Baliothrips* *biformis*, *Drepanothrips* *reuteri*, *Enneothrips* *flavens*, *Frankliniella* spp., たとえば *Frankliniella* *fusca*, *Frankliniella* *occidentalis*, *Frankliniella* *schultzei*, *Frankliniella* *tritici*, *Frankliniella* *vaccinii*, *Frankliniella* *williamsi*, *Heliothrips* spp., *Hercinothrips*

rips femoralis, Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips car
damomi, Thrips spp., たとえばThrips palmi, Thrips tabaci ;

Zygentoma (=Thysanura) 目から、たとえば、Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina,
Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica ;

Symphyla綱から、たとえば、Scutigerella spp., たとえばScutigerella immaculata ;

Mollusca門の害虫、たとえば、Bivalvia綱から、たとえばDreissena spp. ;

および、Gastropoda綱から、たとえば、Arion spp., たとえばArion ater rufus, Biomph
alaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., たとえばDeroceras laeve, Galba spp.,
Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp. ;

Platyhelminthes門およびNematoda門の動物およびヒトの寄生虫、たとえば、Aelurostron 10
gylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Anisakis sp
p., Anoplocephala spp., Ascaris spp., Ascaridia spp., Baylisascaris spp., Brugia
spp., Bunostomum spp., Capillaria spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooper
ia spp., Crenosoma spp., Cyathostoma spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus spp.
、Diphyllbothrium spp., Dipylidium spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp., Ec
hinococcus spp., Echinostoma spp., Enterobius spp., Eucoleus spp., Fasciola spp.
、Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Filaroides spp., Gongylonema spp., Gyrod
actylus spp., Habronema spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Heterakis
spp., Hymenolepis spp., Hyostrongylus spp., Litomosoides spp., Loa spp., Metastr
ongylus spp., Metorchis spp., Mesocestoides spp., Moniezia spp., Muellerius spp. 20
、Necator spp., Nematodirus spp., Nippostrongylus spp., Oesophagostomum spp., Ol
lulanus spp., Onchocerca spp., Opisthorchis spp., Oslerus spp., Ostertagia spp.,
Oxyuris spp., Paracapillaria spp., Parafilaria spp., Paragonimus spp., Paramphis
tomum spp., Paranoplocephala spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Protostrong
ylus spp., Schistosoma spp., Setaria spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp.
、Stephanurus spp., Strongyloides spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Taenia s
pp., Teladorsagia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Trichinel
la spp., Trichobilharzia spp., Trichostrongylus spp., Trichuris spp., Uncinaria
spp., Wuchereria spp. ;

Nematoda門の植物の害虫、すなわち、植物寄生性線形動物、とりわけAglenchus spp., た 30
とえばAglenchus agricola, Anguina spp., たとえばAnguina tritici, Aphelenchoides
spp., たとえばAphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus s
pp., たとえばBelonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nor
toni, Bursaphelenchus spp., たとえばBursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus
eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., たとえばCacopaurus pestis,
Criconemella spp., たとえばCriconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconem
ella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax(= Mesocriconema xenoplax
)、Criconemoides spp., たとえばCriconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Cri
conemoides ornatum, Ditylenchus spp., たとえばDitylenchus dipsaci, Dolichodorus
spp., Globodera spp., たとえばGlobodera pallida, Globodera rostochiensis, Helico 40
tylenchus spp., たとえばHelicotylenchus dihystra, Hemicriconemoides spp., Hemic
ycyliophora spp., Heterodera spp., たとえばHeterodera avenae, Heterodera glycines
、Heterodera schachtii, Hoplolaimus spp., Longidorus spp., たとえばLongidorus af
ricanus, Meloidogyne spp., たとえばMeloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Me
loidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenc
hus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., たとえばParatrichodorus min
or, Pratylenchus spp., たとえばPratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psi
lenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., たとえばRadop
holus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scu
tallonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., たとえばTrichodorus obtusus, 50

Trichodorus primitivus、*Tylenchorhynchus* spp.、たとえば*Tylenchorhynchus annulatus*、*Tylenchulus* spp.、たとえば*Tylenchulus semipenetrans*、*Xiphinema* spp.、たとえば*Xiphinema index*が挙げられる。

【0136】

さらに、Protozoa亜界から、Coccidia目、たとえば*Eimeria* spp.を防除することが可能である。

【0137】

線形動物

本明細書の文脈では、「線形動物」という用語は、Nematoda門のすべての種を含んでなり、ここでは特に、植物もしくは真菌類への寄生虫として機能する種（たとえば、*Aphelenchida*目、*Meloidogyne*、*Tylenchida*およびその他の種）またはヒトおよび動物への寄生虫として機能する種（たとえば、*Trichinellida*目、*Tylenchida*目、*Rhabditida*目および*Spirurida*目の種）、または、これらの生物内もしくは生物上に損害を引き起こす種、ならびに、他の寄生性蠕虫類も含んでなる。

【0138】

作物保護における殺線虫剤は、本明細書で説明する通り、線形動物を防除することができる。

【0139】

「線形動物を防除」という用語は、線形動物を殺すこと、または、線形動物の発達もしくは成長を防止もしくは妨害すること、または、線形動物が植物組織内に侵入することもしくは植物組織を吸い尽くすことを防止もしくは妨害することを意味する。

【0140】

ここで、化合物の効能は、式（I）の化合物で処理した植物もしくは植物部分またはその処理された土壌と、未処理の植物もしくは植物部分またはその未処理の土壌（100％）との間で、の死亡率、虫こぶ形成、シスト形成、土壌の体積あたりの線形動物密度、根あたりの線形動物密度、土壌体積あたりの線形動物の卵の数、線形動物の移動度を比較することで決定される。好ましくは、達成される低下は、未処理の植物、植物部分またはその未処理の土壌と比較して25～50％、より好ましくは51～79％および最も好ましくは80～100％の低下による線形動物の完全な死滅または発達および成長の完全防止である。本明細書で説明する線形動物の防除は、線形動物の増殖（シストおよび／または卵の発達）の防除も含んでなる。式（I）の化合物は同様に、植物または動物の保健を維持するためにも用いられ得、および、治療的、防止的または浸透移行的な方法で線形動物を防除するためにも用いられ得る。

【0141】

当業者であれば、死亡率、虫こぶ形成、シスト形成、土壌の体積あたりの線形動物密度、根あたりの線形動物密度、土壌体積あたりの線形動物の卵の数、線形動物の移動度を決定する方法を知っている。

【0142】

式（I）の化合物の使用によって植物は健康を維持し得、および、式（I）の化合物の使用は、線形動物が引き起こす損害の低下および収穫率の増加を含んでなる。

【0143】

本明細書の文脈では、「線形動物」という用語は、植物に損害をあたえるすべての線形動物を含んでなる植物線形動物を指す。植物線形動物は、植物寄生性線形動物および土壌伝播性線形動物を含んでなる。植物寄生性線形動物としては、*Xiphinema* spp.、*Longidorus* spp.および*Trichodorus* spp.といった外部寄生虫；*Tylenchulus* spp.といった半寄生虫；*Pratylenchus* spp.、*Radopholus* spp.および*Scutellonema* spp.といった移動性内部寄生虫；*Heterodera* spp.、*Globodera* spp.および*Meloidogyne* spp.といった非移動性寄生虫、および、*Ditylenchus* spp.、*Aphelenchoides* spp.および*Hirschmaniella* spp.といった、茎葉内部寄生虫が挙げられる。特に有害な根に寄生する土壌線形動物は、たとえば、*Heterodera*属もしくは*Globodera*属のシスト形成線形動物、および／または*Meloidogyne*

属の根の虫こぶ線形動物である。これらの属の有害な種は、たとえば、*Meloidogyne inco*
gnita、*Heterodera glycines*（ダイズシストセンチュウ）、*Globodera pallida*および*Glo*
bodera rostochiensis（ジャガイモシストセンチュウ）であり、これらの種は、本明細書
 に記載された化合物によって効果的に防除される。しかし、本明細書に記載された化合物
 の使用はこれらの属または種子に限定されず、同様の方法で他の線形動物にも拡大される
 。

【0144】

植物線形動物としては、たとえば、*Aglenchus agricola*、*Anguina tritici*、*Aphelench*
oides arachidis、*Aphelenchoides fragaria*、および茎葉内部寄生虫である*Aphelenchoid*
es spp.、*Belonolaimus gracilis*、*Belonolaimus longicaudatus*、*Belonolaimus nortoni*
 、*Bursaphelenchus cocophilus*、*Bursaphelenchus eremus*、*Bursaphelenchus xylophilus*
 und *Bursaphelenchus spp.*、*Cacopaurus pestis*、*Criconemella curvata*、*Criconemella*
onoensis、*Criconemella ornata*、*Criconemella rusium*、*Criconemella xenoplax* (=Mes
ocriconema xenoplax) および*Criconemella spp.*、*Criconemoides ferniae*、*Criconemoid*
es onoense、*Criconemoides ornatum*および*Criconemoides spp.*、*Ditylenchus destructo*
r、*Ditylenchus dipsaci*、*Ditylenchus myceliophagus*および茎葉内部寄生虫である*Dityl*
enchus spp.、*Dolichodorus heterocephalus*、*Globodera pallida* (=Heterodera pallida
)、*Globodera rostochiensis*（ジャガイモシストセンチュウ）、*Globodera solanacearu*
m、*Globodera tabacum*、*Globodera virginia*および非移動性シスト形成寄生虫である*Glob*
odera spp.、*Helicotylenchus digonicus*、*Helicotylenchus dihystra*、*Helicotylenchu*
s erythrine、*Helicotylenchus multicinctus*、*Helicotylenchus nannus*、*Helicotylench*
*us pseudorobustus*および*Helicotylenchus spp.*、*Hemicriconemoides*、*Hemicycliophora*
arenaria、*Hemicycliophora nudata*、*Hemicycliophora parvana*、*Heterodera avenae*、*He*
terodera cruciferae、*Heterodera glycines*（ダイズシストセンチュウ）、*Heterodera o*
ryzae、*Heterodera schachtii*、*Heterodera zeae*および非移動性シスト形成寄生虫である
Heterodera spp.、*Hirschmaniella gracilis*、*Hirschmaniella oryzae*、*Hirschmaniella*
*spinicaudata*および茎葉内部寄生虫である*Hirschmaniella spp.*、*Hoplolaimus aegyptii*
 、*Hoplolaimus californicus*、*Hoplolaimus columbus*、*Hoplolaimus galeatus*、*Hoplolai*
mus indicus、*Hoplolaimus magnistylus*、*Hoplolaimus pararobustus*、*Longidorus afric*
anus、*Longidorus breviannulatus*、*Longidorus elongatus*、*Longidorus laevicapitatus*
 、*Longidorus vineacola*および外部寄生虫である*Longidorus spp.*、*Meloidogyne acronea*
 、*Meloidogyne africana*、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne arenaria thamesi*、*Melo*
idogyne artiella、*Meloidogyne chitwoodi*、*Meloidogyne coffeicola*、*Meloidogyne eth*
iopica、*Meloidogyne exigua*、*Meloidogyne fallax*、*Meloidogyne graminicola*、*Meloido*
gyne graminis、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne incognita*、*Me*
loidogyne incognita acrita、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne kikuyensis*、*Meloid*
ogyne minor、*Meloidogyne naasi*、*Meloidogyne paranaensis*、*Meloidogyne thamesi*およ
 び非移動性寄生虫である*Meloidogyne spp.*、*Meloinema spp.*、*Nacobbus aberrans*、*Neoty*
lenchus vigissi、*Paraphelenchus pseudoparietinus*、*Paratrachodorus allius*、*Paratr*
ichodorus lobatus、*Paratrachodorus minor*、*Paratrachodorus nanus*、*Paratrachodorus*
porosus、*Paratrachodorus teres*および*Paratrachodorus spp.*、*Paratylenchus hamatus*
 、*Paratylenchus minutus*、*Paratylenchus projectus*および*Paratylenchus spp.*、*Pratyl*
enchus agilis、*Pratylenchus allenii*、*Pratylenchus andinus*、*Pratylenchus brachyuru*
s、*Pratylenchus cerealis*、*Pratylenchus coffeae*、*Pratylenchus crenatus*、*Pratylenc*
hus delattrei、*Pratylenchus giibbicaudatus*、*Pratylenchus goodeyi*、*Pratylenchus h*
amatus、*Pratylenchus hexincisus*、*Pratylenchus loosii*、*Pratylenchus neglectus*、*Pra*
tylenchus penetrans、*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus scribneri*、*Pratylenchu*
s teres、*Pratylenchus thornei*、*Pratylenchus vulnus*、*Pratylenchus zeae*および移動
 性内部寄生虫である*Pratylenchus spp.*、*Pseudohalenchus minutus*、*Psilenchus magnide*
ns、*Psilenchus tumidus*、*Punctodera chalcensis*、*Quinisulcius acutus*、*Radopholus*

10

20

30

40

50

citrophilus、Radopholus similis、移動性内部寄生虫であるRadopholus spp.、Rotylenchulus borealis、Rotylenchulus parvus、Rotylenchulus reniformisおよびRotylenchulus spp.、Rotylenchus laurentinus、Rotylenchus macrodoratus、Rotylenchus robustus、Rotylenchus uniformisおよびRotylenchus spp.、Scutellonema brachyurum、Scutellonema bradys、Scutellonema clathricaudatumおよび移動性内部寄生虫であるScutellonema spp.、Subanguina radiciola、Tetylenchus nicotianae、Trichodorus cylindricus、Trichodorus minor、Trichodorus primitivus、Trichodorus proximus、Trichodorus similis、Trichodorus sparsusおよび外部寄生虫Trichodorus spp.、Tylenchorhynchus agri、Tylenchorhynchus brassicae、Tylenchorhynchus clarus、Tylenchorhynchus claytoni、Tylenchorhynchus digitatus、Tylenchorhynchus ebriensis、Tylenchorhynchus maximus、Tylenchorhynchus nudus、Tylenchorhynchus vulgarisおよびTylenchorhynchus spp.、Tylenchulus semipenetransおよび半寄生虫であるTylenchulus spp.、Xiphinema americanum、Xiphinema brevicolle、Xiphinema dimorphicaudatum、Xiphinema indexおよび外部寄生虫であるXiphinema sppが挙げられる。

【0145】

式（I）の化合物がその防除のために使用される線形動物としては、サツマイモネコブセンチュウ（*Meloidogyne incognita*）、ジャワネコブセンチュウ（*Meloidogyne javanica*）、キタネコブセンチュウ（*Meloidogyne hapla*）およびアレナリアネコブセンチュウ（*Meloidogyne arenaria*）といった*Meloidogyne*属の線形動物；イモグサレセンチュウ（*Ditylenchus destructor*）および球根のスセンチュウ（stem and bulb eelworm）（*Ditylenchus dipsaci*）といった*Ditylenchus*属の線形動物；キタネグサレセンチュウ（*Pratylenchus penetrans*）、クネグサレセンチュウ（*Pratylenchus fallax*）、ミナミネグサレセンチュウ（*Pratylenchus coffeae*）、チャネグサレセンチュウ（*Pratylenchus loosi*）およびクルミネグサレセンチュウ（*Pratylenchus vulnus*）といった*Pratylenchus*属の線形動物；ジャガイモシストセンチュウ（*Globodera rostochiensis*）およびジャガイモシロシストセンチュウ（*Globodera pallida*）といった*Globodera*属の線形動物；ダイズシストセンチュウ（*Heterodera glycines*）およびテンサイシストセンチュウ（*Heterodera schachtii*）といった*Heterodera*属の線形動物；イネシンガレセンチュウ（*Aphelenchoides besseyi*）、ハガレセンチュウ（*chrysanthemum nematode*）（*Aphelenchoides ritzemabosi*）およびイチゴセンチュウ（*Aphelenchoides fragariae*）といった*Aphelenchoides*属の線形動物；菌食性センチュウ（*Aphelenchus avenae*）といった*Aphelenchus*属の線形動物；ネモグリセンチュウ（*Radopholus similis*）といった*Radopholus*属の線形動物；ミカンネセンチュウ（*Tylenchulus semipenetrans*）といった*Tylenchulus*属の線形動物；ニセフクロセンチュウ（*Rotylenchulus reniformis*）といった*Rotylenchulus*属の線形動物；マツノザイセンチュウ（*Bursaphelenchus xylophilus*）および赤輪病センチュウ（red ring nematode）（*Bursaphelenchus cocophilus*）といった樹木生息型の線形動物などが挙げられる。

【0146】

式（I）の化合物がその保護のために使用される植物としては、穀類（たとえば、米、大麦、小麦、ライ麦、オートミール、トウモロコシなど）、豆類（ダイズ、アズキ豆、豆、ソラマメ、エンドウ、ピーナッツなど）、果樹／果物類（リンゴ、柑橘種、ナシ、ブドウ、モモ、ウメ、サクランボ、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴなど）、野菜の種（キャベツ、トマト、ほうれん草、ブロッコリ、レタス、玉ねぎ、ネギ、コショウなど）、根菜類（ニンジン、ジャガイモ、サツマイモ、ラディッシュ、ハス根、カブなど）、工業原材料用植物（綿、麻、カジノキ、ミツマタ、セイヨウアブラナ、テンサイ、ホップ、サトウキビ、サトウダイコン、オリーブ、ゴム、ヤシの木、コーヒー、タバコ、茶など）、カボチャ属（カボチャ、キュウリ、スイカ、メロンなど）、牧草植物（カモガヤ、モロコシ、オオアワガエリ、クローバ、アルファルファなど）、芝草（コウライシバおよびベントグラスなど）、香辛料植物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、コショウ、ショウガなど）および花類（キク、バラ、ランなど）といった植物が挙げられる。

【0147】

式（I）の化合物は、コーヒーの線形動物、特に*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus coffeae*、*Meloidogyne exigua*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne coffeicola*、*Helicotylenchus* spp.および*Meloidogyne paranaensis*、*Rotylenchus* spp.、*Xiphinema* spp.、*Tylenchorhynchus* spp.および*Scutellonema* spp.を防除するのに特に適切である。

【0148】

式（I）の化合物は、ジャガイモの線形動物、特に*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus scribneri*、*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus coffeae*、*Ditylenchus dipsaci*および*Pratylenchus alleni*、*Pratylenchus andinus*、*Pratylenchus cerealis*、*Pratylenchus crenatus*、*Pratylenchus hexincisus*、*Pratylenchus l* 10
oosi、*Pratylenchus neglectus*、*Pratylenchus teres*、*Pratylenchus thornei*、*Pratylenchus vulnus*、*Belonolaimus longicaudatus*、*Trichodorus cylindricus*、*Trichodorus primitivus*、*Trichodorus proximus*、*Trichodorus similis*、*Trichodorus sparsus*、*Paratrichodorus minor*、*Paratrichodorus allius*、*Paratrichodorus nanus*、*Paratrichodorus teres*、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne fallax*、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne thamesi*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne chitwoodi*、*Meloidogyne javanica*、*Nacobbus aberrans*、*Globodera rostochiensis*、*Globodera pallida*、*Ditylenchus destructor*、*Radopholus similis*、*Rotylenchulus reniformis*、*Neotylenchus vigissi*、*Paraphelenchus pseudoparietinus*、*Aphelenchoides fragariae*および*Meloinema* sppを防除するの 20
に特に適切である。

【0149】

式（I）の化合物は、トマトの線形動物、特に*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne incognita*、*Pratylenchus penetrans*および*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus coffeae*、*Pratylenchus scribneri*、*Pratylenchus vulnus*、*Paratrichodorus minor*、*Meloidogyne exigua*、*Nacobbus aberrans*、*Globodera solanacearum*、*Dolichodorus heterocephalus*および*Rotylenchulus reniformis*を防除 30
するのに特に適切である。

【0150】

式（I）の化合物は、キュウリ植物の線形動物、特に*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne incognita*、*Rotylenchulus reniformis* 30
および*Pratylenchus thornei*を防除するのに特に適切である。

【0151】

式（I）の化合物は、綿の線形動物、特に*Belonolaimus longicaudatus*、*Meloidogyne incognita*、*Hoplolaimus columbus*、*Hoplolaimus galeatus*および*Rotylenchulus reniformis*を防除するの 40
に特に適切である。

【0152】

式（I）の化合物は、トウモロコシの線形動物、特に*Belonolaimus longicaudatus*、*Paratrichodorus minor*および*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus delattrei*、*Pratylenchus hexincisus*、*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus zeae*、(*Belonolaimus gracilis*)、*Belonolaimus nortoni*、*Longidorus breviannulatus*、*Meloidogyne arenaria*、 40
Meloidogyne arenaria thamesi、*Meloidogyne graminis*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne incognita acrita*、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne naasi*、*Heterodera avenae*、*Heterodera oryzae*、*Heterodera zeae*、*Punctodera chalcensis*、*Ditylenchus dipsaci*、*Hoplolaimus aegyptii*、*Hoplolaimus magnistylus*、*Hoplolaimus galeatus*、*Hoplolaimus indicus*、*Helicotylenchus digonicus*、*Helicotylenchus dihystra*、*Helicotylenchus pseudorobustus*、*Xiphinema americanum*、*Dolichodorus heterocephalus*、*Cricone mella ornata*、*Cricone mella onoensis*、*Radopholus similis*、*Rotylenchulus borealis*、*Rotylenchulus parvus*、*Tylenchorhynchus agri*、*Tylenchorhynchus clarus*、*Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus maximus*、*Tylenchorhynchus nudus*、*Tylenchorhynchus vulgaris*、*Quinisulcius acutus*、*Paratylenchus minutus*、*Hemicycliophora parv* 50

ana、*Aglencus agricola*、*Anguina tritici*、*Aphelenchoides arachidis*、*Scutellonema brachyurum*および*Subanguina radiciola*を防除するのに特に適切である。

【0153】

式(I)の化合物は、ダイズの線形動物、特に*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus scribneri*、*Belonolaimus longicaudatus*、*Heterodera glycines*、*Hoplolaimus columbus*および*Pratylenchus coffeae*、*Pratylenchus hexincisus*、*Pratylenchus neglectus*、*Pratylenchus crenatus*、*Pratylenchus allenii*、*Pratylenchus agilis*、*Pratylenchus zeae*、*Pratylenchus vulnus*、(*Belonolaimus gracilis*)、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne hapla*、*Hoplolaimus columbus*、*Hoplolaimus galeatus*および*Rotylenchulus reniformis*を防除するのに特に適切である。 10

【0154】

式(I)の化合物は、タバコの線形動物、特に*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne javanica*および*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus hexincisus*、*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus neglectus*、*Pratylenchus crenatus*、*Pratylenchus thornei*、*Pratylenchus vulnus*、*Pratylenchus zeae*、*Longidorus elongatus*、*Paratrichodorus lobatus*、*Trichodorus* spp.、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne hapla*、*Globodera tabacum*、*Globodera solanacearum*、*Globodera virginiae*、*Ditylenchus dipsaci*、*Rotylenchus* spp.、*Helicotylenchus* spp.、*Xiphinema americanum*、*Cricone mella* spp.、*Rotylenchulus reniformis*、*Tylenchorhynchus claytoni*、*Paratylenchus* spp.および*Tetylenchus nicotianae*を防除するのに特に適切である。 20

【0155】

式(I)の化合物は、柑橘類の線形動物、特に*Pratylenchus coffeae*および*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus vulnus*、*Belonolaimus longicaudatus*、*Paratrichodorus minor*、*Paratrichodorus porosus*、*Trichodorus*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne incognita acrita*、*Meloidogyne javanica*、*Rotylenchus macrodorus*、*Xiphinema americanum*、*Xiphinema brevicolle*、*Xiphinema index*、*Cricone mella* spp.、*Hemicricone moides*、*Radopholus similis*および*Radopholus citrophilus*、*Hemicycliophora arenaria*、*Hemicycliophora nudata*および*Tylenchulus semipenetrans*を防除するのに特に適切である。 30

【0156】

式(I)の化合物は、バナナの線形動物、特に*Pratylenchus coffeae*、*Radopholus similis*および*Pratylenchus giibbicaudatus*、*Pratylenchus loosii*、*Meloidogyne* spp.、*Helicotylenchus multicinctus*、*Helicotylenchus dihystra*および*Rotylenchulus* spp.を防除するのに特に適切である。

【0157】

式(I)の化合物は、パイナップルの線形動物、特に*Pratylenchus zeae*、*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus goodeyi*、*Meloidogyne* spp.、*Rotylenchulus reniformis*および*Longidorus elongatus*、*Longidorus laeviscapitatus*、*Trichodorus primitivus*、*Trichodorus minor*、*Heterodera* spp.、*Ditylenchus myceliophagus*、*Hoplolaimus californicus*、*Hoplolaimus pararobustus*、*Hoplolaimus indicus*、*Helicotylenchus dihystra*、*Helicotylenchus nannus*、*Helicotylenchus multicinctus*、*Helicotylenchus erythrone*、*Xiphinema dimorphicaudatum*、*Radopholus similis*、*Tylenchorhynchus digitatus*、*Tylenchorhynchus ebriensis*、*Paratylenchus minutus*、*Scutellonema clathricaudatum*、*Scutellonema bradys*、*Psilenchus tumidus*、*Psilenchus magnidens*、*Pseudohalenchus minutus*、*Cricone moides ferniae*、*Cricone moides onoense*および*Cricone moides ornatum*を防除するのに特に適切である。 40

【0158】

式(I)の化合物は、ブドウの線形動物、特に*Pratylenchus vulnus*、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne incognita*、*Meloidogyne javanica*、*Xiphinema americanum*、*Xiphin* 50

ema indexおよび*Pratylenchus pratensis*、*Pratylenchus scribneri*、*Pratylenchus neglectus*、*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus thornei*および*Tylenchulus semipenetrans*を防除するのに特に適切である。

【0159】

式（I）の化合物は、樹木作物、ナシ状果の線形動物、特に*Pratylenchus penetrans*および*Pratylenchus vulnus*、*Longidorus elongatus*、*Meloidogyne incognita*および*Meloidogyne hapla*を防除するのに特に適切である。

【0160】

式（I）の化合物は、樹木作物、核果の線形動物、特に*Pratylenchus penetrans*、*Pratylenchus vulnus*、*Meloidogyne arenaria*、*Meloidogyne hapla*、*Meloidogyne javanica*、*Meloidogyne incognita*、*Criconemella xenoplax*および*Pratylenchus brachyurus*、*Pratylenchus coffeae*、*Pratylenchus scribneri*、*Pratylenchus zeae*、*Belonolaimus longicaudatus*、*Helicotylenchus dihystra*、*Xiphinema americanum*、*Criconemella curvata*、*Tylenchorhynchus claytoni*、*Paratylenchus hamatus*、*Paratylenchus projectus*、*Scutellonema brachyurum*および*Hoplolaimus galeatus*を防除するのに特に適切である。

【0161】

式（I）の化合物は、樹木作物、サトウキビおよび米における線形動物、特に*Trichodorus* spp.、*Criconemella* spp.およびalso *Pratylenchus* spp.、*Paratrichodorus* spp.、*Meloidogyne* spp.、*Helicotylenchus* spp.、*Tylenchorhynchus* spp.、*Aphelenchoides* spp.、*Heterodera* spp.、*Xiphinema* spp.および*Cacopaurus pestis*を防除するのに特に適切である。

【0162】

本明細書の文脈では、「線形動物」という用語は、ヒトまたは動物に損害を与える線形動物も指す。

【0163】

ヒトまたは動物に有害である具体的な線形動物種は：
Trichinellida、たとえば：*Trichuris* spp.、*Capillaria* spp.、*Paracapillaria* spp.、*Euculeus* spp.、*Trichomosoides* spp.、*Trichinella* spp.である。

【0164】

*Tylenchida*目からは、たとえば：*Micronema* spp.、*Strongyloides* spp.である。

【0165】

*Rhabditida*目からは、たとえば：*Strongylus* spp.、*Triodontophorus* spp.、*Oesophagodontus* spp.、*Trichonema* spp.、*Gyallocephalus* spp.、*Cylindropharynx* spp.、*Poteriosomum* spp.、*Cyclococercus* spp.、*Cylicostephanus* spp.、*Oesophagostomum* spp.、*Chabertia* spp.、*Stephanurus* spp.、*Ancylostoma* spp.、*Uncinaria* spp.、*Necator* spp.、*Bunostomum* spp.、*Globocephalus* spp.、*Syngamus* spp.、*Cyathostoma* spp.、*Metastrongylus* spp.、*Dictyocaulus* spp.、*Muellerius* spp.、*Protostrongylus* spp.、*Neoststrongylus* spp.、*Cystocaulus* spp.、*Pneumoststrongylus* spp.、*Spicocaulus* spp.、*Elaphoststrongylus* spp.、*Parelaphoststrongylus* spp.、*Crenosoma* spp.、*Paracrenosoma* spp.、*Oslerus* spp.、*Angiostrongylus* spp.、*Aelurostrongylus* spp.、*Filaroides* spp.、*Parafilaroides* spp.、*Trichostrongylus* spp.、*Haemonchus* spp.、*Ostertagia* spp.、*Teladorsagia* spp.、*Marshallagia* spp.、*Cooperia* spp.、*Nippostrongylus* spp.、*Heligmosomoides* spp.、*Nematodirus* spp.、*Hyostrongylus* spp.、*Obeliscoides* spp.、*Amidostomum* spp.、*Ollulanus* spp.である。

【0166】

*Spirurida*目からは、たとえば：*Oxyuris* spp.、*Enterobius* spp.、*Passalurus* spp.、*Syphacia* spp.、*Aspiculuris* spp.、*Heterakis* spp.；*Ascaris* spp.、*Toxascaris* spp.、*Toxocara* spp.、*Baylisascaris* spp.、*Parascaris* spp.、*Anisakis* spp.、*Ascaridia* spp.；*Gnathostoma* spp.、*Physaloptera* spp.、*Thelazia* spp.、*Gongylonema* spp.、*Habronema* spp.、*Parabronema* spp.、*Draschia* spp.、*Dracunculus* spp.；*Stephanofilaria* spp.

、*Parafilaria* spp.、*Setaria* spp.、*Loa* spp.、*Dirofilaria* spp.、*Litomosoides* spp.、*Brugia* spp.、*Wuchereria* spp.、*Onchocerca* spp.、*Spirocerca* spp.である。

【0167】

多くの既知の殺線虫剤は他の寄生性蠕虫類に対しても作用し、よって、*Nematoda*の分類に必ずしも属するわけではないヒトおよび動物内の寄生虫である蠕虫を防除するのにも用いられる。本発明は、式（I）の化合物を駆虫薬として使用することにも関する。病原性内部寄生性蠕虫類としては、*Platyhelminthes*（たとえば、*Monogenea*、条虫類および吸虫類）、*Acanthocephala*および*Pentastoma*が挙げられる。次の蠕虫が、好ましいものとして言及される：

Monogenea：たとえば：*Gyrodactylus* spp.、*Dactylogyrus* spp.、*Polystoma* spp. 10

条虫類：*Pseudophyllidea*目から、たとえば：*Diphyllbothrium* spp.、*Spirometra* spp.、*Schistocephalus* spp.、*Ligula* spp.、*Bothridium* spp.、*Diplogonoporus* spp.、

*Cyclophyllida*目から、たとえば：*Mesocestoides* spp.、*Anoplocephala* spp.、*Paranoplocephala* spp.、*Moniezia* spp.、*Thysanosoma* spp.、*Thysaniezia* spp.、*Avitellina* spp.、*Stilesia* spp.、*Cittotaenia* spp.、*Andrya* spp.、*Bertiella* spp.、*Taenia* spp.、*Echinococcus* spp.、*Hydatigera* spp.、*Davainea* spp.、*Raillietina* spp.、*Hymenolepis* spp.、*Echinolepis* spp.、*Echinocotyle* spp.、*Diorchis* spp.、*Dipylidium* spp.、*Joyeuxiella* spp.、*Diplopylidium* spp.、

吸虫類：*Digenea*綱から、たとえば：*Diplostomum* spp.、*Posthodiplostomum* spp.、*Schistosoma* spp.、*Trichobilharzia* spp.、*Ornithobilharzia* spp.、*Austroilharzia* spp.、*Gigantobilharzia* spp.、*Leucochloridium* spp.、*Brachylaïma* spp.、*Echinostoma* spp.、*Echinoparyphium* spp.、*Echinochasmus* spp.、*Hypoderaeum* spp.、*Fasciola* spp.、*Fascioloides* spp.、*Fasciolopsis* spp.、*Cyclocoelum* spp.、*Typhlocoelum* spp.、*Paramphistomum* spp.、*Calicophoron* spp.、*Cotylophoron* spp.、*Gigantocotyle* spp.、*Fischöderius* spp.、*Gastrothylacus* spp.、*Notocotylus* spp.、*Catantropis* spp.、*Plagiorchis* spp.、*Prosthogonimus* spp.、*Dicrocoelium* spp.、*Eurytrema* spp.、*Trogloitrema* spp.、*Paragonimus* spp.、*Collyriclum* spp.、*Nanophyetus* spp.、*Opisthorchis* spp.、*Clonorchis* spp.、*Metorchis* spp.、*Heterophyes* spp.、*Metagonimus* spp.、 20

Acanthocephala：*Oligacanthorhynchida*目から、たとえば：*Macracanthorhynchus* spp.、*Prosthenorchis* spp.；*Polymorphida*目から、たとえば：*Filicollis* spp.；*Moniliformida*目から、たとえば：*Moniliformis* spp.、 30

*Echinorhynchida*目から、たとえば、*Acanthocephalus* spp.、*Echinorhynchus* spp.、*Leptorhynchoides* spp.、

Pentastoma：*Porocephalida*目から、たとえば、*Linguatula* spp.。

【0168】

獣医学の分野および動物保持において、式（I）の化合物の投与は、公知の方法で、直接または経腸的、非経口的、経皮的にまたは経鼻的に適切な使用形態で実施される。投与は予防的または治療的であってよい。

【0169】

式（I）の化合物は、特定の濃度または適用率で、除草剤、セーフナー、成長調節剤または植物の特性を向上させる剤として、殺微生物剤または殺精剤、たとえば殺真菌剤、抗真菌剤、殺菌剤、抗ウイルス剤（ウィロイドに対する剤を包含する）またはMLO（マイコプラズマ様微生物）およびRLO（リケッチア様微生物）に対する剤としても使用されてもよい。適切な場合は、他の有効成分の合成のための中間体または前駆体としても用いられ得る。 40

【0170】

製剤

本発明はさらに、式（I）の化合物を少なくとも1つ含んでなる製剤、および、当該製剤から殺虫剤として調製した、水薬、点滴およびスプレー液といった使用形態に関する。当該使用形態は、さらに殺虫剤および／または作用を向上させる助剤を含んでなる場合も 50

あり、当該助剤としては、浸透剤、たとえば、ナタネ油、ヒマワリ油といった植物油、パラフィン油といった鉱油、ナタネ油メチルエステルもしくはダイズ油メチルエステルといった植物性脂肪酸のアルキルエステルもしくはアルカノールアルコキシレート、および／または、展着剤、たとえば、アルキルシロキサンおよび／または塩、たとえば有機もしくは無機アンモニウムもしくはホスホニウム塩、たとえば硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウム、および／または、停留プロモーター、たとえば、ジオクチルスルホコハク酸もしくはヒドロキシプロピルグアールポリマー、および／または、湿潤剤、たとえば、グリセロール、および／または、肥料、たとえば、アンモニウム、カリウムもしくはリン含有肥料が挙げられる。

【0171】

従来の製剤は、たとえば、水溶性液体（SL）、乳濁濃縮物（EC）、水中乳濁液（EW）、懸濁濃縮物（SC、SE、FS、OD）、水分散性顆粒（WG）、顆粒（GR）およびカプセル濃縮物（CS）；これらの製剤およびさらなる可能な製剤の種類が、Crop Life Internationalによって、FAO/WHO合同農薬規格会議で定められたPesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, 2004, ISBN: 9251048576で説明されている。1または複数の式（I）の化合物に加え、製剤は農芸化学的に有効な成分をさらに含んでいてもよい。

【0172】

これらは、好ましくは、補助剤、たとえば、増量剤、溶媒、自発促進剤（spontaneity promoters）、担体、乳化剤、分散剤、防霜剤、殺生物剤、増粘剤、および／または、さらなる補助剤、たとえば助剤を含んでなる、製剤または使用形態である。本明細書の文脈における助剤は、それ自体は生物学的作用を有さずに、製剤の生物学的作用を改善する成分である。助剤の例としては、保持、拡散の特性、葉の表面への接着または浸透を促進する剤が挙げられる。

【0173】

これらの製剤は、公知の方法で調製され、たとえば、式（I）の化合物を、増量剤、溶媒および／もしくは固形担体といった補助剤、ならびに／または、界面活性剤といった他の補助剤と混合することで調製される。製剤は、適切な施設で生産されるか、適用前または適用中に生産されるかのいずれかである。

【0174】

使用される補助剤は、特定の物理的、工業的、および／または生物学的特性といった特別な特性を、式（I）の化合物の製剤またはこれら製剤から調製される使用形態（たとえば、スプレー液または種子粉衣製品といった使用準備済み殺虫剤）に付与するのに適切な物質であり得る。

【0175】

適切な増量剤は、たとえば、水、極性および非極性有機液体薬品、たとえば、芳香性および非芳香族炭化水素類（パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼンといった）の分類から、アルコールおよびポリオール（適切な場合、これらは置換、エーテル化および／またはエステル化されてもよい）、ケトン（アセトン、シクロヘキサノンといった）、エステル（油脂を包含する）および（ポリ）エーテル、非置換および置換アミン、アミド、ラクタム（N-アルキルピロリドンといった）およびラクトン、スルホンおよびスルホキシド（ジメチルスルホキシドといった）である。

【0176】

使用する増量剤が水の場合、たとえば有機溶媒を補助溶媒として使用することも可能である。有用な液体溶媒としては本質的に：キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンといった芳香族化合物、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンといった塩化芳香族化合物または塩化脂肪族炭化水素、シクロヘキササンまたはパラフィンといった脂肪族炭化水素、たとえば、鉱油画分、鉱油および植物油、ブタノールまたはグリコールといったアルコールおよびそ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、

10

20

30

40

50

メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンといったケトン、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドといった強極性溶媒、または水が挙げられる。

【0177】

原則、あらゆる適切な溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例としてはキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンといった芳香族炭化水素、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンといった塩化芳香族または脂肪族炭化水素、シクロヘキサン、パラフィン、鉱油画分、鉱油および植物油といった脂肪族炭化水素、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールまたはグリコールといったアルコールおよびそ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ノンといったケトン、ジメチルスルホキシドといった強極性溶媒、または水が挙げられる。

10

【0178】

原則、すべての適切な担体を使用することが可能である。有用な担体としてはとりわけ：たとえば、アンモニウム塩、および、カオリン、アルミナ、タルク、チョーク、クオーツ、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土といった天然の岩粉、および、細かく砕かれたシリカ、酸化アルミニウムといった合成岩粉、および、天然または合成のケイ酸塩、樹脂、ろうおよび／または固形肥料が挙げられる。そのような担体の混合物も同様に使用され得る。顆粒に有用な担体としては：たとえば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、および、無機および有機粉末の合成顆粒を粉砕および分画化した天然岩、および、おがくず、紙、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸およびタバコ茎といった有機材料の顆粒が挙げられる。

20

【0179】

液化性気体増量剤または溶媒を使用することも可能である。とりわけ適切なのは、標準温度および標準圧力で気体である増量剤または担体、たとえば、ハロ炭化水素といったエアロゾル噴霧剤、またはブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素である。

【0180】

イオンもしくは非イオン特性を有する乳化剤および／もしくは発泡剤、分散剤または浸潤剤またはこれら界面活性物質の混合物は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと、脂肪アルコールまたは脂肪酸または脂肪アミン、置換フェノール（好ましくはアルキルフェノールまたはアリールフェノール）の重縮合物、スルホンこはく酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはアルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールまたはフェノール類のリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、スルフェート、スルホネートおよびフォスフェート含有化合物の誘導体、たとえばアルキルアリールポリグリコールエーテル、スルホン酸アルキル、硫酸アルキル、スルホン酸アリール、タンパク水解物、リグノスルファイト廃液（lignosulphite waste liquors）、および、メチルセルロースである。界面活性剤の存在は、式（I）の化合物のうち1つおよび／または不活性担体のうち1つが水に難溶性であり、および、その適用が水中で起こる場合に効果的である。

30

【0181】

製剤および製剤に由来する使用形態に存在し得るさらなる補助剤は染料であり、たとえば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシャンプルーといった無機顔料、ならびに、アリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン色素といった有機染料、ならびに、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といった栄養素および微量栄養素である。

40

【0182】

さらに、低温安定化剤といった安定化剤、保存剤、酸化防止剤、光安定化剤、または、化学的および／もしくは物理的安定性を高める他の剤が存在し得る。さらに、発泡剤または消泡剤が存在し得る。

【0183】

さらに、製剤および製剤に由来する使用形態はまた、追加補助剤として、カルボキシメ

50

チルセルロースならびに粉末、顆粒またはラテックスの形態であるアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなどの天然および合成ポリマーといった固着剤、または、セファリンおよびレシチンといった天然リン脂質、ならびに、合成リン脂質を含んでなっている。さらに可能な補助剤は、鉱油および植物油である。

【0184】

任意で、さらなる補助剤が製剤および製剤に由来する使用形態に存在し得る。そのような添加剤の例としては、香料、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロップ剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、捕捉剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤が挙げられる。一般的に、式（I）の化合物は、製剤目的で通常使用されるいずれかの固形または液体添加剤と組合せられ得る。

10

【0185】

有用な保持促進剤には、ジオクチルスルホスクシネートといった動力学的表面張力を低減する全ての物質、または、ヒドロキシプロピルグアールポリマーといった、粘弾性を増大する全ての物質が包含される。

【0186】

有用な浸透剤は、本明細書の文脈では、農芸化学的に有効な成分の植物内への浸透を改善するのに通常用いられる全ての物質である。本明細書の文脈では、浸透剤は、（通常水性）適用液および／またはスプレーコーティングから植物のクチクラへ浸透し、したがってクチクラ内での有効成分の移動を高める能力によって定義される。文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）で説明される、この特性を決定する方法を用い得る。例としては、アルコールアルコキシレート、たとえばココナッツ脂肪エトキシレート（coconut fatty ethoxylate）（10）またはイソトリデシルエトキシレート（12）、脂肪酸エステル、たとえばナタネ油メチルエステルもしくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート（15）、または、アンモニウム塩および／もしくはホスホニウム塩、たとえば、硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウムが挙げられる。

20

【0187】

製剤は、好ましくは、製剤の重量に対して、0.00000001重量%および98重量%の間の式（I）の化合物、より好ましくは0.01重量%および95重量%の間の式（I）の化合物、最も好ましくは0.5重量%および90重量%の間の式（I）の化合物を含んでなる。

30

【0188】

製剤から調製される使用形態（特に殺虫剤）における式（I）の化合物の含量は、幅広い範囲内で異なり得る。使用形態中の式（I）の化合物の濃度は、通常、使用形態の重量に対して、0.00000001重量%および95重量%の式（I）の化合物、好ましくは0.00001重量%および1重量%であり得る。適用は、使用形態に適切な従来の方法で達成される。

【0189】

混合物

式（I）の化合物はまた、たとえば作用の範囲を広げるため、作用の期間を長くするため、作用の速度を向上するため、反発性を防ぐため、または、耐性の進化を防ぐために、1または複数の適切な殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物学剤、有益な有機体、除草剤、肥料、鳥よけ剤、植物強壮剤（phytonics）、滅菌剤、セーフナー、信号化学物質および／または植物成長調節剤との混合物中で使用されてもよい。さらに、この種類の有効成分の組合せは、植物の成長を促進し得、および／または、たとえば高温もしくは低温、かんばつ、もしくは、水分または土壌塩分の上昇といった非生物学的要因への耐性を向上し得る。開花および結実の出来を高め、発芽能力および根の発達を最適化し、収穫を促進および収穫率を高め、成熟に影響を与え、収穫産物の質および／もしくは栄養価を高め、保管期を長くし、ならびに／または収穫産物の処理可能性を高めることも可能である。

40

50

【0190】

さらに、式（I）の化合物は、他の有効成分または誘引物質および／もしくは鳥忌避物質といった信号化学物質および／または植物活性化剤および／または成長調節剤および／または肥料との混合物中に存在し得る。同様に、式（I）の化合物は、植物の特性、たとえば成長、収穫率および収穫物の質を高める剤との混合物で使用してもよい。

【0191】

本発明の具体的な実施態様では、式（I）の化合物は、さらなる化合物、好ましくは以下の化合物との混合物中で、製剤の形態またはその製剤から調製された使用形態である。

【0192】

以下の化合物のうち1つが各種互変異性形態で生じる場合、各場合で明確に記されていなくても、これらの形態も包含される。

【0193】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

本明細書でその一般名で明記する有効成分は公知のものであり、たとえば、"The Pesticide Manual", 16th ed., British Crop Protection Council 2012に記載されており、または、インターネットで検索可能である（たとえば、<http://www.alanwood.net/pesticides>）。

【0194】

（1）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害剤、たとえば、カルバメート、たとえば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、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；または有機リン化合物、たとえば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトアート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピルO-（メトキシアミノチオホスホリル）サリチラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトンメチル、パラチオン、パラチオンメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロピタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロロビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロロホンおよびバミドチオン。

【0195】

（2）GABA開閉系（GABA-gated）塩素イオンチャンネルのアンタゴニスト、たとえば、シクロジエン有機塩素、たとえばクロルデンおよびエンドサルファンまたはフェニルピラゾール（フィプロール）、たとえば、エチプロールおよびフィプロニル。

【0196】

（3）ナトリウムチャンネル修飾物質／電位開口型ナトリウムチャンネル遮断剤、たとえば、ピレスロイド、たとえば、アクリナトリン、アレスリン、d-cis-ートランスアレスリン、d-ートランスアレスリン、ビフェントリン、ビオアレトリン、ビオアレトリンs-シクロペンテニル異性体、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータシフルトリン、シハロトリン、ラムダシハロトリン、ガンマシハロトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ベータシペルメトリン、シータシペルメトリン、ゼータシペルメトリン、シフェノトリン〔（1R）-ートランス異性体〕、デルタメトリン、エンペ

10

20

30

40

50

ントリン〔(E Z)－(1 R)異性体〕、エスファンバレレート、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、フルメトリン、タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、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〔(1 R)－トランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン (ジョチュウギク)、レスメスリン、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〔(1 R)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、メトキシクロル。

【0197】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) のアゴニスト、たとえば、ネオニコチノイド、たとえば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリドおよびチアメトキサムまたはニコチン、または、スルホキサフロール。

10

【0198】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) のアロステリック活性化剤、たとえば、スピノシン、たとえば、スピネトラムおよびスピノサド。

【0199】

(6) 塩素イオンチャネル活性化剤、たとえば、アベルメクチン／ミルベマイシン、たとえば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチンおよびミルベメクチン。

【0200】

(7) 幼虫ホルモン模倣物質、たとえば、幼虫ホルモン類似体たとえば、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。

20

【0201】

(8) 未知または非特異的な作用機構を有する有効成分、たとえばアルキルハロゲン化物、たとえば、臭化メチルおよび他のアルキルハロゲン化物；またはクロロピクリン (chloropicrine) またはフッ化スルフリル、またはホウ砂、または、吐酒石。

【0202】

(9) 選択的摂食阻害剤、たとえば、ピメトロジンまたはフロニカミド。

【0203】

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

30

【0204】

(11) 昆虫腸膜の微生物かく乱物質、たとえば、*Bacillus thuringiensis* 亜種 *israelensis*、*Bacillus sphaericus*、*Bacillus thuringiensis* 亜種 *aizawai*、*Bacillus thuringiensis* 亜種 *kurstaki*、*Bacillus thuringiensis* 亜種 *tenebrionis* および B T 植物タンパク質：

Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34／35Ab1。

【0205】

(12) 酸化的リン酸化反応阻害剤、ATPかく乱物質、たとえば、ジアフェンチウロンまたは有機スズ化合物、たとえば、アゾシクロチン、シヘキサチンおよび酸化フェンブタスズ、またはプロパルギット、またはテトラジホン。

40

【0206】

(13) Hプロトンの勾配を妨害する酸化的リン酸化反応脱共役剤、たとえば、クロルフェナピル、DNOCおよびスルフルアミド。

【0207】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体アンタゴニスト、たとえば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラムおよびチオスルタップナトリウム (thiosultap-sodium)。

【0208】

(15) キチン生合成阻害剤、タイプ0、たとえば、ビストリフルロン、クロルフルア

50

ズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロン。

【0209】

(16) キチン生合成成阻害剤、タイプ1、たとえば、ブプロフェジン。

【0210】

(17) 脱皮阻害剤（とりわけDiptera、すなわち、双翅類に関して）、たとえば、シロマジン。

【0211】

(18) エクジソン受容体のアゴニスト、たとえば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジド。

10

【0212】

(19) オクトパミン性アゴニスト、たとえば、アミトラズ。

【0213】

(20) 複合体 I I I 電子伝達阻害剤、たとえば、ヒドラメチルノンまたはアセキノシルまたはフルアクリピリム。

【0214】

(21) 複合体 I 電子伝達阻害剤、たとえば、METI 殺ダニ剤、たとえば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、およびトルフェンピラド、または、ロテノン（デリス）。

20

【0215】

(22) 電位開口型ナトリウムチャネル遮断物質、たとえば、インドキサカルブまたはメタフルミゾン。

【0216】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、たとえば、テトロロンおよびテトラミン酸の誘導体、たとえば、スピロジクロフェン、スピロメシフェンおよびスピロテトラマト。

【0217】

(24) 複合体 I V 電子伝達阻害剤、たとえば、ホスフィン、たとえば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、およびリン化亜鉛、または、シアン化物。

30

【0218】

(25) 複合体 I I 電子伝達阻害剤、たとえば、シエノピラフェンおよびシフルメトフェン。

【0219】

(28) リアノジン受容体エフェクター、たとえば、ジアミド、たとえば、クロルアントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミド、さらなる有効成分、たとえば、アフィドピロペン、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート (chinomethionat)、氷晶石、ジコホール、ジフロビダジン、フルエンズルホン、フロメトキン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、フルフィプロル、フルオピラム、フルピラジフロロン、フフェノジド、ヘプタフルトリン (heptafluthrin)、イミダクロチズ (imidaclothiz)、イプロジオン、メペルフルトリン (meperfluthrin)、パイコングジグ (paichongding)、ピフルブミド、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルトリン (tetramethylfluthrin) およびヨードメタン; *Bacillus firmus* を基にした調製物 (I-1582、BioNeem、Votivo)、および、以下の化合物: 3-ブromo-N-{2-ブromo-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (W02005/077934により公知) および 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 (W02006/043

40

50

635により公知)、{1'-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エン-1-イル]-5-フルオロスピロ[インドール-3, 4'-ピペリジン]-1(2H)-イル}(2-クロロピリジン-4-イル)メタノン(WO2003/106457により公知)、2-クロロ-N-[[2-{1'-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エン-1-イル]ピペリジン-4-イル}-4-(トリフルオロメチル)フェニル]イソニコチンアミド(WO2006/003494により公知)、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ[4. 5]デカ-3-エン-2-オン(WO2009/049851により公知)、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ[4. 5]デカ-3-エン-4-イル-エチルカルボネート(WO2009/049851により公知)、4-(ブタ-2-イン-1-イルオキシ)-6-(3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル)-5-フルオロピリミジン(WO2004/099160により公知)、4-(ブタ-2-イン-1-イルオキシ)-6-(3-クロロフェニル)ピリミジン(WO2003/076415により公知)、PF1364(CAS登録番号1204776-60-2)、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(WO2005/085216により公知)、4-{5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)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}-N-{2-オキソ-2-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ]エチル}-1-ナフトアミド(WO2009/002809により公知)、メチル2-[2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-クロロ-3-メチルベンゾイル]-2-メチル-ヒドラジンカルボキシレート(WO2005/085216により公知)、メチル2-[2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボキシレート(WO2005/085216により公知)、メチル2-[2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-5-シアノ-3-メチルベンゾイル]-2-メチルヒドラジンカルボキシレート(WO2005/085216により公知)、メチル2-[3, 5-ジプロモ-2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル]-2-エチルヒドラジンカルボキシレート(WO2005/085216により公知)、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(WO2010/069502により公知)、N-[2-(5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(CN102057925により公知)、3-クロロ-N-(2-シアノプロパン-2-イル)-N-[4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-2-メチルフェニル]フタルアミド(WO2012/034472により公知)、8-クロロ-N-[(2-クロロ-5-メトキシフェニル)スルホニル]-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-2-カルボキサミド(WO2010/129500により公知)、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキシドチエタン-3-イル)ベンズアミド(WO2009/080250により公知)、4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキシドチエタン-3-イル)ベンズアミド(WO2012/029672により公知)、1-[(2-クロロ-1, 3-チアゾール-5-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド[1, 2-a]ピリミジン-1-イウム-2-オレート(WO2009/099929により公知)、1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド[1, 2-a]ピリミジン-1-イウ

10

20

30

40

50

ム-2-オレート (W02009/099929により公知)、(5 S, 8 R)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-9-ニトロ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1 H-5, 8-エポキシイミダゾ [1, 2-a] アゼピン (W02010/069266により公知)、(2 E)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-N'-ニトロ-2-ペンチリデンヒドラジン-カルボキシイミドアミド (W02010/060231により公知)、4-(3-{2, 6-ジクロロ-4-[(3, 3-ジクロロプロプ-2-エン-1-イル)オキシ]フェノキシ}プロポキシ)-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン (CN101337940により公知)、N-[2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-(フルオロメトキシ)-1 H-ピラゾール-5-カルボキサミド (W02008/134969により公知)。

10

【0220】

殺真菌剤

本明細書でその一般名で明記する有効成分は公知のものであり、たとえば、"Pesticide Manual"、または、インターネット (たとえば：<http://www.alanwood.net/pesticides>) に記載されている。

【0221】

(1) エルゴステロール生合成阻害剤、たとえば (1. 1) アルジモルフ (aldimorph)、(1. 2) アザコナゾール (azaconazole)、(1. 3) ビテルタノール、(1. 4) ブロムコナゾール (bromuconazole)、(1. 5) シプロコナゾール、(1. 6) ジクロブトラゾール (diclobutrazole)、(1. 7) ジフェノコナゾール、(1. 8) ジニコナゾール、(1. 9) ジニコナゾールM、(1. 10) ドデモルフ (dodemorph)、(1. 11) 酢酸ドデモルフ、(1. 12) エポキシコナゾール (epoxiconazole)、(1. 13) エタコナゾール、(1. 14) フェナリモル (fenarimol)、(1. 15) フェンブコナゾール、(1. 16) フェンヘキサミド、(1. 17) フェンプロピジン (fenpropidin)、(1. 18) フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、(1. 19) フルキンコナゾール (fluquinconazole)、(1. 20) フルルプリミドール、(1. 21) フルシラゾール、(1. 22) フルトリアフォール (flutriafole)、(1. 23) ファーコナゾール (furconazole)、(1. 24) ファーコナゾール-c i s、(1. 25) ヘキサコナゾール、(1. 26) イマザリル、(1. 27) 硫酸イマザリル、(1. 28) イミベンコナゾール、(1. 29) イブコナゾール、(1. 30) メトコナゾール、(1. 31) ミクロブタニル、(1. 32) ナフチフィン (naftifin)、(1. 33) ヌアリモール、(1. 34) オキスポコナゾール、(1. 35) パクロブトラゾール (paclobutrazole)、(1. 36) ペフラゾエート、(1. 37) ペンコナゾール、(1. 38) ピペラリン (piperalin)、(1. 39) プロクロラズ、(1. 40) プロピコナゾール、(1. 41) プロチオコナゾール、(1. 42) ピリブチカルブ、(1. 43) ピリフェノックス、(1. 44) キンコナゾール (quinconazole)、(1. 45) シメコナゾール、(1. 46) スピロキサミン (spiroxamine)、(1. 47) テブコナゾール、(1. 48) テルビナフィン (terbinafin)、(1. 49) テトラコナゾール、(1. 50) トリアジメホン、(1. 51) トリアジメノール、(1. 52) トリデモルフ (tridemorph)、(1. 53) トリフルミゾール、(1. 54) トリホリン、(1. 55) トリチコナゾール (triticonazole)、(1. 56) ウニコナゾール、(1. 57) ウニコナゾールP、(1. 58) ビニコナゾール (viniconazole)、(1. 59) ボリコナゾール (voriconazole)、(1. 60) 1-(4-クロロフェニル)-2-(1 H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、(1. 61) メチル1-(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1 H-インデン-1-イル)-1 H-イミダゾール-5-カルボキシレート、(1. 62) N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1. 63) N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミドおよび (1. 64) O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イ

20

30

40

50

ル] - 1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1.65)ピリソキサゾール。

【0222】

(2)呼吸阻害剤(呼吸鎖阻害剤)、たとえば、(2.1)ビキサフェン、(2.2)ボスカリド、(2.3)カルボキシシン、(2.4)ジフルメトリム、(2.5)フェンフルラム(fenfuram)、(2.6)フルオピラム(fluopyram)、(2.7)フルトラニル、(2.8)フルキサピロキサド、(2.9)フラメトピル、(2.10)フルメシクロックス(furmecyclox)、(2.11)syn-エピマーラセミ体1RS、4SR、9RSおよびant i-エピマーラセミ体1RS、4SR、9SRのイソピラザム(isopyrazam)混合物、(2.12)イソピラザム(ant i-エピマーラセミ体)、(2.13)イソピラザム(ant i-エピマー鏡像異性体1R、4S、9S)、(2.14)イソピラザム(ant i-エピマー鏡像異性体1S、4R、9R)、(2.15)イソピラザム(syn-エピマーラセミ体1RS、4SR、9RS)、(2.16)イソピラザム(syn-エピマー鏡像異性体1R、4S、9R)、(2.17)イソピラザム(syn-エピマー鏡像異性体1S、4R、9S)、(2.18)メプロニル、(2.19)オキシカルボキシシン、(2.20)ペンフルフェン、(2.21)ペンチオピラド、(2.22)セダキサシン(sedaxane)、(2.23)チフルザミド、(2.24)1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.25)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.26)3-(ジフルオロメチル)-N-[4-フルオロ-2-(1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ)フェニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.27)N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.28)5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2.29)ベンゾビンジフルピル、(2.30)N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドおよび(2.31)N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.32)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.33)1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.34)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.35)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.36)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.37)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.38)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.39)1,3,5-トリメチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.40)1,3,5-トリメチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボ

キサミド、(2. 41) ベノダニル (benodanil)、(2. 42) 2-クロロ-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(2. 43) イソフェタミド。

【0223】

(3) 呼吸鎖複合体 I I I に作用する呼吸阻害剤 (呼吸鎖阻害剤)、たとえば、(3. 1) アメトクトラジン、(3. 2) アミスルブロム、(3. 3) アゾキシストロビン、(3. 4) シアゾファミド、(3. 5) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3. 6) クモキシストロビン (coumoxystrobin)、(3. 5) ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、(3. 8) エネストロブリン (enestroburin)、(3. 9) ファモキサドン、(3. 10) フェンアミドン、(3. 11) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3. 12) フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、(3. 13) クレソキシムメチル、(3. 14) メトミノストロビン、(3. 15) オリサストロビン、(3. 16) ピコキシストロビン (picoxystrobin)、(3. 17) ピラクロストロビン、(3. 18) ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、(3. 19) ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、(3. 20) ピリベンカルブ (pyribencarb)、(3. 21) トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)、(3. 22) トリフロキシストロビン、(3. 23) (2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3. 24) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル)フェニルエタンアミド、(3. 25) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタンアミド、(3. 26) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルエチル]オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ}オキシ}メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3. 27) (2E)-2-{2-[(2E, 3E)-4-(2, 6-ジクロロフェニル)ブター-3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ}メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3. 28) 2-クロロ-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(3. 29) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]アミノ]オキシ}メチル)フェニル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン、(3. 30) メチル(2E)-2-{2-[(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル]スルファニル)メチル]フェニル}-3-メトキシプロプ-2-エノエート、(3. 31) N-(3-エチル-3, 5, 5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベンズアミド、(3. 32) 2-{2-[(2, 5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド。

【0224】

(4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、たとえば、(4. 1) ベノミル、(4. 2) カルベンダジム、(4. 3) クロルフェナゾール (chlorfenazole)、(4. 4) ジエトフェンカルブ、(4. 5) エタボキサム (ethaboxam)、(4. 6) フルピコリド、(4. 7) フベリダゾール (fuberidazole)、(4. 8) ペンシクロン、(4. 9) チアベンダゾール、(4. 10) チオファネート-メチル、(4. 11) チオファネート、(4. 12) ゾキサミド (zoxamide)、(4. 13) 5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジンおよび(4. 14) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリダジン。

【0225】

(5) 多部位で活性を有する化合物、たとえば、(5. 1) ボルドー液、(5. 2) カ

ブタホール、(5. 3) キャプタン、(5. 4) クロロタロニル、(5. 5) 水酸化銅といった銅調製物、(5. 6) ナフテン酸銅、(5. 7) 酸化銅、(5. 8) 酸塩化銅、(5. 9) 硫酸銅、(5. 10) ジクロフルアニド、(5. 11) ジチアノン、(5. 12) ドジン、(5. 13) ドジン遊離塩基、(5. 14) ファーバム、(5. 15) フルオルフォルベット (fluorfolpet)、(5. 16) フォルベット、(5. 17) グアザチン、(5. 18) 酢酸グアザチン、(5. 19) イミノクタジン、(5. 20) イミノクタジンアルベシル酸塩、(5. 21) イミノクタジン三酢酸塩、(5. 22) マンカップパー (mancopper)、(5. 23) マンコゼブ、(5. 24) マンネブ、(5. 25) メチラム、(5. 26) 亜鉛メチラム、(5. 27) オキシシン銅、(5. 28) プロパミジン、(5. 29) プロピネブ、(5. 30) 硫黄および多硫化カルシウムといった硫黄調製物、(5. 31) サイラム、(5. 32) トリルフルアニド、(5. 33) ジネブ、(5. 34) ジラムおよび(5. 35) アニラジン。

【0226】

(6) 耐性誘引物質、たとえば、(6. 1) アシベンゾラーS-メチル、(6. 2) イソチアニル (isotianil)、(6. 3) プロベナゾール、(6. 4) チアジニルおよび(6. 5) ラミナリン。

【0227】

(7) アミノ酸およびタンパク質生合成阻害剤、たとえば、(7. 1)、(7. 2) ブラスタサイジン-S、(7. 3) シプロジニル、(7. 4) カスガマイシン、(7. 5) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7. 6) メパニピリム、(7. 7) ピリメタニル、(7. 8) 3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリンおよび(7. 9) オキシテトラサイクリンおよび(7. 10) ストレプトマイシン。

【0228】

(8) ATP生産阻害剤、たとえば、(8. 1) フェンチンアセテート、(8. 2) フェンチンクロリド (fentin chloride)、(8. 3) フェンチンヒドロキシド (fentin hydroxide) および(8. 4) シルチオフアム (silthiofam)。

【0229】

(9) 細胞壁合成阻害剤、たとえば、(9. 1) ベンチアバリカルブ、(9. 2) ジメトモルフ、(9. 3) フルモルフ (flumorph)、(9. 4) イプロバリカルブ、(9. 5) マンジプロバミド、(9. 6) ポリオキシシン、(9. 7) ポリオクソリム (polyoxorim)、(9. 8) バリダマイシンA、(9. 9) バリフェナレートおよび(9. 10) ポリオキシシンB。

【0230】

(10) 脂質および膜合成阻害剤、たとえば、(10. 1) ビフェニル、(10. 2) クロルネブ (chlorneb)、(10. 3) ジクロラン、(10. 4) エディフェンホス、(10. 5) エトリジアゾール、(10. 6) ヨードカルブ (iodocarb)、(10. 7) イプロベンホス、(10. 8) イソプロチオラン、(10. 9) プロバモカルブ、(10. 10) プロバモカルブ塩酸塩、(10. 11) プロチオカルブ (prothiocarb)、(10. 12) ピラゾホス、(10. 13) キントゼン、(10. 14) テクナゼンおよび(10. 15) トルクロホスメチル。

【0231】

(11) メラニン生合成阻害剤、たとえば、(11. 1) カルプロバミド、(11. 2) ジクロシメット、(11. 3) フェノキサニル、(11. 4) フサライド、(11. 5) ピロキロン (pyroquilon)、(11. 6) トリシクラゾールおよび(11. 7) 2, 2, 2-トリフルオロエチル {3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル) アミノ] ブタン-2-イル} カルバメート。

【0232】

(12) 核酸合成阻害剤、たとえば、(12. 1) ベナラキシル、(12. 2) ベナラキシルM (キララキシル (kiralaxyl))、(12. 3) ブピリメート (bupirimate)、

10

20

30

40

50

(12.4) クロジラコン (clozylacon)、(12.5) ジメチリモール、(12.6) エチリモール、(12.7) フララキシル (furalaxyl)、(12.8) ヒメキサゾール (hymexazole)、(12.9) メタラキシル、(12.10) メタラキシルM (メフェノキサム)、(12.11) オフレース (ofurace)、(12.12) オキサジキシル、(12.13) オキシリン酸および(12.14) オクチリノン。

【0233】

(13) 情報伝達阻害剤、たとえば、(13.1) クロゾリネート、(13.2) フェンピクロニル、(13.3) フルジオキシニル、(13.4) イプロジオン、(13.5) プロシミドン、(13.6) キノキシフェン、(13.7) ピンクロゾリンおよび(13.8) プロキナジド。

【0234】

(14) 脱共役剤、たとえば、(14.1) ビナバクリル、(14.2) ジノカップ、(14.3) フェリムゾン、(14.4) フルアジナムおよび(14.5) メブチルジノカップ。

【0235】

(15) さらなる化合物、たとえば、(15.1) ベンチアゾール、(15.2) ベトキサジン (bethoxazine)、(15.3) カプシマイシン (capsimycin)、(15.4) カルボン、(15.5) キノメチオナート、(15.6) ピリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15.7) クフラネブ (cufraneb)、(15.8) シフルフェナミド、(15.9) シモキサニル、(15.10) シプロスルファミド、(15.11) ダゾメット、(15.12) デバカルブ (debacarb)、(15.13) ジクロロフェン (dichlorophen)、(15.14) ジクロメジン、(15.15) ジフェンゾコート、(15.16) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15.17) ジフェニルアミン、(15.18) E c o M a t e、(15.19) フェンピラザミン、(15.20) フルメトベル (flumetover)、(15.21) フルオリミド (fluorimid)、(15.22) フルスルファミド、(15.23) フルチアニル、(15.24) ホセチルアルミニウム、(15.25) ホセチルカルシウム、(15.26) ホセチルナトリウム、(15.27) ヘキサクロロベンゼン、(15.28) イルママイシン (irumamycin)、(15.29) メタスルホカルブ (methasulfocarb)、(15.30) イソチオシアン酸メチル、(15.31) メトラフェノン、(15.32) ミルディオマイシン (mildiomycin)、(15.33) ナタマイシン、(15.34) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.35) ニトロタールイソプロピル、(15.36) オクチリノン (octhilinone)、(15.37) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15.38) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15.39) ペンタクロロフェノールおよびその塩、(15.40) フェノトリン、(15.41) リン酸およびその塩、(15.42) プロパモカルブホセチレート (propamocarb-fosetylalte)、(15.43) プロパノシンナトリウム (propanosine-sodium)、(15.44) ピリモルフ (pyrimorph)、(15.45) (2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロプ-2-エン-1-オン、(15.46) (2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロプ-2-エン-1-オン、(15.47) ピロルニトリン、(15.48) テブフロキン、(15.49) テクロフタラム、(15.50) トルニファニド、(15.51) トリアゾキシド、(15.52) トリクラミド、(15.53) ザリラミド (zarilamid)、(15.54) (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4, 9-ジオキソ-1, 5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパノエート、(15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.56) 1-(4-{4-[

10

20

30

40

50

(5S) - 5 - (2, 6-ジフルオロフェニル) - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] - 1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) - 2 - [5-メチル-3-(トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15. 57) 1 - (4 - {4 - [5 - (2, 6-ジフルオロフェニル) - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] - 1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) - 2 - [5-メチル-3-(トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] エタノン、(15. 58) 1 - (4-メトキシフェノキシ) - 3, 3-ジメチルブタン-2-イル 1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15. 59) 2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル) ピリジン、(15. 60) 2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ [2, 3-d] ピリミジン-4 (3H) - オン、(15. 61) 2, 6-ジメチル-1H, 5H - [1, 4] ジチイノ [2, 3-c : 5, 6-c'] ジピロール-1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テトロン、(15. 62) 2 - [5-メチル-3-(トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] - 1 - (4 - {4 - [(5R) - 5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] - 1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15. 63) 2 - [5-メチル-3-(トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] - 1 - (4 - {4 - [(5S) - 5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル] - 1, 3-チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15. 64) 2 - [5-メチル-3-(トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] - 1 - {4 - [4 - (5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル) - 1, 3-チアゾール-2-イル] ピペリジン-1-イル} エタノン、(15. 65) 2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15. 66) 2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル) - 4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル] ピリジン、(15. 67) 2-フェニルフェノールおよび塩、(15. 68) 3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル) キノリン、(15. 69) 3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボニトリル、(15. 70) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル) - 4-(2, 6-ジフルオロフェニル) - 6-メチルピリダジン、(15. 71) 4-(4-クロロフェニル) - 5-(2, 6-ジフルオロフェニル) - 3, 6-ジメチルピリダジン、(15. 72) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15. 73) 5-クロロ-N'-フェニル-N'-(プロプ-2-イン-1-イル) チオフェン-2-スルホヒドラジド、(15. 74) 5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 75) 5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 76) 5-メチル-6-オクチル [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン-7-アミン、(15. 77) エチル (2Z) - 3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリレート、(15. 78) N' - (4 - { [3 - (4-クロロベンジル) - 1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル] オキシ} - 2, 5-ジメチルフェニル) - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 79) N - (4-クロロベンジル) - 3 - [3-メトキシ-4-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15. 80) N - [(4-クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3-メトキシ-4-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15. 81) N - [(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル) メチル] - 2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15. 82) N - [1 - (5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル) エチル] - 2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15. 83) N - [1 - (5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル) エチル] - 2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、(15. 84) N - {(E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフルオロメトキシ) - 2, 3-ジフルオロフェニル] メチル} - 2-フェニルアセトアミド、(15. 85) N - {(Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフルオロメトキシ) - 2, 3-ジフルオロフェニル] メチル} - 2-フェニルアセトアミド、(15. 86) N' - {4 - [

10

20

30

40

50

(3-tert-ブチル-4-シアノ-1, 2-チアゾール-5-イル) オキシ] - 2-クロロ-5-メチルフェニル} - N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 87) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル) - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15. 88) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N-[(1R)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル] - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15. 89) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル) - N-[(1S)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル] - 1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15. 90) ペンチル{6-[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ}メチル}ピリジン-2-イル}カルバメート、(15. 91) フェナジン-1-カルボン酸、(15. 92) キノリン-8-オール、(15. 93) キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15. 94) tert-ブチル{6-[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ}メチル}ピリジン-2-イル}カルバメート、(15. 95) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 96) N-(4'-クロロビフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 97) N-(2', 4'-ジクロロビフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 98) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 99) N-(2', 5'-ジフルオロビフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 100) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(プロプ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 101) 5-フルオロ-1, 3-ジメチル-N-[4'-(プロプ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 102) 2-クロロ-N-[4'-(プロプ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15. 103) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 104) N-[4'-(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-5-フルオロ-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 105) 3-(ジフルオロメチル)-N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 106) N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)-5-フルオロ-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 107) 2-クロロ-N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)ニコチンアミド、(15. 108) 2-クロロ-N-[4'-(3, 3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15. 109) 4-(ジフルオロメチル)-2-メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1, 3-チアゾール-5-カルボキサミド、(15. 110) 5-フルオロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 111) 2-クロロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15. 112) 3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カル

10

20

30

40

50

ボキサミド、(15. 113) 5-フルオロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチル
 ブター-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 114) 2-クロロ-N-[4'-(3-メトキシ
 -3-メチルブター-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(1
 5. 115) (5-プロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2, 3,
 4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン、(15. 116) N-[2-(4-
 { [3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-イン-1-イル] オキシ} -3-メトキシ
 フェニル)エチル]-N2-(メチルスルホニル)バリンアミド、(15. 117) 4-
 オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15. 118) ブター-3-
 イン-1-イル{6-[({ [(Z)- (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) 10
 (フェニル)メチレン] アミノ} オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、
 (15. 119) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性型: 4-
 アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15. 120) プロピル3,
 4, 5-トリヒドロキシベンゾエート、(15. 121) 1, 3-ジメチル-N-(1,
 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 122) 1, 3-ジメチル-N-[(3R)-1, 1,
 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 123) 1, 3-ジメチル-N-[(3S)-1, 1,
 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 124) [3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)- 20
 5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-
 3-イル)メタノール、(15. 125) (S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフ
 ェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル](
 ピリジン-3-イル)メタノール、(15. 126) (R)-[3-(4-クロロ-2-
 フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4
 -イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(15. 127) 2-{ [3-(2-クロ
 ロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-
 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 128) 1
 -{ [3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-
 2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1 30
 5. 129) 5-(アリルスルファニル)-1-{ [3-(2-クロロフェニル)-2-
 (2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール、(15. 130) 2-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロ
 キシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2,
 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 131) 2-{ [rel (2R, 3S)-3-
 (2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル
]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15
 . 132) 2-{ [rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-
 ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1
 , 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 133) 1-{ [rel (2R, 3S) 40
 -3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-
 イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(15.
 134) 1-{ [rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-
 ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾ
 ール-5-イルチオシアネート、(15. 135) 5-(アリルスルファニル)-1-{ [
 rel (2R, 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニ
 ル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(15. 13
 6) 5-(アリルスルファニル)-1-{ [rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフ
 ェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H
 -1, 2, 4-トリアゾール、(15. 137) 2-[(2S, 4S, 5S)-1-(2

10

20

30

40

50

, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 138) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 139) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 140) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 141) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 142) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 143) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 144) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 145) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(15. 146) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15. 147) 2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15. 148) 3-(4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15. 149) アブシジン酸、(15. 150) 3-(ジフルオロメチル)-N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)プロパン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 151) N'-[5-プロモ-6-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 152) N'-{5-プロモ-6-[1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 153) N'-{5-プロモ-6-[(1R)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 154) N'-{5-プロモ-6-[(1S)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 155) N'-{5-プロモ-6-[(cis-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 156) N'-{5-プロモ-6-[(trans-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 157) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イロプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 158) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 159) N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 160) N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 161) N-(5-クロロ-2-イロプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4

10

20

30

40

50

ーカルボキサミド、(15. 162) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-
 N-(2-エチル-5-フルオロベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 163) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメ
 チル)-5-フルオロ-N-(5-フルオロ-2-イロプロピルベンジル)-1-メチル
 -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 164) N-シクロプロピル-N-
 (2-シクロプロピル-5-フルオロベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フル
 オロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 165) N-(2
 -シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメ
 チル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.
 166) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フル
 オロ-6-イロプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサ
 ミド、(15. 167) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エ
 チル-5-メチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カル
 ボキサミド、(15. 168) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フル
 オロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15. 169) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロ
 ピル-5-メチルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 170) N-(2-tert-ブチル
 -5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオ
 ロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 171) N-[5-
 クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオ
 ロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(1
 5
 . 172) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル
 -N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾール-4-
 カルボキサミド、(15. 173) N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベン
 ジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 174) N-[3-クロロ-2-フル
 オロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオ
 ロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15
 . 175) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-4, 5
 -ジメチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサ
 ミド、(15. 176) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ
 -N-(2-イロプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオ
 アミド、(15. 177) 3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1, 1, 3
 -トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピ
 ラゾール-4-カルボキサミド、(15. 178) 3-(ジフルオロメチル)-N-[
 (3R)-7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-
 4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 179) 3
 -(ジフルオロメチル)-N-[
 (3S)-7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2
 , 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カル
 ボキサミド、(15. 180) N'-(2, 5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)
 -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 181) N'-{4-[
 (4,
 5-ジクロロ-1, 3-チアゾール-2-イル)オキシ]-2, 5-ジメチルフェニル}
 -N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 182) N-(4-クロロ-2
 , 6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ジ
 メチル-1H-ピラゾール-5-アミン。

【0236】

分類(1)～(15)で言及した混合成分はすべて、場合によっては、その官能基をもと
 に、可能な場合は適切な塩基または酸と一緒に塩を形成してもよい。

10

20

30

40

50

【0237】

混合成分としての生物学的殺虫剤

式(I)の化合物は、生物学的殺虫剤と組合せてもよい。

【0238】

生物学的殺虫剤は、とりわけ、細菌、真菌、酵母菌、植物抽出物、および、タンパク質および二次的代謝物を包含する、微生物が形成した生成物を包含する。

【0239】

生物学的殺虫剤は、孢子形成細菌、根にコロニーを形成する細菌、および生物学的殺虫剤、殺真菌剤または殺線虫剤として作用する細菌を包含する。

【0240】

生物学的殺虫剤として使用される、または、使用され得るそのような細菌の例は：
Bacillus amyloliquefaciens、F Z B 4 2 株 (D S M 2 3 1 1 7 9)、または*Bacillus cereus*、特に*B. cereus*、C N C M I - 1 5 6 2 株または*Bacillus firmus*、I - 1 5 8 2 株 (受託番号 C N C M I - 1 5 8 2) または*Bacillus pumilus*、特に G B 3 4 株 (受託番号 A T C C 7 0 0 8 1 4) および Q S T 2 8 0 8 株 (受託番号 N R R L B - 3 0 0 8 7)、または*Bacillus subtilis*、特に G B 0 3 株 (受託番号 A T C C S D - 1 3 9 7)、または*Bacillus subtilis*、Q S T 7 1 3 株 (受託番号 N R R L B - 2 1 6 6 1) または*Bacillus subtilis*、O S T 3 0 0 0 2 株 (受託番号 N R R L B - 5 0 4 2 1)、または*Bacillus thuringiensis*、特に*B. thuringiensis*亜種*israelensis* (血清型 H - 1 4)、A M 6 5 - 5 2 株 (受託番号 A T C C 1 2 7 6)、または*B. thuringiensis*亜種*aizawai*、特に A B T S - 1 8 5 7 株 (S D - 1 3 7 2)、または*B. thuringiensis*亜種*kurstaki*、H D - 1 株、または*B. thuringiensis*亜種*tenebrionis*、N B 1 7 6 株 (S D - 5 4 2 8)、*Pasteuria penetrans*、*Pasteuria* spp. (*Rotylenchulus reniformis*線虫) - P R 3 (受託番号 A T C C S D - 5 8 3 4)、*Streptomyces microflavus*、A Q 6 1 2 1 株 (= Q R D 3 1 . 0 1 3、N R R L B - 5 0 5 5 0)、*Streptomyces galbus*、A Q 6 0 4 7 株 (受託番号 N R R L 3 0 2 3 2) である。

【0241】

生物学的殺虫剤として使用される、または、使用され得るそのような真菌および酵母菌の例は：
Beauveria bassiana、特に A T C C 7 4 0 4 0 株、*Coniothyrium minitans*、特に C O N / M / 9 1 - 8 株 (受託番号 D S M - 9 6 6 0)、*Lecanicillium* spp.、特に H R O L E C 1 2 株、*Lecanicillium lecanii*、(以前は*Verticillium lecanii*として公知)、特に K V 0 1 株、*Metarhizium anisopliae*、特に F 5 2 株 (D S M 3 8 8 4 / A T C C 9 0 4 4 8)、*Metschnikowia fructicola*、特に N R R L Y - 3 0 7 5 2 株、*Paecilomyces fumosoroseus* (現在：*Isaria fumosorosea*)、特に I F P C 2 0 0 6 1 3 株、または A p o p k a 9 7 株 (受託番号 A T C C 2 0 8 7 4)、*Paecilomyces lilacinus*、特に P. *lilacinus*、2 5 1 株 (A G A L 8 9 / 0 3 0 5 5 0)、*Talaromyces flavus*、特に V 1 1 7 b 株、*Trichoderma atroviride*、特に S C 1 株 (受託番号 C B S 1 2 2 0 8 9)、*Trichoderma harzianum*、特に T. *harzianum* rifai、T 3 9. (受託番号 C N C M I - 9 5 2) である。

【0242】

生物学的殺虫剤として使用される、または、使用され得るそのようなウイルスの例は：
Adoxophyes orana (リンゴコカクモンハマキ) 顆粒病ウイルス (G V)、*Cydia pomonella* (コドリリング) 顆粒病ウイルス (G V)、*Helicoverpa armigera* (オオタバコガ) 核多核体病ウイルス (N P V)、*Spodoptera exigua* (シロイチモンジヨトウガ) m N P V、ツマジロクサヨトウ (fall armyworm) m N P V、*Spodoptera littoralis* (アフリカヤガ (African cotton leafworm)) N P V である。

【0243】

また、「接種材料」として植物または植物部分または植物器官に添加される細菌および真菌類、ならびに、その特定の特性のために植物の成長および植物の健康を促進する細菌

および真菌類が包含される。例としては：

Agrobacterium spp.、Azorhizobium caulinodans、Azospirillum spp.、Azotobacter spp.、Bradyrhizobium spp.、Burkholderia spp.、とりわけBurkholderia cepacia（以前はPseudomonas cepaciaとして公知）、Gigaspora spp.、またはGigaspora monosporum、Glomus spp.、Laccaria spp.、Lactobacillus buchneri、Paraglomus spp.、Pisolithus tinctorius、Pseudomonas spp.、Rhizobium spp.、とりわけRhizobium trifolii、Rhizopogon spp.、Scleroderma spp.、Suillus spp.、Streptomyces spp.が挙げられる。

【0244】

生物学的殺虫剤として使用される、または、使用され得る、植物の抽出物、ならびに、タンパク質および二次的代謝物を包含する、微生物が形成した生成物の例は：

Allium sativum、Artemisia absinthium、アザジラクチン、Biokeeper WP、Cassia nigricans、Celastrus angulatus、Chenopodium anthelminticum、キチン、Armour-Zen、Dryopteris filix-mas、Equisetum arvense、Fortune Az、Fungastop、Heads Up（Chenopodium quinoaサポニン抽出物）、除虫菊／ピレトリン、Quassia amara、Quercus、Quillaja、Regalia、「Requiem（商標）殺虫剤」、ロテノン、リアニア／リアノジン、Symphytum officinale、Tanacetum vulgare、チモール、Triact 70、TriCon、Tropaeolum majus、Urtica dioica、ベラトリン、Viscum album、Brassicaceae抽出物、とりわけアブラナ粉末またはカラシナ粉末。

【0245】

混合成分としてのセーフナー

式（I）の化合物は、セーフナーと組合せてもよく、当該セーフナーとしては、たとえば、ベノキサコール、クロキントセット（メキシル）、シオメトリニル（cyometrinil）、シプロスルファミド（cyprosulfamide）、ジクロロミド、フェンクロラゾール（エチル）、フェンクロリム、フルラゾール（flurazole）、フルキシフェニム（fluxofenim）、フリラゾール（furilazole）、イソキサジフェン（エチル）、メフェンピル（ジエチル）、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-（{4-[(メチルカルバモイル)アミノ]フェニル}スルホニル）ベンズアミド（CAS 129531-12-0）、4-（ジクロロアセチル）-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン（CAS 71526-07-3）、2, 2, 5-トリメチル-3-（ジクロロアセチル）-1, 3-オキサゾリジン（CAS 52836-31-4）が挙げられる。

【0246】

植物および植物部分

すべての植物および植物の部分を本発明に従って処理し得る。本明細書では、植物は、所望される、および、所望されない野生の植物または作物植物（天然に存在する作物植物を包含する）といった、すべての植物および植物群を意味すると理解され、たとえば、穀類（小麦、米、ライ小麦、大麦、ライ麦、オートミール）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、サトウダイコン、サトウキビ、トマト、エンドウおよび他の野菜の種、綿、タバコ、アブラナおよびさらに果物植物（果物のリンゴ、ナシ、柑橘果実およびブドウを伴う）である。作物植物は、従来の育種および最適化の方法、または、バイオテクノロジーおよび遺伝子工学的な方法、または、これらの方法の組合せによって取得可能な植物であり得、トランスジェニック植物、および、植物の育種者の権利で保護可能または非保護可能な植物品種を包含する。植物の部分は、例としては葉、針葉、柄、茎、花、子実体、果物および種子、ならびに、さらに塊茎、根および根茎が挙げられる、苗条、葉、花および根といった、地上および地中にある植物のすべての部分および器官を意味するものとして理解される。植物の部分は、収穫物、ならびに、たとえば、挿木、塊茎、根茎、植物の切断部分（slips）および種子といった、栄養性および繁殖性の繁殖材料も包含する。

【0247】

式（I）の化合物での植物および植物の部分の本発明の処理は、直接的に効果がもたらされるか、または、従来の処理方法、たとえば、浸漬、スプレー、蒸発、霧充填、拡散、

塗布、注射、および、繁殖材料とりわけ種子の場合はさらに1または複数のコーティングを適用することで、当該化合物にその周囲環境、生息地または保管スペースに作用させることで、効果がもたらされる。

【0248】

上記の通り、すべての植物およびその部分を本発明に従って処理することが可能である。好ましい実施態様では、野生の植物種および植物品種、または、交雑またはプロトプラスト融合といった従来の生物学的育種方法によって得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態様では、適切な場合は従来の方法と組合せて、遺伝子工学方法で得たトランスジェニック植物および植物品種（遺伝子組み換え生物）およびその部分が処理される。「部分」または「植物の部分」または「植物部分」という用語は、既に説明されている。本発明に従うと、それぞれ商業上通例である植物品種または使用されているものの植物を処理することが特に好ましい。植物品種は、新しい特性（「形質」）を有し、従来の育種、突然変異誘発または組み換えDNA技術によって得た植物を意味するよう理解される。植物品種は、品種、変種、生物型または遺伝子型であってよい。

【0249】

トランスジェニック植物、種子処理および組込みの事象

本発明に従って処理される、好ましいトランスジェニック植物または植物品種（遺伝子工学で得たもの）は、遺伝子組み換えを通して、植物に特定の有利で有益な特性（「形質」）を付与する遺伝子材料を受け取るすべての植物を包含する。そのような特性の例は、より良好な植物の成長、高温または低温に対する耐性の増大、かんばつまたは水位もしくはは土壤塩分に対する耐性の増大、開花能力の向上、より簡易な収穫、熟成の加速、より高い収率、収穫産物のより高い質および／もしくははより高い栄養価、収穫産物のより良好な保管期ならびに／または処理可能性である。そのような特性の具体的に強調されるさらなる例は、たとえば植物内に形成される毒素、特に*Bacillus thuringiensis*（たとえば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIII A、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIFおよびこれらの組合せによって）由来の遺伝子材料によって植物内に形成された毒素によって、昆虫類、蛛形類、線形動物、ダニ類、ナメクジ類および腹足類といった動物および微生物害虫に対する植物の耐性の増大、および、たとえば全身獲得抵抗性(SAR)、システミン、フィトアレキシン、誘導因子および抵抗性遺伝子ならびに応答して発現するタンパク質および毒素によって引き起こされる、植物病原性真菌、細菌および／またはウイルスに対する植物の耐性の増大、さらに、イミダゾリノン(imidazolinones)、スルホニル尿素、グリフォセートまたはホスフィノトリシン（たとえば、「PAT」遺伝子）といった特定の除草性有効成分に対する植物の耐性の増大である。対象となる所望する特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物内に互いに組合さって存在してもよい。トランスジェニック植物の例としては、穀類（小麦、米、ライ小麦、大麦、ライ麦、オートミール）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、サトウダイコン、サトウキビ、トマト、エンドウおよび他の野菜の種、綿、タバコ、アブラナおよびさらに果物植物（果物のリンゴ、ナシ、柑橘果実およびブドウを伴う）といった重要な作物植物が挙げられ、トウモロコシ、ダイズ、小麦、米、ジャガイモ、綿、サトウキビ、タバコおよびアブラナが特に強調される。特に強調される特性（「形質」）は、植物の、昆虫類、蛛形類、線形動物およびナメクジ類および腹足類に対する耐性の増大である。

【0250】

作物保護－処理の種類

植物および植物部分は、式(I)の化合物で直接処理されるか、または、従来の処理方法、たとえば、浸漬、スプレー、噴霧、灌漑、蒸発、ダスティング、霧充填、全面散布、泡、塗布、拡散、注射、散水（ドレンチング）、点滴灌漑を使用して、および、繁殖材料、特に種子の場合はさらに乾燥種子処理、液体種子処理、スラリー処理、外皮での被覆、1または複数のコーティングなどを塗布することによって、周囲環境、生息地または保管スペースへの作用によって処理される。さらに式(I)の化合物を極微量方法で適用する

こと、または、適用形態または式（I）の化合物そのものを土壤中に注射することもさらに可能である。

【0251】

好ましい植物の直接処理は、葉面処理であり、すなわち、式（I）の化合物を、葉に適用し、この場合、処理頻度および適用率は、対象となる害虫の感染度に応じて調節されるべきである。

【0252】

全身的に有効な化合物の場合、式（I）の化合物はまた、根のシステムを介して植物に達する。植物は次いで、式（I）の化合物の植物の生息地に対する作用によって処理される。これは、たとえば、ドレンチングまたは土壌または栄養溶液への混合によって達成され得、これは、植物の位置（たとえば、土壌または水耕システム）が式（I）の化合物の液体形態に含浸されていることを意味し、または、土壌適用によって達成され得、これは、式（I）の化合物が固形形態（たとえば、顆粒の形態）で植物の位置に導入されることを意味する。水稻作物の場合、固形適用形態である式（I）の化合物（たとえば、顆粒として）を水であふれた水田に、計って供給（metering）することによっても達成され得る。

10

【0253】

種子処理

植物の種子の処理による動物の害虫の防除は、長く知られており、絶えず改善の対象である。それにもかかわらず、種子の処理は必ずしも満足のいく方法で解決され得ない一連の問題を引き起こす。したがって、保管中、種蒔き後または植物の出芽後に、殺虫剤の追加の適用なしで、または少なくとも顕著に低下した量で済む種子およびその出芽植物を保護する方法を開発することが望まれる。使用する有効成分の量を最適化し、使用する有効成分によって植物そのものは損害を受けずに動物の害虫による攻撃から種子およびその出芽植物を最適に保護することがさらに望まれる。特に、種子処理の方法では、最小の殺虫剤の消耗で種子およびその出芽植物の最適な保護を達成するために、害虫抵抗性または耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫または殺線虫特性も考慮すべきである。

20

【0254】

したがって、本発明は特に、式（I）の化合物うちの1つで種子を処理することで、害虫の攻撃から種子およびその出芽植物を保護する方法にも関する。害虫の攻撃から種子およびその出芽植物を保護する本発明の方法はさらに、種子が、1つの操作で同時に、または、順次に、式（I）の化合物および混合成分で処理される方法を含んでなる。また、異なるタイミングで種子が式（I）の化合物および混合成分で処理される方法をさらに含んでなる。

30

【0255】

同様に、本発明は、動物の害虫から種子およびその結果としての植物を保護するための種子処理のために、式（I）の化合物を使用することに関する。

【0256】

本発明はさらに、動物の害虫からの保護のために式（I）の化合物で処理された種子に関する。本発明は、式（I）の化合物および混合成分と同時に処理された種子にも関する。本発明はさらに、異なるタイミングで式（I）の化合物および混合成分と処理された種子に関する。異なるタイミングで式（I）の化合物および混合成分と処理された種子の場合、各物質は、種子上に異なる層で存在し得る。この場合、式（I）の化合物および混合成分を含んでなる層は、中間層によって分離されていてもよい。本発明は、式（I）の化合物および混合成分がコーティングの一部または追加の層またはコーティングと合わせてさらに追加の層として適用された種子にも関する。

40

【0257】

本発明はさらに、式（I）の化合物での処理後に、種子上での塵による摩耗を防止するためのフィルムコーティングプロセスにかけた種子に関する。

【0258】

50

式（I）の化合物の1つが全身的に作用する際に生じる利点の1つとして、種子の処理が、種子そのものだけでなく、出芽後に当該種子から生じる植物も、動物の害虫から保護することがある。こうして、種蒔きまたはその直後に作物の中間処理を行わずに済み得る。

【0259】

さらなる利点として、式（I）の化合物での種子の処理は、処理した種子の発芽および出芽を促進し得ることがある。

【0260】

同様に、式（I）の化合物はとりわけトランスジェニック種子にも使用され得ることも利点である。

【0261】

さらに、式（I）の化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用され得、このことは、根粒菌、菌根および／または内部寄生性細菌もしくは真菌といった共生生物の良好なコロニー形成をもたらし、および／または、最適化した窒素固定につながる。

【0262】

式（I）の化合物は、農業、温室、森林または園芸で使用されるあらゆる植物変種の種子の保護に適切である。より具体的には、穀類（たとえば、小麦、大麦、ライ麦、キビおよびオートミール）、トウモロコシ、綿、ダイズ、米、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、キャノーラ、アブラナ、テンサイ（たとえば、サトウダイコンおよび飼料ビート）、ピーナッツ、野菜（たとえば、トマト、キュウリ、豆、アブラナ科植物、玉ねぎおよびレタス）、果物植物、芝生および装飾植物の種子が包含される。特に重要なのは、穀類（小麦、大麦、ライ麦およびオートミールといった）、トウモロコシ、ダイズ、綿、キャノーラ、アブラナおよび米の種子の処理である。

【0263】

上記の通り、式（I）の化合物でのトランスジェニック種子の処理も特に重要である。これは、殺虫および／または殺線虫特性を特に有するポリペプチドの発現を調節する異種遺伝子を通常少なくとも1つ含有する植物の種子に関連する。トランスジェニック種子の異種遺伝子は、*Bacillus*、*Rhizobium*、*Pseudomonas*、*Serratia*、*Trichoderma*、*Clavibacter*、*Glomus*または*Gliocladium*といった微生物に由来し得る。本発明は、*Bacillus* sp.由来の異種遺伝子を少なくとも1つ含有するトランスジェニック種子の処理に特に適切である。異種遺伝子は、より好ましくは、*Bacillus thuringiensis*由来である。

【0264】

本発明の文脈では、式（I）の化合物は種子に適用される。種子は好ましくは、処理の経過中に損害が一切生じないほど安定である状態で処理される。一般的に、種子は、収穫と種蒔きの間のいずれかのタイミングで処理されてよい。植物から分離された種子、または、穂軸、殻、柄、被覆、毛または果物の果肉を含まない種子を通常用いる。したがって、たとえば、収穫、洗浄、および保管を可能にする水含量まで乾燥させた種子を用いることも可能である。代替的に、乾燥後、たとえば水で処理し、次いで再度乾燥させて準備した種子を使用するのも可能である。米の種子の場合、たとえば、特定の段階（鳩胸状態の段階）まで水中で事前に膨潤させた種子を使用することも可能であり、このことは、より良好な発芽およびより均一な出芽をもたらす。

【0265】

種子を処理する場合、通常は、種子に適用する式（I）の化合物の量および／または追加の添加剤の量を、種子の発芽が有害に影響を受けないように、または、結果として生じる植物が損害を受けないように、注意を払って選択しなくてはならない。これは、特に特定の適用率で植物毒性を示す有効成分の際に確認しなくてはならない。

【0266】

通常、式（I）の化合物は、適切な製剤形態で種子に適用される。種子処理に適切な製剤およびプロセスは、当業者には公知である。

【0267】

式（I）の化合物を、溶液、乳濁液、懸濁液、粉末、泡、スラリーまたは他の種用コーティング組成物、および、ULV製剤といった従来の種子粉衣製剤に転化してもよい。

【0268】

これらの製剤は公知の方法で、式（I）の化合物を、たとえば、従来の増量剤および溶媒または希釈剤、染料、浸潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次的増粘剤、接着剤、ジベレリンおよび水といった従来の添加剤と混合することで調製される。

【0269】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る有用な染料は、そのような目的のために通例である、すべての染料である。水になかなかとけない色素、または、水溶性の染料のいずれかを使用することが可能である。例としては、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112およびC、I、ソルベントレッド1の名前で知られる染料が挙げられる。

10

【0270】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る有用な浸潤剤は、浸潤を促進し、農芸化学的に有効な成分の配合に関して通例である、すべての物質である。ジイソプロピルまたはジイソブチルナフタレンスルホネートといったアルキルナフタレンスルホネートを用いることが好ましい。

【0271】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る適切な分散剤および／または乳化剤は、活性農芸化学化合物の製剤で通例である、すべての非イオン性、アニオン性およびカチオン性分散剤である。非イオン性もしくはアニオン性分散剤または非イオン性もしくはアニオン性分散剤の混合物を用いることが好ましい。適切な非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテルおよびトリストリルフェノール（tristyrylphenol）ポリグリコールエーテル、およびそのリン酸化（phosphated）または硫酸化（sulphated）誘導体が挙げられる。適切なアニオン性分散剤は、とりわけリグノスルホン酸塩、ポリアクリル酸塩およびアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド凝縮物である。

20

【0272】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る消泡剤は、農芸化学的に有効な成分の製剤で通例である、すべての泡防止物質である。シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムが好ましくは用いられ得る。

30

【0273】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る保存剤は、そのような目的のために農芸化学組成物で使用可能なすべての物質である。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマル（hemiformal）が挙げられる。

【0274】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る二次的増粘剤は、そのような目的のために農芸化学組成物で使用され得るすべての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサントラン、改良粘土および微細シリカが挙げられる。

40

【0275】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得る有用な固着剤は、種子粉衣製品で使用可能なすべての従来の結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースである。

【0276】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤に存在し得るジベレリンは、好ましくはジベレリンA1、A3（＝ジベレリン酸）、A4およびA7であり；ジベレリン酸を用いることが特に好ましい。ジベレリンは、公知である（R. Wegler “Chemie der Pflanzenschutz- und Schaedlingsbekaempfungsmittel”, vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412を参照）。

50

【0277】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤を用いて、直接的か、または、水での事前希釈後かのいずれかで、幅広い様々な種類の種子を処理し得る。たとえば、濃縮物またはそこから水と希釈して得られる調製物を用いて、小麦、大麦、ライ麦、オートミールおよびライコムギといった穀類の種子、ならびに、トウモロコシ、米、アブラナ、エンドウマメ、豆、綿、ヒマワリ、ダイズおよびテンサイの種子、または、様々な異なる野菜の種子を粉衣し得る。本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤、または、それから生じる希釈使用形態を用いて、トランスジェニック植物の種子も粉衣し得る。

【0278】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤またはそれから調製する使用形態で種子を処理することに関して、種子粉衣に関して従来使用可能であるすべての混合単位が有用である。具体的には、種子粉衣の手順は、種子をバッチ形式または連続操作でミキサーに入れること、特定の所望量の種子粉衣製剤を、そのままか、または、水で希釈した後のいずれかで追加すること、および、製剤が種子上で均一に分布されるまで混合することである。適宜、乾燥操作が続く。

【0279】

本発明に従った使用可能な種子粉衣製剤の適用率は、比較的幅広い範囲内で異なり得る。製剤内の式（I）の化合物の具体的な含量、および、種子によって導かれる。式（I）の化合物の適用率は、通常、種子1キログラム当たり0.001から50gの間、好ましくは種子1キログラム当たり0.01から15gの間である。

【0280】

動物の保健

動物の保健分野、すなわち、獣医学の分野では、式（I）の化合物は、動物の寄生虫、特に外部寄生虫または内部寄生虫に対して有効である。内部寄生虫という用語は、とりわけ蠕虫および球虫類といった原生生物を包含する。外部寄生虫は通常および好ましくは、節足動物、とりわけ昆虫類およびダニ類である。

【0281】

獣医学の分野では、好都合な恒温動物毒性を有する式（I）の化合物は、動物育種および畜産において、家畜（livestock）、育種動物、動物園の動物、実験動物（laboratory animals）、実験動物（experimental animals）、および家畜（domestic animals）に生じる寄生虫を防除するのに適している。寄生虫の発達段階の全段階または特定の段階に有効である。

【0282】

農業用家畜としては、たとえば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、トナカイ、ダマジカおよび特にウシおよびブタといった哺乳動物；シチメンチョウ、アヒル、ガチョウおよび特にニワトリといった家禽類；たとえば水産養殖における魚類および甲殻類、ならびに、ハチといった昆虫が挙げられる。

【0283】

家畜としては、たとえば、ハムスター、モルモット、ラット、ハツカネズミ、チンチラ、フェレット、および特にイヌ、ネコといった哺乳動物、かごにいたる鳥、爬虫類、両生類および水槽用魚類が挙げられる。

【0284】

好ましい実施態様では、式（I）の化合物は、哺乳動物に投与される。

【0285】

別の好ましい実施態様では、式（I）の化合物は鳥類、すなわち、かごにいたる鳥および特に家禽類に投与される。

【0286】

式（I）の化合物を動物の寄生虫の防除のために使用することは、病気、死亡件数、性能の低下（肉、牛乳、羊毛、獣皮、卵、ハチミツなどの場合）を低下および防止し、より経済的および単純な動物の保持が可能になり、より良好な動物の福利が達成されることを

意図する。

【0287】

動物の保健分野に関する際、「防除 (control) 」または「防除すること (controlling) 」という用語は、式 (I) の化合物が、特定の寄生虫に感染した動物におけるそのような寄生虫の発生率を無害なレベルまで下げるのに有効であることを意味する。より具体的には、「防除すること (controlling) 」は、本明細書の文脈では、式 (I) の化合物がそれぞれの寄生虫を殺し、その成長を阻害し、またはその繁殖を阻害し得ることを意味する。

【0288】

節足動物としては：

Anoplurida目から、たとえば、*Haematopinus* spp.、*Linognathus* spp.、*Pediculus* spp.、*Phtirus* spp.、*Solenopotes* spp.；Mallophagida目およびAmblycerina亜目およびIschnocerina亜目から、たとえば、*Trimenopon* spp.、*Menopon* spp.、*Trinoton* spp.、*Bovicola* spp.、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、*Damalina* spp.、*Trichodectes* spp.、*Felicola* spp.；Diptera目およびNematocerinaおよびBrachycerina亜目から、たとえば、*Aedes* spp.、*Anopheles* spp.、*Culex* spp.、*Simulium* spp.、*Eusimulium* spp.、*Phlebotomus* spp.、*Lutzomyia* spp.、*Culicoides* spp.、*Chrysops* spp.、*Odagmia* spp.、*Wilhelmia* spp.、*Hybomitra* spp.、*Atylotus* spp.、*Tabanus* spp.、*Haematopota* spp.、*Philipomyia* spp.、*Braula* spp.、*Musca* spp.、*Hydrotaea* spp.、*Stomoxys* spp.、*Haematobia* spp.、*Morellia* spp.、*Fannia* spp.、*Glossina* spp.、*Calliphora* spp.、*Lucilia* spp.、*Chrysomyia* spp.、*Wohlfahrtia* spp.、*Sarcophaga* spp.、*Oestrus* spp.、*Hypoderma* spp.、*Gasterophilus* spp.、*Hippobosca* spp.、*Lipoptena* spp.、*Melophagus* spp.、*Rhinoestrus* spp.、*Tipula* spp.；Siphonapterida目から、たとえば、*Pulex* spp.、*Ctenocephalides* spp.、*Tunga* spp.、*Xenopsylla* spp.、*Ceratophyllus* spp.；Heteropterida目から、たとえば、*Cimex* spp.、*Triatoma* spp.、*Rhodnius* spp.、*Panstrongylus* spp.；ならびにBlattarida目から不快害虫および衛生害虫が挙げられる。

【0289】

節足動物としてはさらに：

Acari (Acarina) 亜綱およびMetastigmata目から、たとえばArgasidae科から*Argas* spp.、*Ornithodoros* spp.、*Otobius* spp.、Ixodidae科から*Ixodes* spp.、*Amblyomma* spp.、*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.、*Dermacentor* spp.、*Haemophysalis* spp.、*Hyalomma* spp.、*Rhipicephalus* spp. (多数宿主マダニの最初の属)；Mesostigmata目から*Dermanyssus* spp.、*Ornithonyssus* spp.、*Pneumonyssus* spp.、*Raillietia* spp.、*Pneumonyssus* spp.、*Sternostoma* spp.、*Varroa* spp.、*Acarapis* spp.；Actinedida (Prostigmata) 目から、たとえば*Acarapis* spp.、*Cheyletiella* spp.、*Ornithocheyletia* spp.、*Myobia* spp.、*Psorergates* spp.、*Demodex* spp.、*Trombicula* spp.、*Neotrombicula* spp.、*Listrophorus* spp.；およびAcaridida (Astigmata) 目から、たとえば*Acarus* spp.、*Tyrophagus* spp.、*Caloglyphus* spp.、*Hypodectes* spp.、*Pterolichus* spp.、*Psoroptes* spp.、*Chorioptes* spp.、*Otodectes* spp.、*Sarcoptes* spp.、*Notoedres* spp.、*Knemidocoptes* spp.、*Cytodites* spp.、*Laminosioptes* spp.が挙げられる。

【0290】

寄生性原生動物としては：

Mastigophora (Flagellata)、たとえばTrypanosomatidae、たとえば*Trypanosoma* b. *brucei*、*T.b. gambiense*、*T.b. rhodesiense*、*T. congolense*、*T. cruzi*、*T. evansi*、*T. equinum*、*T. lewisi*、*T. percae*、*T. simiae*、*T. vivax*、*Leishmania* *brasiliensis*、*L. donovani*、*L. tropica*、たとえばTrichomonadidae、たとえば*Giardia lamblia*、*G. canis*；Entamoebidae、たとえば*Entamoeba histolytica*、Hartmanellidae、たとえば*Acanthamoeba* sp.、*Harmanella* sp.といったSarcomastigophora (Rhizopoda)；Eimeridae、たとえば*Eimeria* *acervulina*、*E. adenoides*、*E. alabamensis*、*E. anatis*、*E. anserina*、*E. arloingi*、*E. ashata*、*E. auburnensis*、*E. bovis*、*E. brunetti*、*E. c*

anis, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandalis*, *E. deblickei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoidales*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. intestinalis*, *E. iroquoia*, *E. irresidua*, *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagrimitis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E. stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystisopora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, 特に *C. parvum*; *Toxoplasma* 10
lasmadidae, たとえば *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; *Sarcocystidae*, たとえば *Sarcocystis bovicanis*, *S. bovi hominis*, *S. ovicanis*, *S. ovifelis*, *S. neurona*, *S. spec.*, *S. sui hominis*, *Leucozoidae*, 10
 たとえば *Leucozytozoon simondi*, *Plasmodiidae*, たとえば *Plasmodium berghei*, *P. falciparum*, *P. malariae*, *P. ovale*, *P. vivax*, *P. spec.*, *Piroplasma*, たとえば *Babesia argentina*, *B. bovis*, *B. canis*, *B. spec.*, *Theileria parva*, *Theileria spec.*, *Adeleina*, 10
 たとえば *Hepatozoon canis*, *H. spec.* といった *Apicomplexa* (*Sporozoa*) が挙げられる。

【0291】

蠕虫である病原性内部寄生虫は、*Platyhelmintha* (たとえば、*Monogenea*、条虫類および吸虫類)、回虫、*Acanthocephala*、および *Pentastoma* を包含する。これらには： 20
Monogenea : たとえば : *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.
 条虫類 : *Pseudophyllidea* 目から、たとえば : *Diphyllobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diphlogonoporus* spp.;
Cyclophyllida 目から、たとえば : *Mesocystoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina* spp., *Stilesia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andrya* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Echinolepis* spp., *Echinocotyle* spp., *Diorchis* spp., *Dipylidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Diplopylidium* spp.;
 吸虫類 : *Digenea* 綱から、たとえば : *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austrotrichobilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucochloridium* spp., *Brachylaima* spp., *Echinostoma* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Cyclocoelum* spp., *Typhlocoelum* spp., *Paramphistomum* spp., *Calicophoron* spp., *Cotylophoron* spp., *Gigantocotyle* spp., *Fischerius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Notocotylus* spp., *Catantropis* spp., *Plagiorchis* spp., *Prosthogonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Eurytrema* spp., *Troglostrongylus* spp., *Paragonimus* spp., *Collyriclum* spp., *Nanophyetus* spp., *Opisthorchis* spp., *Clonorchis* spp., *Metorchis* spp., *Heterophyes* spp., *Metagonimus* spp.; 30
 回虫 : *Trichinellida*, たとえば : *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Paracapillaria* spp., *Eucoleus* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp.; 40
Tylenchida 目から、たとえば : *Micronema* spp., *Strongyloides* spp.
Rhabditida 目から、たとえば : *Strongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostongylus* spp., *Parelaphostongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp. 50

、Angiostrongylus spp.、Aelurostrongylus spp.、Filaroides spp.、Parafilaroides spp.、Trichostrongylus spp.、Haemonchus spp.、Ostertagia spp.、Teladorsagia spp.、Marshallagia spp.、Cooperia spp.、Nippostrongylus spp.、Heligmosomoides spp.、Nematodirus spp.、Hyostrongylus spp.、Obeliscoides spp.、Amidostomum spp.、Ollulanus spp.；

Spirurida目から、たとえば：Oxyuris spp.、Enterobius spp.、Passalurus spp.、Syphacia spp.、Aspiculuris spp.、Heterakis spp.；Ascaris spp.、Toxascaris spp.、Toxocara spp.、Baylisascaris spp.、Parascaris spp.、Anisakis spp.、Ascaridia spp.；Gnathostoma spp.、Physaloptera spp.、Thelazia spp.、Gongylonema spp.、Habronema spp.、Parabronema spp.、Draschia spp.、Dracunculus spp.；Stephanofilaria spp.、Parafilaria spp.、Setaria spp.、Loa spp.、Dirofilaria spp.、Litomosoides spp.、Brugia spp.、Wuchereria spp.、Onchocerca spp.、Spirocerca spp.；

Acanthocephala：Oligacanthorhynchida目から、たとえば：Macracanthorhynchus spp.、Prosthenorchis spp.；Polymorphida目から、たとえば：Filicollis spp.；Moniliiformida目から、たとえば：Moniliiformis spp.；

Echinorhynchida目から、たとえば、Acanthocephalus spp.、Echinorhynchus spp.、Leptorhynchoides spp.；

Pentastoma：Porocephalida目から、たとえば、Linguatula spp.が包含される。

【0292】

獣医分野および動物の保持では、式（I）の化合物は、適切な調製物の形態で、腸内、非経口、皮膚または経鼻経路といった、一般的に当該技術分野で公知の方法によって投与される。投与は予防的または治療的であり得る。

【0293】

このように、本発明の一つの実施態様は、式（I）の化合物を薬剤として使用することを指す。

【0294】

さらなる態様は、式（I）の化合物を抗内部寄生虫剤、特に抗蠕虫剤または抗原生動物剤として使用することを指す。式（I）の化合物は、抗内部寄生虫剤、とりわけ抗蠕虫剤または抗原生動物剤として、たとえば、畜産、動物育種、家畜用の建物および衛生セクターでの使用に適している。

【0295】

さらなる態様は、式（I）の化合物を抗外部寄生虫剤、特に殺虫剤または殺ダニ剤といった殺節足動物剤として使用することに関する。さらなる態様は、式（I）の化合物を抗外部寄生虫剤、特に殺虫剤または殺ダニ剤といった殺節足動物剤として、たとえば、畜産、動物育種、家畜用の建物および衛生セクターで使用することに関する。

【0296】

駆虫性混合成分

次の駆虫性混合成分が例として言及され得る：

殺吸虫的および殺条虫的な有効成分を包含する駆虫性有効成分：

大環状ラク톤の分類から、たとえば：アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン（emamectin）、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、ネマデクチン、セラメクチン；

ベンズイミダゾール類およびプロベンズイミダゾール類の分類から、たとえば：アルベンダゾール、アルベンダゾールスルホキシド、カンベンダゾール、シクロベンダゾール、フェバンテル、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、ネトビミン（netobimin）、オクスフェンダゾール、オキシベンダゾール（oxibendazole）、パルベンダゾール、チアベンダゾール、チオフアネート、トリクラベンダゾール；

シクロオクタデブシペプチドの分類から、たとえば：エモデブシド、PF1022；

アミノアセトニトリル誘導体の分類から、たとえば：モネパンテル（monepantel）；

テトラヒドロピリミジン類の分類から、たとえば：モランテル、ピランテル、オキササンテ

10

20

30

40

50

ル；

イミダゾチアゾール類の分類から、たとえば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

サリチルアニリド類の分類から、たとえば：プロモキサニド (bromoxanide)、プロチアニド (brotianide)、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド、トリブロンサラン；

パラヘルクアミド類の分類から、たとえば：デルクワンテル (derquantel)、パラヘルクアミド；

アミノフェニルアミジンの分類から、たとえば：アミダンテル (amidantel)、脱アシル化アミダンテル (d A M D)、トリベンジミジン；

オルガノフォスフェートの分類から、たとえば：クマホス、クルホメート、ジクロロボス、ハロキソン (haloxone)、ナフタロフォス (naphthalofos)、トリクロルホン；

置換フェノールの分類から、たとえば：ビチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロフォラン (meniclopholan)、ニトロキシニル (nitroxynil)；

ピペラジノン類の分類から、たとえば：プラジカンテル、エプシプランテル；

様々な他の分類から、たとえば：アモスカネート (amoscanate)、ベフェニウム、ブナミジン (bunamidine)、クロナゼパム、クロルスロン、ジアンフェネチド (diamfenetid)、ジクロロフェン、ジエチルカルバマジン、エメチン、ヘトリン (hetolin)、ヒカントン、ルカンソン、ミラシル、ミラサン (mirasan)、ニクロサミド、ニリダゾール、ニトロキシニル、ニトロスカネート (nitroscanate)、オルチプラズ (oltipraz)、オムファロチン、オキサムニキン (oxamniquin)、パロモマイシン、ピペラジン、レソランテル (resorantel)。

【0297】

媒介動物防除

式 (I) の化合物は、媒介動物防除でも用いられ得る。本発明の文脈では、媒介動物は、病原体、たとえばウイルス、蠕虫類、単細胞生物および細菌を、保有宿主 (reservoir) (植物、動物、ヒトなど) から宿主に伝染させることができる節足動物、とりわけ昆虫または蛛形類である。病原体は、力学的 (たとえば、非刺咬のハエによるトラコーマ) に宿主に伝染され得るか、または、注射後 (たとえば、蚊によるマラリア寄生虫) によって宿主内に伝染され得るかのいずれかである。

【0298】

媒介動物および媒介動物が伝染させる疾患または病原体の例は：

1) 蚊

- Anopheles：マラリア、フィラリア (filariosis)；
- Culex：日本脳炎、フィラリア症、他のウイルス性疾患、蠕虫の感染；
- Aedes：黄熱病、デング熱、フィラリア症、他ウイルス性疾患；
- Simuliidae：蠕虫、特にOnchocerca volvulusの感染；

2) シラミ：皮膚感染、流行性発疹チフス；

3) ノミ：ペスト、発疹熱；

4) ハエ：睡眠病 (トリパノソーマ症)；コレラ、他の細菌性疾患；

5) ダニ：ダニ症、流行性発疹チフス、リケッチア痘、ツラレミア、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (T B E)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症；

6) マダニ：Borrelia duttoni、ダニ媒介脳炎、Q熱 (Coxiella burnetii)、バベシア症 (Babesia canis canis) といったボレリオ症 (borellioses)。

【0299】

本発明の文脈において、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に伝染させられる昆虫類、たとえば、アブラムシ、ハエ、ヨコバイまたはアザミウマである。他の植物ウイルスを伝染可能な媒介動物は、ハダニ、シラミ、カブトムシおよび線形動物である。

【0300】

本発明の文脈において、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物および／またはヒトに伝染させられる、蚊、とりわけAedes属、Anopheles属、たとえばA. gambiae、A. arabien sis、A. funestus、A. dirus（マラリア）およびCulex属の蚊、シラミ、ノミ、ハエ、ダニおよびマダニといった昆虫類および蛛形類である。

【0301】

媒介動物の防除はまた、式（I）の化合物が抵抗性打破（resistance-breaking）であっても可能である。

【0302】

式（I）の化合物は、媒介動物が感染させる疾患および／または病原体の予防での使用に適している。したがって、本発明のさらなる態様は、式（I）の化合物を、媒介動物防除のために、たとえば、農業、園芸、林業、庭園、および娯楽施設ならびに、材料および保管製品の保護で使用するこ

10

【0303】

工業材料の保護

式（I）の化合物は、昆虫、たとえば、Coleoptera目、Hymenoptera目、Isoptera目、Lepidoptera目、Psocoptera目およびZygentoma目からの昆虫による攻撃または破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0304】

工業材料は、本明細書の文脈では、好ましくはプラスチック、接着剤、糊付け剤、紙および厚紙、皮、木材、加工済み木製品およびコーティング組成物といった、無生物材料を意味するものとして理解される。木材保護のために本発明を使用することが特に好ましい。

20

【0305】

さらなる実施態様では、式（I）の化合物は、少なくとも1つの追加の殺虫剤および／または少なくとも1つの殺真菌剤と一緒に用いられる。

【0306】

さらなる実施態様では、式（I）の化合物は、使用準備済み殺虫剤として存在し、すなわち、当該化合物は、さらに改変せずに対象の材料に適用可能である。適切な追加の殺虫剤または殺真菌剤は特に上記したものである。

【0307】

驚くことに、式（I）の化合物は、塩水または汽水に接触する物、特に船体、スクリーン、ネット、建物、係留具および信号システムを、汚れ（fouling）から保護するのに用いられ得ることもわかった。式（I）の化合物を単独または他の有効成分と組合せて、防汚塗料として使用することも平等に可能である。

30

【0308】

衛生セクターでの動物の害虫の防除

式（I）の化合物は、衛生セクターにおいて、動物の害虫を防除するのに適している。より具体的には、本発明を家庭内保護セクター、衛生保護セクターおよび保管製品の保護において、住居、工場のホール、オフィス、乗り物のキャビンといった閉じられたスペースで遭遇する、昆虫類、蛛形類およびダニ防除のために、特に使用され得る。動物の害虫の防除に関しては、式（I）の化合物は単独または他の有効成分および／または補助剤と組合せて使用する。好ましくは、当該化合物は家庭内殺虫製品で用いられる。式（I）の化合物は、感応性および耐性種、および、すべての発達段階に対して有効である。

40

【0309】

これらの害虫には、たとえば、Arachnida綱、Scorpiones目、Araneae目およびOpiliones目、Chilopoda綱およびDiplopoda綱、Insecta綱Blattodea目、Coleoptera目、Dermaptera目、Diptera目、Heteroptera目、Hymenoptera目、Isoptera目、Lepidoptera目、Phthiraptera目、Psocoptera目、Saltatoria目またはOrthoptera目、Siphonaptera目およびZygentoma目およびMalacostraca綱Isopoda目からの害虫が包含される。

【0310】

50

その適用は、たとえば、エアロゾル、未加圧スプレー製品、たとえばポンプおよび噴霧スプレー、自動霧充填システム、噴霧器、泡、ジェル、セルロースまたはプラスチック製の蒸発器タブレットを備えた蒸発製品、液体蒸発器、ジェルおよび膜蒸発器、プロペラ駆動蒸発器、エネルギーフリーまたは受動蒸発システム、顆粒またはダストとして拡散用のおとりまたはおとり場における蛾用ペーパー (moth papers)、蛾用袋 (moth bags)、蛾用ジェル (moth gels) で効果を達成する。

【実施例】

【0311】

次に続く調製および使用の実施例は、本発明を例示し、制限することはない。

【0312】

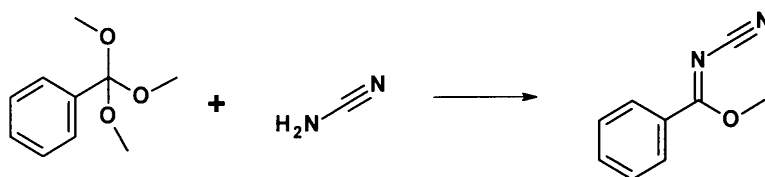
調製実施例

エチル [5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (1-7) の合成、W02009/011850を参照。

【0313】

段階1: メチル N-シアノベンゼンカルボキシイミドエート

【化60】



【0314】

(トリメトキシメチル) ベンゼン (75 g) およびシアナミド (17.304 g) を 78 ml の無水酢酸に取り、次いで、135℃で45分間攪拌した。混合物を次いで減圧化で濃縮し、残渣をシクロヘキサンと混合し、およびその固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。これによって65.30 gの表題化合物を得た。

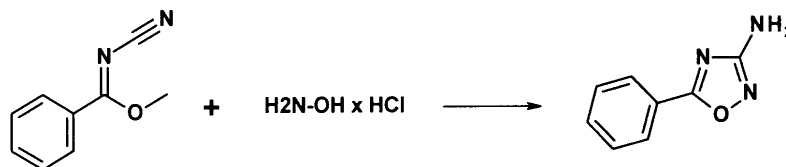
【0315】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.83; 質量 (m/z): 161.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 4.045 (s, 3H), 7.601-7.644 (m, 2H), 7.712-7.755 (m, 1H), 7.966-7.995 (m, 2H).

【0316】

段階2: 5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-アミン

【化61】



【0317】

メチル N-シアノベンゼンカルボキシイミドエート (30.50 g) を初めに157 ml のメタノールに添加し、塩酸ヒドロキシルアミン (13.23 g) の添加後、室温で2時間攪拌した。トリエチルアミン (19.17 g) を次いで0℃で添加し、最初は透明の溶液を形成し、固形物が30分後に沈殿した。混合物を室温で一晩攪拌し、固形物を吸引ろ過し、水で洗浄し、乾燥させた。これによって10.60 gの表題化合物を得た。

【0318】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.28; 質量 (m/z): 162.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 6.418 (s, 2H), 7.514-8.02 (m, 5H).

【0319】

段階3: エチル [5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホル

10

20

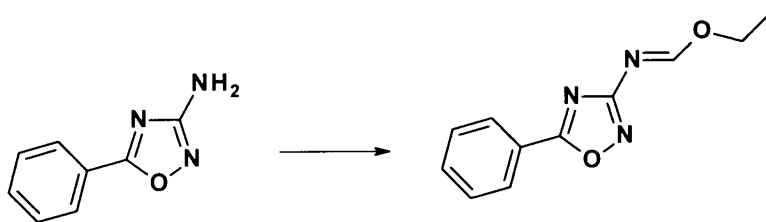
30

40

50

メート

【化 6 2】



10

【0320】

5-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-3-アミン (10.60 g) を 30 ml のオルトギ酸トリエチルと一緒に還流下で一晩攪拌した。混合物を次いで放冷し、100 ml の石油エーテルを添加し、混合物を室温で30分間攪拌し、次いで沈殿した固形物を吸引ろ過した。これによって9.70 g の表題化合物を得た。

【0321】

HPLC-MS: log P (中性) = 2.87; 質量 (m/z): 218.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 1.343 (t, 3H), 4.389 (q, 2H), 7.621-7.743 (m, 3H), 8.085-8.106 (m, 2H), 8.705 (s, 1H).

【0322】

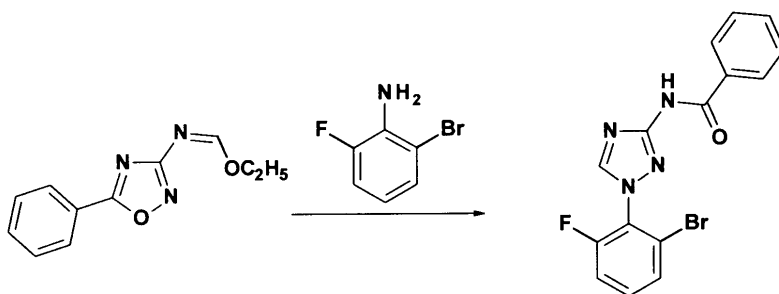
実施例 1

20

2-トリフルオロメチル-N-[1-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド (表1、実施例 I-1-30)

段階1: N-[1-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド

【化 6 3】



30

【0323】

エチル [5-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (2.00 g) および 2-ブロモ-6-フルオロアニリンを 150 °C まで 4 時間加熱し、反応混合物を室温まで冷まし、残渣を 20 ml のエタノールと 45 分間攪拌し、残った固形物を吸引ろ過した。これによって 2.0 g の所望する表題化合物を得た。

【0324】

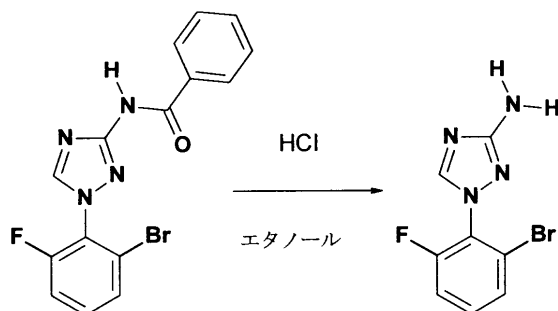
40

HPLC-MS: log P (中性) = 1.79; 質量 (m/z): 361 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.587 (m, 2H), 7.638 (m, 3H), 7.768 (m, 1H), 8.002 (m, 2H), 8.891 (s, 1H), 11.053 (s, 1H).

【0325】

段階2: 1-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン

【化 6 4】



10

【0 3 2 6】

N-[1-(2-bromo-6-fluorophenyl)-1H-1,2,4-triazol-3-yl]benzamide (2.1 g) を初めに 25 ml のエタノールに添加し、6 ml の濃塩酸を添加し、次いで、混合物を還流下で 8 時間攪拌した。次に、反応混合物を減圧で濃縮し、残渣を水に取り、および水酸化ナトリウム溶液 (pH 9) を添加してアルカリ性にした。水相をジクロロメタンで抽出し、および 1 つにまとめた抽出物を乾燥および濃縮した。残った粗生成物をシクロヘキサン/酢酸エチルを溶離液として用いてシリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。抽出物の濃縮によって 0.65 g の表題化合物を得た。

20

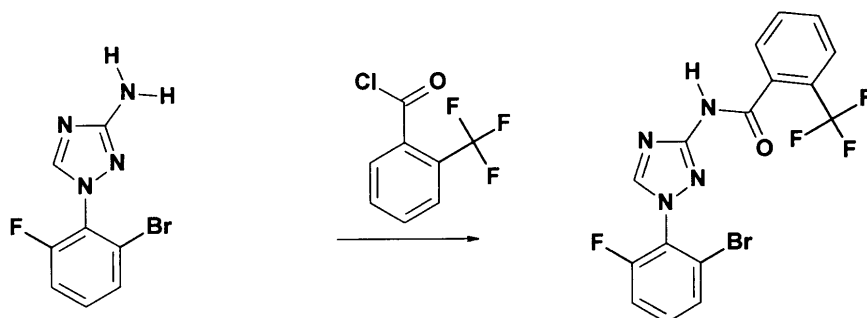
【0 3 2 7】

HPLC-MS: log P (中性) = 0.92; 質量 (m/z): 257 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 5.604 (s, 2H), 7.797-7.876 (m, 3H); 8.346 (s, 1H).

【0 3 2 8】

段階 3: 2-トリフルオロメチル-N-[1-(2-bromo-6-fluorophenyl)-1H-1,2,4-triazol-3-yl]benzamide

【化 6 5】



30

【0 3 2 9】

1-(2-bromo-6-fluorophenyl)-1H-1,2,4-triazol-3-ylamine (0.12 g) を、ジクロロメタン (10 ml) 中のピリジン溶液 (0.11 g) に添加し、およびジクロロメタン中 2-トリフルオロメチルベンゾイルクロリド (0.107 g) 溶液を 0 °C で滴下して添加した。添加を終えた後、混合物を 0 °C で 4 時間攪拌し、次いで、室温で一晩攪拌した。次に、反応溶液をさらにジクロロメタンで希釈し、希塩酸で 2 回、および、水で 1 回洗浄した。有機相を取り除き、乾燥および濃縮した。残った残渣を、シクロヘキサン/酢酸エチルを溶離液として用いて、シリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。これによって 0.163 g の表題化合物を得た。

40

【0 3 3 0】

HPLC-MS: log P (中性) = 2.15; 質量 (m/z): 429 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.608-7.837 (m, 7H), 8.863 (s, 1H), 11.344 (s, 1H).

50

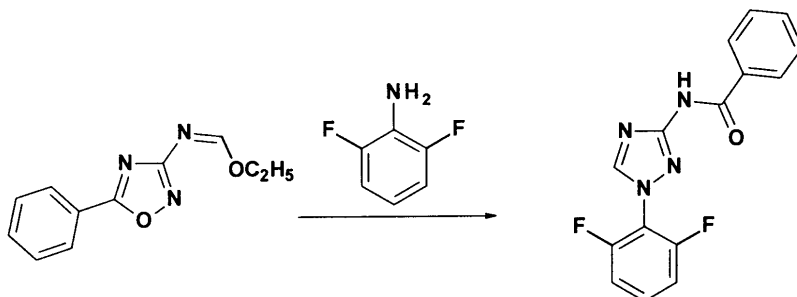
【0331】

実施例 2

2-トリフルオロメチル-N-[1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド (表1、実施例 I-1-11)

段階1: N-[1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド

【化66】



10

【0332】

エチル [5-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (5.00 g) および 2,6-ジフルオロアニリン (2.97 g) を 150℃ で 4 時間加熱し、反応混合物を冷まし、次いで、30 ml のエタノールを添加した。混合物を室温で 45 分間攪拌し、および残った固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。これによって 6.0 g の所望する生成物を得た。

20

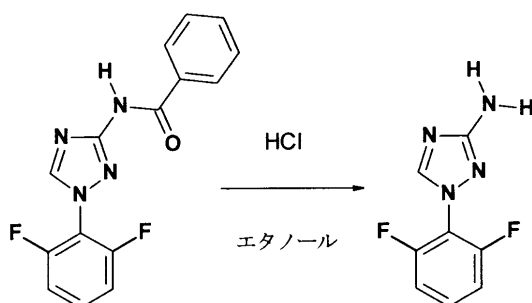
【0333】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.59; 質量 (m/z): 301 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.496 (m, 4H), 7.594 (m, 1H), 7.701 (m, 1H), 7.987 (m, 2H), 8.939 (s, 1H), 11.049 (s, 1H)

【0334】

段階2: 1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン

【化67】



30

40

【0335】

N-[1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド (1.2 g) を初めに 15 ml のエタノールに添加し、3 ml の濃塩酸を添加し、次いで、混合物を還流下で 8 時間攪拌した。次に、反応混合物を減圧化で濃縮し、残渣を水に取り、および水酸化ナトリウム溶液 (pH 9) の添加によってアルカリ性にした。混合物を室温で 30 分間攪拌し、固形物を吸引ろ過し、ジエチルエーテルで攪拌し、乾燥させた。これによって 0.7 g の表題化合物を得た。

【0336】

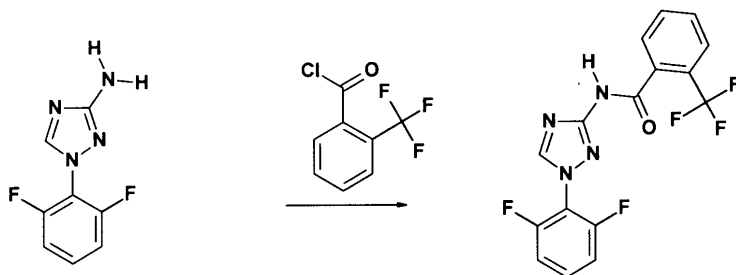
HPLC-MS: log P (中性) = 0.61; 質量 (m/z): 197.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 5.664 (

50

s, 2H), 7.365 (m, 2H), 7.664 (m, 1H), 8.401 (s, 1H).

【0337】

第3の段階：2-トリフルオロメチル-N-[1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド
【化68】



10

【0338】

1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン (1.00 g) を、ジクロロメタン (60 ml) 中のピリジン (2.67 g) 溶液に添加し、およびジクロロメタン (15 ml) 中の2-トリフルオロメチルベンゾイルクロリド (2.585 g) 溶液を0℃～5℃で20分以内に滴下しながら添加した。添加を終えた後、混合物を0℃～5℃で3時間攪拌させた。次に、反応溶液をさらにジクロロメタン (60 ml) で希釈し、希塩酸 (50 ml) で2回および水で1回洗浄した。有機相を取り除き、乾燥および濃縮した。残った残渣を、シクロヘキサン／酢酸エチルを溶離液として用いて、シリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。これによって3.00 gの表題化合物を得た。

20

【0339】

HPLC-MS: log P = 1.97; 質量 (m/z): 369.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.458 (m, 2H), 7.714-7.843 (m, 5H), 8.906 (s, 1H), 11.360 (s, 1H).

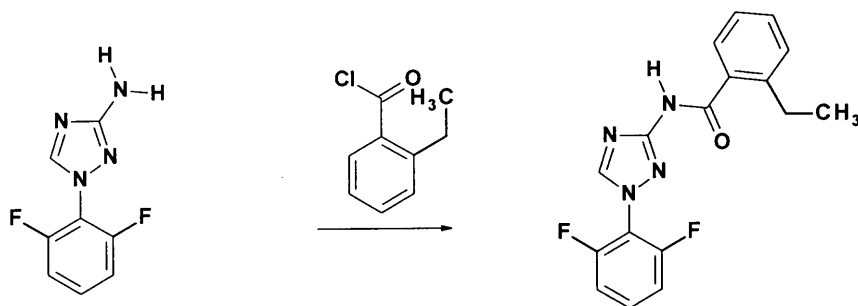
【0340】

実施例3：

2-エチル-N-[1-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド (表1、実施例I-1-15)

30

【化69】



40

【0341】

1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン (0.12 g) を、ジクロロメタン (6 ml) 中のピリジン (0.145 g) 溶液に添加し、およびジクロロメタン (15 ml) 中の2-エチルベンゾイルクロリド (0.113 g) 溶液を0℃～5℃で20分以内に滴下しながら添加した。添加を終えた後、混合物を0℃～5℃で3時間攪拌し、室温で一晩攪拌した。次に、反応溶液をさらにジクロロメタンで希釈し、希塩酸で2回、および、水で1回洗浄した。有機相を取り除き、乾燥および濃縮した。残った残渣をシクロヘキサン／酢酸エチルを溶離液として用いて、シリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。これによって0.102 gの表題化合物を得た。

50

【0342】

HPLC-MS: log P (中性) = 2.05; mass 329.1 (m/z): (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 1.177 (tr, 3H), 2.747 (q, 2H), 7.264-7.337 (m, 2H), 7.398-7.479 (m, 4H), 7.676-7.751 (m, 1H), 8.887 (s, 1H), 11.002 (s, 1H).

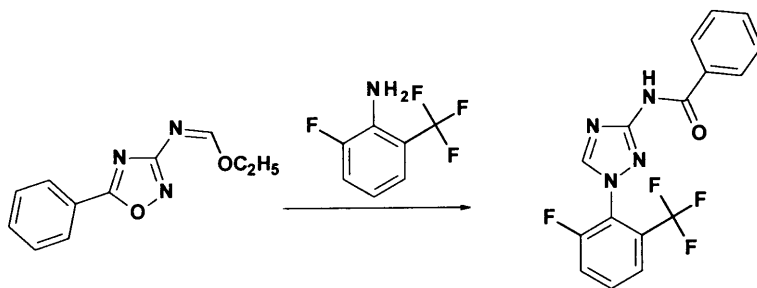
【0343】

実施例 4

N- {1- [2-フルオロ-6- (トリフルオロメチル) フェニル] -1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル} -2-ヨードベンズアミド (表1、実施例 I-1-28)

段階1: N- {1- [2-フルオロ-6- (トリフルオロメチル) フェニル] -1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル} ベンズアミド

【化70】



【0344】

エチル [5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (2.50 g) および 2-フルオロ-6-トリフルオロメチルアニリン (2.061 g) を 150 °C で一晩攪拌し、反応混合物を冷まし、次いで、20 ml のエタノールを添加した。混合物を室温でさらに 45 分間攪拌し、おおよび残った固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。粗生成物をシクロヘキサン/酢酸エチルを溶離液として用いて、シリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。抽出物の濃縮によって 1.1 g の表題化合物を得た。

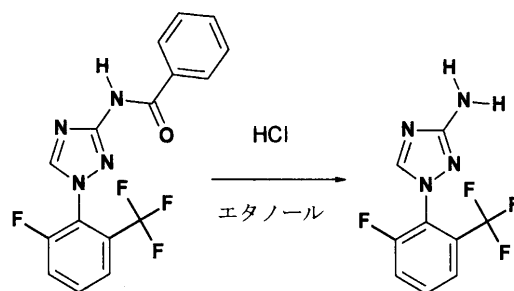
【0345】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.95; 質量 (m/z): 351 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.501 (m, 2H), 7.601 (m, 1H), 7.883-7.984 (m, 5H), 8.893 (s, 1H), 11.038 (s, 1H).

【0346】

段階2: 1- [2-フルオロ-6- (トリフルオロメチル) フェニル] -1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-アミン

【化71】



【0347】

N- {1- [2-フルオロ-6- (トリフルオロメチル) フェニル] -1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル} ベンズアミド (1.2 g) を初めに 20 ml のエタノールに添加し、5 ml の濃塩酸を添加し、次いで、混合物を還流下で 8 時間攪拌した。次に、反応混合物を減圧化で濃縮し、残渣を水に取り、おおよび水酸化ナトリウム溶液 (pH 9)

を添加してアルカリ性にした。混合物を室温でさらに30分間攪拌し、および固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。これによって0.57gの表題化合物を得た。

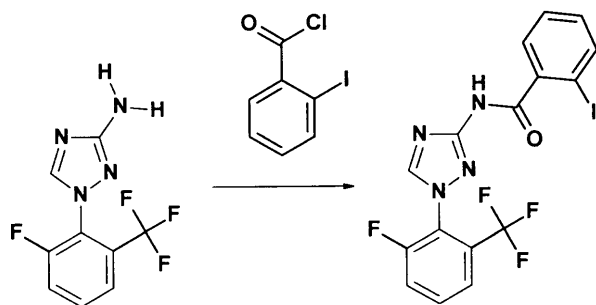
【0348】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.09; purity = 99.3%; 質量 (m/z): 247.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 5.638 (s, 2H), 7.797-7.876 (m, 3H), 8.346 (s, 1H).

【0349】

段階3: N- { 1 - [2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル } - 2 - ヨードベンズアミド

【化72】



10

【0350】

ピリジン (0.116g) を初めにジクロロメタン (10ml) に添加し、1-[2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン (0.120g) を添加し、次いで、2-ヨードベンゾイルクロリド (0.143g) を0℃で添加した。次に、混合物を0℃で3時間攪拌し、次いで、室温で一晩攪拌した。反応混合物をジクロロメタンで希釈した後、有機相を希塩酸で洗浄して有機相を取り除き、減圧化で乾燥および濃縮した。粗生成物をシクロヘキサン/酢酸エチルを溶液として用いて、シリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。抽出物の濃縮によって0.12gの表題化合物を得た。

20

【0351】

HPLC-MS: log P (中性) = 2.21; 質量 (m/z): 477 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.199-7.218 (m, 1H), 7.472 (m, 2H), 7.892-7.953 (m, 4H), 8.843 (s, 1H), 11.172 (s, 1H).

30

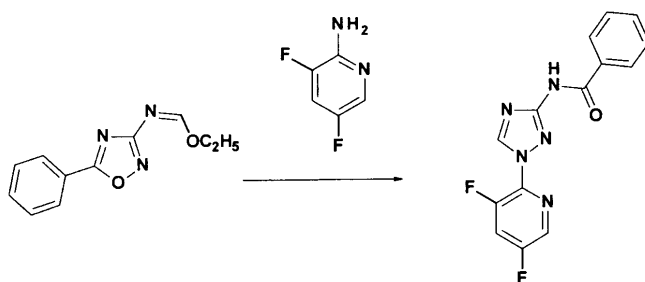
【0352】

実施例5:

N- [1 - (3, 5 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド

段階1: N- [1 - (3, 5 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] ベンズアミド

【化73】



40

【0353】

エチル [5 - フェニル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] イミドホルメート (2.50g) および 3, 5 - ジフルオロピリジン - 2 - アミン (1.497g) を15

50

0℃で4時間加熱し、反応混合物を冷まし、次いで、10mlのエタノールを添加した。混合物を室温で45分間攪拌し、および残った固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。これによって2.50gの所望する生成物を得た。

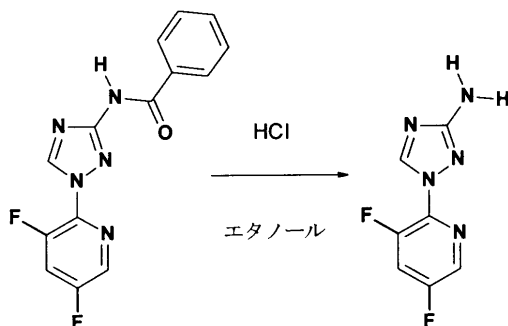
【0354】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.36; 質量 (m/z): 302.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.514-7.577 (m, 2H), 7.596-7.636 (m, 1H), 7.997 (m, 2H), 8.359-8.412 (m, 1H), 8.587 (d, 1H), 9.103 (s, 1H) 11.062 (s, 1H).

【0355】

段階2: 1-(3,5-ジフルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン

【化74】



【0356】

N-[1-(3,5-ジフルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド(2.4g)を25mlのエタノールに添加し、4mlの濃塩酸を添加し、次いで、混合物を還流下で8時間攪拌した。次に、反応混合物を減圧化で濃縮し、残渣を水に取り、および水酸化ナトリウム溶液(pH8)を添加してアルカリ性にした。混合物を室温で30分間攪拌し、固形物を吸引ろ過し、乾燥させた。これによって0.130gの表題化合物を得た。

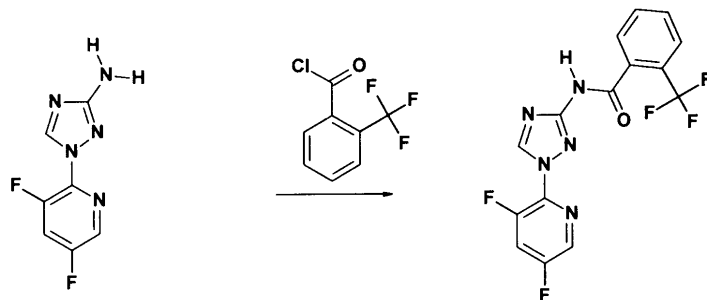
【0357】

HPLC-MS: log P = 0.30; 質量 (m/z): 198 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 5.808 (s, 2H), 8.219-8.273 (m, 1H), 8.455 (d, 1H), 8.663 (s, 1H).

【0358】

段階3: N-[1-(3,5-ジフルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド

【化75】



【0359】

ピリジン(2.934g)中の1-(3,5-ジフルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-アミン(0.10g)に、0℃で、2-トリフルオロメチルベンゾイルクロリド(0.116g)を添加した。添加を終えた後、混合物を室温で一晩攪拌し、反応混合物を希塩酸と攪拌し、残った固形物をろ過および水で洗浄した。乾燥によって0.150gの所望する表題化合物を得た。

10

20

30

40

50

【 0 3 6 0 】

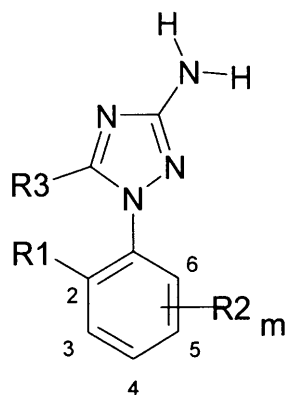
HPLC-MS: log P = 1.76; 質量 (m/z): 370 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.706-7.847 (m, 4H), 8.377(m, 1H), 8.575 (s, 1H), 9.058 (s, 1H), 11.369 (s, 1H).

【 0 3 6 1 】

R 3 が水素である次の式 (I I a - 1) :

【 0 3 6 2 】

【 化 7 6 】



10

の化合物を、前述した実施例と同様に得た。

20

【 0 3 6 3 】

【表 1】

R1	R2 _m	logP (中性)	¹ H NMR (DMSO-D ₆)
F	—	0.86	8.5 (s, 1H), 7.709 (m, 1H), 7.483 (m, 1H), 7.385 (m, 2H), 5.749 (s, 2H)
Cl	—	0.96	5.624 (s, 2H), 7.680 (m, 1H), 7.497 (m, 2H), 7.592 (m, 2H), 8.438 (s, 2H)
CF ₃	—	1.16	8.279 (s, 1H), 7.937 (m, 1H), 7.858 (m, 1H), 7.737 (m, 1H), 7.641 (m, 2H), 5.578 (s, 2H)
OCF ₃	—	1.44	8.437 (s, 1H), 7.740 (m, 1H), 7.493 – 7.588 (m, 4H), 5.707 (s, 2H)
Br	—	1.03	8.387 (s, 1H), 7.828 (m, 1H), 7.530 (m, 1H), 7.383 (m, 1H), 5.587 (s, 2H)
I	—	1.13	8.314 (s, 1H), 8.002 (m, 1H), 7.544 (m, 1H), 7.447 (m, 1H), 7.259 (m, 1H), 5.539 (s, 2H)
Cl	6-F	0.86	8.365 (s, 1H), 7.475 – 7.602 (m, 3H), 5.623 (s, 2H)
Br	6-Br	1.2	8.291 (s, 1H), 7.865 (m, 2H), 7.433 (m, 1H), 5.564 (s, 2H)
F	6-I	1.07	8.309 (s, 1H), 7.839 (m, 1H), 7.512 (m, 1H), 7.381 (m, 1H), 5.580 (s, 2H)
F	6-CH ₃	1.03	8.271 (s, 1H), 7.408 (m, 1H), 7.287 (m, 1H), 7.175 (m, 1H), 5.510 (s, 2H), 2.237 (s, 3H)
Cl	6-CH ₃	1.12	8.228 (s, 1H), 7.509 (m, 1H); 7.419 (m, 1H), 7.419 (m, 1H), 5.517 (s, 2H), 2.498 (s, 3H)
Cl	6-C ₂ H ₅	1.12	8.249 (s, 1H), 7.523 (m, 2H), 7.401 (m, 1H), 5.512 (s, 2H), 2.397 (q, 2H), 1.036 (t, 3H)
Cl	6% Cl:	0.94	8.327 (s, 1H), 7.690 (m, 2H), 7.548 – 7.585 (m, 1H), 5.593 (s, 2H)
CH ₃	6-OCH ₃	0.98	8.039 (s, 1H), 7.348 (m, 1H), 7.029 (m, 1H), 6.948 (m, 1H); 5.364 (s, 2H), 3.718 (s, 3H), 2.043 (s, 3H)
Cl	3-Cl	1.41	8.483 (broad, 1H), 7.756 (s, 1H), 7.588 (t, 2H), 2.837, 492 (m, 2H), 5.681 (s, 3H).
Cl	4-Cl	1.48	8.461 (s, 1H), 7.885 (m, 1H), 7.587 (m, 2H), 5.677 (s, 2H)
Cl	5% Cl:	1.44	8.515 (s, 1H), 7.713 (m, 2H), 7.526 (m, 1

10

20

30

40

R1	R2 _m	logP (中性)	¹ H NMR (DMSO-D ₆)
			H), 5.717 (s, 2H)
F	3,6-F ₂ -phenyl	0.84	8.455 (s, 1H), 7.710 (m, 1H), 7.454 (m, 1H), 5.761 (s, 2H)
F	4,6-F ₂	0.82	8.379 (s, 1H), 7.521 (m, 2H), 5.675 (s, 2H)
F	3,4,5,6-F ₄	1.31	8.484 (s, 1H), 5.868 (s, 2H)
Br	6-Br-4-F	1.35	8.276 (s, 1H), 7.939 (m, 2H), 5.575 (s, 2H)

10

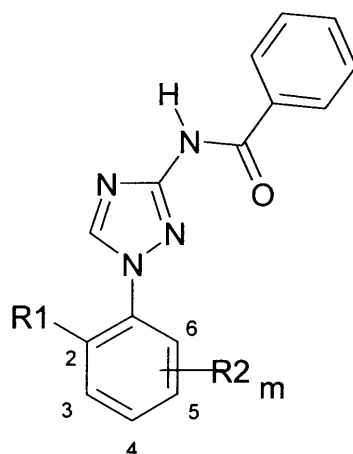
【0364】

次のN-[1-アリール-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]ベンズアミド
(合成スキーム1の式(1-9)を参照)を、前述した実施例と同様に得た：

【0365】

【化77】

20



30

【0366】

【表 2】

R1	R2 _m	logP (中性)	¹ H NMR (DMSO-D ₆)
F	—	1.69	11.030 (s, 1H), 8.962 (s, 1H), 8.015 (m, 2H), 7.842 (m, 1H), 7.588 (m, 5H), 7.449 (m, 1H)
Cl	—	1.75	10.999 (s, 1H), 8.906 (s, 1H), 8.006 (m, 2H), 7.776 (m, 1H), 7.719 (m, 1H), 7.694 (m, 3H), 7.523 (m, 2H)
CF ₃	—	1.91	10.985 (s, 1H), 8.819 (s, 1H), 7.756 – 7.991 (m, 6H), 7.610 (m, 1H), 7.520 (m, 2H)
OCF ₃	—	2.15	11.018 (s, 1H), 8.920 (s, 1H), 8.011 (m, 2H), 7.828 (m, 1H), 7.697 (m, 4H) 7.5088 (m, 2H)
Br	—	1.80	11.001 (s, 1H), 8.876 (s, 1H), 7.987 (m, 2H), 7.899 (m, 1H), 7.504 – 7.679 (m, 6H)
I	—	1.87	10.994 (s, 1H), 8.824 (s, 1H), 7.988 – 8.098 (m, 3H), 7.585 – 7.604 (m, 4H), 7.364 (m, 1H)
Cl	6-F	1.75	11.050 (s, 1H), 8.907 (s, 1H), 8.002 (m, 2H), 7.572 – 7.710 (m, 4H), 7.504 (m, 2H)
F	6-CH ₃	1.89	10.924 (s, 1H), 8.778 (s, 1H), 8.001 (m, 2H), 7.605 (m, 1H), 7.503 (m, 3H), 7.380 (m, 1H), 7.269 (m, 1H), 2.247 (s, 3H)
F	6-I	1.79	11.047 (s, 1H), 8.857 (s, 1H), 7.989 (m, 3H), 7.424 – 7.604 (m, 5H)
Cl	6-CH ₃	1.92	10.990 (s, 1H), 8.781 (s, 1H) 8.004 (m, 2H), 7.579 (m, 2H), 7.501 (m, 4H), 2.111 (s, 3H)
Cl	6-C ₂ H ₅	2.2	10.977 (s, 1H), 8.812 (s, 1H), 8.004 (m, 2H), 7.489 – 7.592 (m, 6H), 2.383 (q, 2H), 1.061 (t, 3H)
Cl	6-Cl	1.8	11.062 (s, 1H), 8.875 (s, 1H), 7.985 (m, 2H), 7.780 (m, 7H), 7.500 – 7.701 (m, 4H)
Br	6-Br	2.00	11.075 (s, 1H), 8.845 (s, 1H), 8.203 (m, 1H), 7.823 – 8.036 (m, 3H), 7.499 – 7.695 (m, 4H)
CH ₃	6-OCH ₃	1.76	10.861 (s, 1H), 8.584 (s, 1H), 7.997 (m, 2H), 7.616 (m, 1H), 7.516 (m, 1H), 7.498 (m, 1H), 7.111 (m, 1H), 7.004 (m, 1H), 3.758 (s, 3H), 2.060 (s, 3H)
Cl	3-Cl	2.11	11.043 (s, 1H), 8.939 (s, 1H), 7.985 (m, 2H), 7.505 – 7.627 (m, 6H)

10

20

30

40

R1	R2 _m	logP (中性)	¹ H NMR (DMSO-D ₆)
Cl	4-Cl	2.18	11.031 (s, 1H), 8.912 (s, 1H), 8.002 (m, 3H), 7.750 (m, 2H), 7.551 (m, 3H)
Cl	5-Cl	2.17	11.059 (s, 1H), 8.942 (s, 1H), 8.005 (m, 2H), 7.987 (m, 1H), 7.794 (m, 1H), 7.703 (m, 1H), 7.628 (m, 1H), 7.507 (m, 2H)
F	3,6-F ₂	1.73	11.102 (s, 1H), 8.971 (s, 1H), 7.898 (m, 3H), 7.805 (m, 1H), 7.560 (m, 1H), 7.510 (m, 3H)
F	4,6-F ₂	1.71	11.056 (s, 1H), 8.911 (s, 1H), 7.981 (m, 2H), 7.611 (m, 3H), 7.506 (m, 2H)
Br	6-Br-4-F	2.14	11.088 (s, 1H), 8.827 (s, 1H), 8.205 (m, 1H), 8.001 (m, 3H), 7.733 (m, 1H), 7.582 (m, 3H)
F	3,4,5,6-F ₄	2.11	11.163 (s, 1H), 8.991 (s, 1H), 7.986 (m, 2H), 7.528 - 7.652 (m, 3H)

10

20

【0367】

文献 (Heterocycles, 57, 811-823) によって公知である方法を利用して調製可能である、適切に置換された 3-アミノ-5-アリール-1, 2, 4-オキサジアゾールを処理して、所望する式 (I-1) の化合物を、適切に置換されたアルキル [5-アリール-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (2-8) と適切なアニリン類の反応によって直接調製することが可能である。

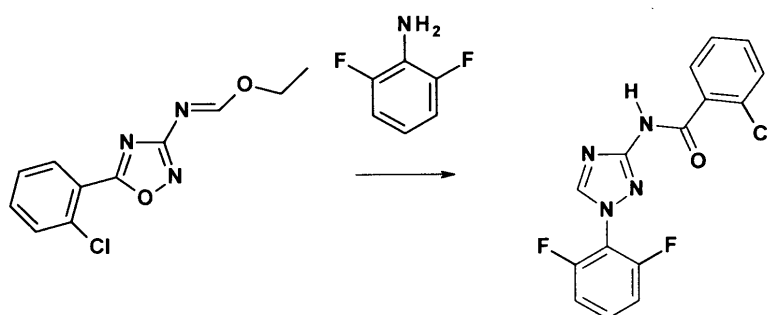
【0368】

実施例 6 :

2-クロロ-N-[1-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル] ベンズアミド

30

【化78】



40

【0369】

エチル [5-(2-クロロフェニル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] イミドホルメート (0.1 g) および 2, 6-ジフルオロアニリン (0.05 g) を、マイクロ波装置で 170 °C および 250 ワットで 30 分間攪拌した。残った残渣を、シクロヘキサン/酢酸エチルを溶離液として使用したシリカゲル上のクロマトグラフィーで精製した。抽出物の濃縮によって 0.017 g の表題化合物を得た。

【0370】

HPLC-MS: log P (中性) = 1.73; 質量 (m/z): 257 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.416-7.750 (m, 7H); 8.891 (s, 1H); 11.272 (s, 1H).

50

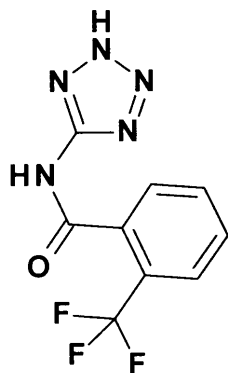
【0371】

実施例7：

N-[2-(2-メトキシフェニル)-2H-テトラゾール-5-イル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(表2、実施例I-2-1)

段階1：N-(2H-テトラゾール-5-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド

【化79】



10

【0372】

20

2H-テトラゾール-5-アミン水和物(200mg)をN,N-ジメチルホルムアミド(1ml)に添加し、トリエチルアミン(294mg)を0℃で添加し、混合物を0℃で1時間攪拌した。次に、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド(607mg)を0℃で滴下して添加し、混合物を0℃でさらに2時間攪拌し、室温まで暖めた。無色の固形物が沈殿し、ろ過および乾燥させた。これによって73mgの表題化合物を得た。母液を、溶離液が水/1%ギ酸/アセトニトリルであるカラムクロマトグラフィーで精製した(勾配=95%水/1%ギ酸から100%アセトニトリルまで30分)。これによってさらに110mgの表題化合物を得た。

【0373】

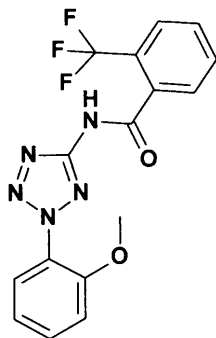
HPLC-MS: logP = 1.17; 質量 (m/z): 258.1 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.71-7.93 (m, 4 H), 12.6 (s, 1H), 16.2 (s, 1H).

30

【0374】

段階2：N-[2-(2-メトキシフェニル)-2H-テトラゾール-5-イル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド

【化80】



40

【0375】

(2-メトキシフェニル)ボロン酸(144mg)をN,N-ジメチルホルムアミド(1.5ml)に添加し、次いでN-(2H-テトラゾール-5-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(122mg)、酢酸銅(II)(129mg)、ピリジン(75mg)および3Åの分子ふるい(28mg)を続けて添加し、次いで、混合物を室温

50

で48時間攪拌した。反応混合物をケイソウ土によって吸引ろ過し、減圧化で乾燥するまで濃縮した。残渣を酢酸エチルに取り、1 Nの塩酸で洗浄し、および有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、減圧化で乾燥するまで濃縮した。残渣を移動相、水／アセトニトリルを用いた分取HPLCでクロマトグラフィーにかけた（勾配＝水中10％アセトニトリルから100％アセトニトリルまで40分間）。これによって2.3 mgの表題化合物を得た。

【0376】

HPLC-MS: $\log P = 2.19$; 質量 (m/z): 364.1 ($M+H$)⁺; ¹H NMR (CD₃CN) 3.85 (s, 3H) 7.14-7.16 (m, 1H), 7.21-7.23 (m, 1H), 7.49-7.51 (m, 2H), 7.58-7.61 (m, 1H), 7.67-7.70 (m, 2H), 7.77-7.78 (m, 1H), 9.20 (s, 1H).

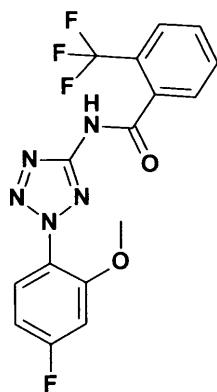
10

【0377】

実施例8：

N-[2-(4-フルオロ-2-メトキシフェニル)-2H-テトラゾール-5-イル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (表2、実施例I-2-2)

【化81】



20

【0378】

(4-フルオロ-2-メトキシフェニル)ボロン酸(74 mg)をN,N-ジメチルホルムアミド(1.5 ml)に添加し、次いで、N-(2H-テトラゾール-5-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(61 mg)、酢酸銅(II)(59 mg)、ピリジン(35 mg)および3 Åの分子ふるい(28 mg)を添加し次いで、混合物を室温で48 h攪拌した。反応混合物をシリカゲルに吸着させ、まずは溶離液が水／1％ギ酸／アセトニトリルであるカラムクロマトグラフィーで精製し（勾配＝95％水から100％アセトニトリルまで15分）、次いで、再度、溶離液が水／1％ギ酸／アセトニトリルである分取HPLCでクロマトグラフィーにかけた（勾配＝水中10％アセトニトリル／1％ギ酸から100％アセトニトリルまで40分）。これによって1.5 mgの表題化合物を得た。

30

【0379】

HPLC-MS: $\log P = 2.35$; 質量 (m/z): 382.2 ($M+H$)⁺; ¹H NMR (CD₃CN) 3.82 (s, 3H) 6.89-6.92 (m, 1H), 7.01-7.03 (m, 1H), 7.52-7.54 (m, 2H), 7.67-7.72 (m, 2H), 7.78-7.79 (m, 1H), 9.23 (s, 1H).

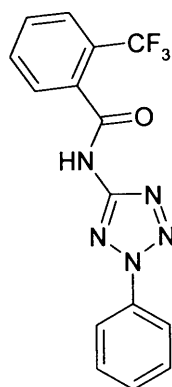
40

【0380】

実施例9：

N-(2-フェニル-2H-テトラゾール-5-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (表2、実施例I-2-3)

【化 8 2】



10

【 0 3 8 1 】

2-フェニル-2H-テトラゾール-5-アミン (150 mg) をジクロロメタン (4 ml) に添加し、トリエチルアミン (141 mg) および 2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド (427 mg) を 0~5℃ で添加し、次いで、混合物を室温で一晩攪拌した。5 ml のジクロロメタンを反応混合物に添加し、この混合物を次いで水で洗浄し、有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、および減圧化で乾燥するまで濃縮した。残渣を溶離液として水/アセトニトリルを用いたカラムクロマトグラフィーで精製した (勾配 = 95% 水から 100% アセトニトリルまで 30 分)。これによって 59.7 mg の表題化合物を得た。

20

【 0 3 8 2 】

HPLC-MS: logP = 2.57; 質量 (m/z): 334.0 (M+H)⁺; ¹H NMR (DMSO-D₆) 7.59-7.95 (m, 7H), 8.05-8.15 (m, 2H), 12.0 (s, 1H).

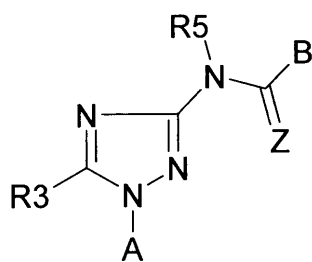
【 0 3 8 3 】

表 1 および表 2 で示す式 (I-1) および (I-2) の化合物は、上記の実施例に従って、または、上記の実施例と同様にして得られた好ましい化合物である。

表 1

【化 8 3】

30



(1-1)

40

【 0 3 8 4 】

【表 3】

化合物の 番号	A	B	R 3	R 5	Z
I-1-1	2-フルオロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-2	2-フルオロフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-3	2-クロロフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-4	2-クロロフェニル	2-ブromoフェニル	H	H	O
I-1-5	2-クロロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-6	2-クロロフェニル	2, 6-ジフルオロフ ェニル	H	H	O
I-1-7	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-8	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-9	2-(トリフルオロメ トキシ) フェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-10	2-(トリフルオロメ トキシ) フェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-11	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-12	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-ブromoフェニル	H	H	O
I-1-13	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-14	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-メチルフェニル	H	H	O
I-1-15	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-16	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-メトキシフェニル	H	H	O
I-1-17	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-(トリフルオロメ トキシ) フェニル	H	H	O
I-1-18	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-(ジフルオロメチ ル) フェニル	H	H	O
I-1-19	2, 6-ジフルオロフ ェニル	5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-20	2, 6-ジフルオロフ ェニル	2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-21	2, 6-ジフルオロフ	2-ヨードフェニル	H	H	O

10

20

30

40

化合物の 番号	A	B	R 3	R 5	Z
	エニル				
I-1-22	2, 6-ジフルオロフェニル	2-ニトロフェニル	H	H	O
I-1-23	2, 6-ジフルオロフェニル	2-クロロピリジン-3-イル	H	H	O
I-1-24	2, 6-ジフルオロフェニル	3-(トリフルオロメチル) ピラジン-2-イル	H	H	O
I-1-26	2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-27	2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-28	2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-29	2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-30	2-ブロモ-6-フルオロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-31	2-ブロモ-6-フルオロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-32	2-ブロモ-6-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-33	2-クロロ-6-フルオロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-34	2-クロロ-6-フルオロフェニル	2-(トリフルオロメトキシ) フェニル	H	H	O
I-1-35	2-クロロ-6-フルオロフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-36	2-クロロ-6-フルオロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-37	2-フルオロ-6-メチルフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-38	2-フルオロ-6-メチルフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-39	2-フルオロ-6-メチルフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-40	2-クロロ-6-メチ	2-(トリフルオロメ	H	H	O

10

20

30

40

化合物の 番号	A	B	R 3	R 5	Z
	ルフェニル	チル) フェニル			
I-1-41	2-クロロ-6-メチルフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-42	2-クロロ-6-エチルフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-43	2-クロロ-6-エチルフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-44	2, 6-ジクロロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-45	2, 6-ジクロロフェニル	2-ブロモフェニル	H	H	O
I-1-46	2, 6-ジクロロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-47	2, 6-ジメチルフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-48	2, 6-ジメチルフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-49	2-メトキシ-6-メチルフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-50	2-メトキシ-6-メチルフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-51	2, 3-ジクロロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-52	2, 3-ジクロロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-53	2, 4-ジクロロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-54	2, 5-ジクロロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-55	2, 5-ジクロロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-57	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O
I-1-58	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-59	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-60	2, 3, 6-トリフルオロフェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-61	2, 4, 6-トリフルオロフェニル	2-(トリフルオロメチル) フェニル	H	H	O

10

20

30

40

化合物の 番号	A	B	R 3	R 5	Z
I-1-62	2, 4, 6-トリフル オロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-63	2, 4, 6-トリフル オロフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-64	2, 4, 6-トリフル オロフェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-65	ペンタフルオロフェニ ル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-66	ペンタフルオロフェニ ル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-67	ペンタフルオロフェニ ル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-68	ペンタフルオロフェニ ル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-70	2-ブロモフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-71	2-ブロモフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-72	2-ブロモフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-73	2-ブロモフェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-75	2-ヨードフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-76	2-ヨードフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-77	2-ヨードフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-78	2-ヨードフェニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-80	2, 6-ジブロモフェ ニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-81	2, 6-ジブロモフェ ニル	2-エチルフェニル	H	H	O
I-1-83	2-フルオロ-6-ヨ ードフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-84	2-フルオロ-6-ヨ ードフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-85	2-フルオロ-6-ヨ ードフェニル	2-ヨードフェニル	H	H	O
I-1-87	2, 6-ジブロモ-4 -フルオロフェニル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-88	2, 6-ジブロモ-4 -フルオロフェニル	2-クロロフェニル	H	H	O
I-1-89	3, 5-ジフルオロピ リジン-2-イル	2-(トリフルオロメ チル) フェニル	H	H	O
I-1-90	2, 4-ジメチル-5	2-(トリフルオロメ	H	H	O

10

20

30

40

化合物の 番号	A	B	R 3	R 5	Z
	－ (2, 2, 2－トリ フルオロエチルスル フィニル) フェニル	チル) フェニル			
I－1－9 1	2, 6－ジフルオロ フェニル	3－ (トリフルオロ メチル) －2－ピリ ジル	H	H	O
I－1－9 2	2, 3, 5, 6－テ トラフルオロフェ ニル	2－クロロフェ ニル	H	H	O
I－1－9 3	2, 3, 5, 6－テ トラフルオロフェ ニル	2－ (トリフルオ ロメチル) フェ ニル	H	H	O
I－1－9 4	2, 6－ジフルオ ロフェニル	2－ヨード－3－ チエニル	H	H	O
I－1－9 5	2－ (トリフル オロメチル) フェ ニル	2－エチルフェ ニル	H	H	O
I－1－9 6	2, 4－ジメチル － (2, 2, 2－トリ フルオロエチルス ルホニル) フェ ニル	2－ (トリフル オロメチル) フェ ニル	H	H	O
I－1－9 7	2, 3, 5－トリ フルオロフェ ニル	2－ヨードフェ ニル	H	H	O
I－1－9 8	2, 4－ジメチル － (2, 2, 2－トリ フルオロエチルス ルフィニル) フェ ニル	2－ (トリフル オロメチル) フェ ニル	H	H	O

10

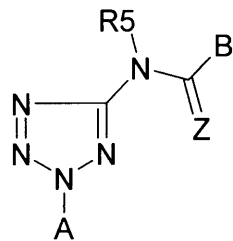
20

30

【0385】

表 2

【化84】



(I-2)

40

【0386】

【表 4】

化合物の番号	A	B	R 5	Z
I-2-1	2-メトキシフェニル	2-(トリフルオロメチル)フェニル	H	O
I-2-2	2-メトキシ-4-フルオロフェニル	2-(トリフルオロメチル)フェニル	H	O
I-2-3	フェニル	2-(トリフルオロメチル)フェニル	H	O

10

【0387】

HPLC-MS¹⁾ および ¹H NMRデータ²⁾

【表 5】

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
I-1-1	1.88	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.376 (0.4); 11.249 (9.8); 8.902 (4.2); 8.316 (0.6); 7.797 (1.5); 7.574 (4.1); 7.557 (11.7); 7.536 (16.0); 7.526 (8.6); 7.503 (6.1); 7.483 (3.0); 7.457 (4.6); 7.440 (7.7); 7.421 (6.0); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 3.322 (67.1); 2.675 (1.6); 2.670 (2.2); 2.666 (1.6); 2.524 (6.6); 2.510 (129.2); 2.506 (257.8); 2.501 (336.7); 2.497 (243.3); 2.493 (117.8); 2.333 (1.6); 2.328 (2.2); 2.324 (1.6); 1.989 (2.0); 1.398 (1.6); 1.192 (0.5); 1.175 (1.1); 1.157 (0.5); 0.146 (0.6); 0.008 (5.3); 0.000 (148.8); -0.009 (5.3); -0.150 (0.6)
I-1-2	2.06	¹ H NMR (400.0 MHz, δ -DMSO): δ = 13.578 (5.8); 11.334 (8.4); 8.915 (4.8); 7.849 (11.3); 7.830 (16.0); 7.802 (9.4); 7.783 (7.6); 7.768 (9.4); 7.746 (7.6); 7.725 (10.0); 7.707 (11.0); 7.615 (0.8); 7.555 (8.3); 7.536 (10.6); 7.422 (5.0); 5.758 (9.4); 3.330 (11.7); 2.999 (0.8); 2.714 (0.8); 2.676 (1.1); 2.671 (1.4); 2.667 (1.0); 2.507 (171.8); 2.502 (215.8); 2.498 (158.1); 2.334 (1.1); 2.329 (1.4); 2.325 (1.0); 1.234 (0.4); 0.008 (2.5); 0.000 (43.7); -0.008 (2.1)
I-1-3	2.10	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.300 (7.0); 8.874 (6.1); 8.838 (1.2); 8.317 (0.4); 7.911 (0.5); 7.893 (0.6); 7.841 (7.4); 7.823 (9.7); 7.759 (12.1); 7.748 (11.3); 7.704 (16.0); 7.581 (13.1); 7.457 (0.5); 7.452 (0.5); 7.439 (0.5); 7.393 (0.4); 7.364 (0.3); 6.264 (0.5); 4.038 (0.4); 4.020 (0.4); 3.326 (89.6); 3.090 (0.5); 3.072 (0.5); 2.679 (0.5); 2.675 (1.0); 2.671 (1.3); 2.666 (0.9); 2.661 (0.4); 2.524 (4.0); 2.519 (6.3); 2.510 (72.2); 2.506 (144.2); 2.501 (190.8); 2.497 (138.3); 2.492 (66.0); 2.368 (0.6); 2.337 (0.4); 2.333 (0.9); 2.328 (1.3); 2.324 (0.9); 2.319 (0.4); 2.224 (0.3); 2.050 (2.1); 1.989 (1.9); 1.192 (0.8); 1.188 (1.4); 1.174 (1.5); 1.170 (2.8); 1.157 (0.8); 1.152 (1.4); 0.008 (2.0); 0.000 (57.8); -0.009 (1.8)
I-1-4	1.97	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.388 (3.7); 11.202 (4.9); 8.857 (3.3); 8.437 (1.2); 8.316 (0.6); 7.759 (4.1); 7.746 (10.8); 7.741 (11.9); 7.726 (14.1); 7.723 (16.0); 7.707 (13.8); 7.703 (14.4); 7.684 (5

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		.9); 7.661 (1.6); 7.656 (1.4); 7.626 (2.0); 7.622 (2.2); 7.606 (3.5); 7.602 (4.1); 7.596 (5.9); 7.591 (7.1); 7.580 (8.9); 7.572 (7.0); 7.547 (3.4); 7.529 (3.3); 7.490 (5.7); 7.486 (6.1); 7.472 (13.2); 7.468 (12.3); 7.453 (15.6); 7.449 (11.2); 7.447 (10.8); 7.433 (9.1); 7.428 (9.5); 7.415 (4.9); 7.410 (5.3); 7.388 (2.0); 7.377 (1.5); 7.373 (1.3); 7.359 (1.4); 7.357 (1.4); 7.353 (1.6); 7.348 (0.6); 7.345 (0.5); 7.338 (1.3); 7.334 (1.2); 7.330 (0.5); 7.243 (1.1); 7.240 (1.1); 7.224 (1.3); 7.220 (1.4); 7.205 (0.8); 7.201 (0.7); 6.971 (1.5); 6.968 (1.5); 6.951 (1.4); 6.947 (1.3); 5.756 (0.9); 5.624 (0.8); 3.859 (0.4); 3.506 (0.5); 3.323 (49.0); 2.753 (0.3); 2.680 (0.8); 2.675 (1.7); 2.671 (2.3); 2.666 (1.6); 2.662 (0.8); 2.524 (7.8); 2.511 (130.0); 2.506 (256.8); 2.502 (336.5); 2.497 (242.5); 2.493 (115.9); 2.337 (0.8); 2.333 (1.7); 2.328 (2.3); 2.324 (1.7); 1.234 (1.2); 1.223 (0.4); 0.146 (0.8); 0.008 (7.4); 0.000 (191.7); -0.009 (6.2); -0.150 (0.8)
I-1-5	1.91	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.214 (7.8); 8.857 (5.4); 8.317 (0.4); 7.759 (5.9); 7.741 (7.2); 7.691 (3.2); 7.610 (3.8); 7.597 (9.3); 7.591 (11.0); 7.580 (16.0); 7.572 (12.8); 7.551 (9.4); 7.531 (9.7); 7.512 (5.3); 7.494 (7.1); 7.475 (4.0); 7.449 (5.6); 7.432 (6.6); 7.414 (2.8); 3.326 (140.3); 2.680 (0.4); 2.675 (0.9); 2.670 (1.2); 2.666 (0.9); 2.661 (0.4); 2.524 (3.7); 2.519 (5.8); 2.510 (68.9); 2.506 (137.5); 2.501 (180.8); 2.497 (130.3); 2.492 (61.2); 2.337 (0.4); 2.333 (0.9); 2.328 (1.2); 2.324 (0.8); 2.319 (0.4); 1.989 (1.2); 1.397 (0.5); 1.192 (0.3); 1.174 (0.7); 1.157 (0.3); 0.008 (1.6); 0.000 (48.0); -0.009 (1.4)
I-1-6	1.90	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.550 (0.8); 8.893 (1.1); 7.771 (0.4); 7.753 (0.6); 7.735 (0.5); 7.714 (0.6); 7.623 (0.7); 7.605 (1.2); 7.589 (1.3); 7.584 (1.5); 7.579 (1.1); 7.568 (0.8); 7.563 (0.8); 7.546 (0.4); 7.253 (0.6); 7.244 (0.4); 7.232 (1.2); 7.224 (1.5); 7.212 (0.7); 7.204 (1.8); 7.183 (0.8); 3.334 (0.9); 3.098 (0.8); 3.082 (2.3); 3.064 (2.3); 3.049 (0.8); 2.525 (0.6); 2.511 (13.4); 2.507 (26.5); 2.503 (34.4); 2.498 (24.7); 2.494 (11.8); 1.207 (7.9); 1.189 (16.0); 1.171 (7.5); 0.008 (0.8); 0.0

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		00 (22.1); -0.009 (0.7)
I-1-7	2.06	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ =11.193(13.0); 8.766(10.3); 8.317(0.6); 8.014 (12.7); 7.995(15.4); 7.936(5.8); 7.917(14.0); 7.898(10.4); 7.848(11.7); 7.829(16.0); 7.810(7.0); 7.763(6.1); 7.546(10.9); 7.525(14.9); 7.507(9.5); 7.489(11.8); 7.470(6.7); 7.442(8.8); 7.425(10.5); 7.408(4.8); 4.038(1.0); 4.020(1.0); 4.002(0.3); 3.374(0.4); 3.329(376.9); 2.675(1.2); 2.671(1.7); 2.666(1.3); 2.510(101.4); 2.506(196.6); 2.502(255.0); 2.497(185.4); 2.333(1.3); 2.328(1.7); 2.324(1.2); 1.989(4.1); 1.192(1.1); 1.175(2.1); 1.157(1.0); 0.146(1.6); 0.008(14.7); 0.000(330.8); -0.008(13.9); -0.030(0.4); -0.150(1.6)
I-1-8	2.24	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 13.583(0.4); 11.271(6.8); 8.781(6.7); 8.317(1.2); 8.014(6.5); 7.996(7.7); 7.918(7.9); 7.900(6.5); 7.828(16.0); 7.770(11.4); 7.699(12.4); 4.056(0.9); 4.038(2.7); 4.020(2.7); 4.002(0.9); 3.326(281.6); 2.680(0.9); 2.675(1.8); 2.671(2.5); 2.666(1.8); 2.524(7.5); 2.511(143.8); 2.506(285.0); 2.502(372.8); 2.497(268.6); 2.493(128.5); 2.333(1.8); 2.328(2.5); 2.324(1.8); 2.320(0.8); 1.989(11.8); 1.236(0.9); 1.193(3.2); 1.175(6.3); 1.157(3.1); 0.146(2.5); 0.008(23.0); 0.000(543.3); -0.009(20.1); -0.150(2.4)
I-1-9	2.32	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 11.237(11.8); 8.924(0.3); 8.869(6.7); 8.436(0.8); 8.317(0.4); 7.815(3.1); 7.765(2.5); 7.746(2.4); 7.734(1.0); 7.698(3.9); 7.679(16.0); 7.661(12.7); 7.657(11.7); 7.643(10.6); 7.628(7.8); 7.610(3.7); 7.554(7.8); 7.531(11.3); 7.520(9.1); 7.497(8.7); 7.478(4.7); 7.451(6.4); 7.434(8.8); 7.415(4.9); 7.399(1.4); 7.394(1.2); 5.705(0.7); 4.056(0.3); 4.038(1.0); 4.020(1.0); 4.003(0.3); 3.328(53.3); 2.676(0.9); 2.671(1.2); 2.667(0.9); 2.507(143.1); 2.502(181.9); 2.498(133.6); 2.333(0.9); 2.329(1.2); 2.325(0.9); 2.180(0.4); 1.989(4.4); 1.236(5.8); 1.193(1.2); 1.175(2.3); 1.157(1.2); 0.854(0.6); 0.146(1.2); 0.008(12.0); 0.000(243.9); -0.008(11.6); -0.150(1.2)
I-1-10	2.51	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 13.582(0.5); 11.314(6.1); 8.881(4.7); 8.436(4.3); 8.317(0.8); 7.840(10.6); 7.823(12.1); 7.789(6.1); 7.774(6.4); 7.758(7.4); 7.738(6.7); 7.734(7.6); 7.714(12.2); 7.700(12.3); 7.678(16.0); 7.660(12.5); 7.643(9.8); 7.612(4.0); 7.608(3.9); 7.592(2.2); 7.588(2.4); 7.572(1.3); 7.568(1.4); 7.554(2.2); 7.549(1.8); 7.535(1.9); 7.531(2.3); 7.526(2.0); 7.512(1.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		6); 7.507(1.5); 7.493(0.8); 7.488(0.7); 7.455(0.4); 7.435(0.4); 5.705(3.3); 4.056(0.4); 4.038(1.2); 4.020(1.2); 4.003(0.4); 3.328(217.3); 2.999(1.0); 2.714(1.0); 2.676(1.5); 2.671(2.1); 2.667(1.5); 2.511(120.0); 2.507(233.7); 2.502(303.8); 2.498(219.9); 2.493(106.7); 2.333(1.5); 2.329(2.0); 2.325(1.4); 1.989(5.2); 1.236(1.8); 1.193(1.4); 1.175(2.7); 1.157(1.3); 0.146(2.0); 0.008(19.6); 0.000(423.5); -0.008(16.5); -0.150(2.0)
I-1-11	1.97	合成実施例2を参照
I-1-12	1.80	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.375(0.8); 11.262(4.1); 8.937(0.5); 8.891(2.6); 8.403(0.3); 8.004(0.4); 7.986(0.4); 7.983(0.5); 7.978(1.2); 7.975(1.4); 7.958(2.1); 7.954(1.6); 7.940(0.7); 7.937(0.6); 7.750(4.7); 7.745(4.9); 7.731(6.4); 7.727(8.7); 7.710(8.6); 7.706(8.5); 7.697(3.4); 7.691(3.9); 7.677(2.1); 7.658(1.1); 7.643(0.6); 7.640(0.8); 7.637(0.5); 7.626(0.5); 7.611(0.6); 7.608(0.5); 7.592(0.6); 7.582(0.5); 7.548(3.0); 7.545(2.8); 7.529(3.2); 7.510(1.5); 7.502(1.7); 7.492(3.7); 7.489(4.2); 7.474(10.2); 7.470(8.1); 7.456(16.0); 7.452(9.8); 7.436(8.2); 7.431(8.5); 7.417(3.1); 7.412(3.9); 7.391(1.4); 7.364(0.6); 5.758(2.4); 5.667(0.4); 4.346(0.8); 4.328(2.4); 4.310(2.4); 4.292(0.8); 3.329(5.6); 2.676(0.4); 2.672(0.5); 2.667(0.4); 2.525(1.9); 2.511(28.9); 2.507(55.7); 2.503(72.0); 2.498(52.6); 2.494(25.8); 2.334(0.3); 2.329(0.5); 2.086(9.8); 1.342(2.5); 1.324(5.0); 1.307(2.4); 1.235(0.6); 0.008(2.0); 0.000(43.6); -0.009(1.6)
I-1-13	1.73	合成実施例6を参照
I-1-14	1.72	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.974(3.4); 8.889(4.5); 7.750(0.4); 7.734(0.9); 7.729(0.8); 7.713(1.7); 7.696(1.0); 7.691(1.1); 7.675(0.5); 7.490(2.0); 7.478(3.6); 7.457(4.8); 7.436(2.3); 7.407(0.8); 7.387(2.1); 7.370(1.7); 7.300(3.5); 7.280(3.3); 7.259(1.0); 3.329(14.8); 2.506(28.2); 2.502(34.1); 2.498(25.6); 2.395(16.0); 0.000(10.6)
I-1-15	2.05	合成実施例3を参照
I-1-16	1.91	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.599(9.4); 8.884(7.5); 7.749(1.0); 7.733(2.1); 7.728(2.1); 7.712(4.3); 7.695(3.0); 7.690(4.6); 7.674(3.0); 7.667(3.2); 7.546(2.0); 7.542(2.0); 7.524(4.1); 7.507(2.6); 7.503(2.5); 7.477(6.5); 7.455(11.2); 7.435(5.3); 7.193(4.2); 7.172(3.8); 7.088(3.4); 7.069(6.2); 7.050(3.0); 3.905(16.0); 3.808(

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		0.8);3.325(60.7);2.671(0.6);2.506(68.4);2.502(88.1);2.498(67.4);2.329(0.6);1.989(0.9);1.175(0.5);0.008(1.9);0.000(39.6)
I-1-17	2.14	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.413(0.3);11.259(9.9);8.895(6.5);7.934(0.9);7.929(0.9);7.914(1.0);7.910(1.0);7.750(1.5);7.733(3.6);7.728(4.3);7.712(9.7);7.696(7.8);7.691(6.8);7.675(2.6);7.667(3.0);7.647(6.0);7.628(4.2);7.539(1.3);7.526(5.1);7.508(7.8);7.487(8.5);7.476(11.3);7.455(16.0);7.434(7.1);3.330(93.5);2.676(0.5);2.672(0.7);2.667(0.5);2.525(1.8);2.511(39.1);2.507(76.7);2.503(99.5);2.498(72.4);2.494(35.4);2.334(0.5);2.330(0.7);2.325(0.5);1.989(1.2);1.193(0.3);1.175(0.6);0.008(1.8);0.000(48.0);-0.008(1.9)
I-1-18	1.92	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.538(0.5);11.365(9.6);8.922(14.4);8.316(0.9);7.993(1.6);7.974(1.8);7.795(3.3);7.778(4.6);7.768(7.1);7.765(7.2);7.747(8.1);7.740(5.2);7.735(4.6);7.724(2.6);7.718(9.0);7.713(5.4);7.697(9.5);7.681(10.7);7.677(8.5);7.663(4.9);7.614(2.3);7.483(9.7);7.475(2.1);7.462(16.0);7.454(6.2);7.441(7.7);7.315(8.7);7.176(4.3);4.038(0.4);4.020(0.4);3.325(156.8);2.675(1.5);2.671(2.0);2.666(1.5);2.524(5.5);2.511(111.9);2.506(228.6);2.502(303.6);2.497(220.4);2.493(106.3);2.333(1.4);2.328(2.0);2.324(1.4);1.989(1.8);1.277(0.6);1.235(0.7);1.193(0.5);1.175(1.0);1.157(0.5);0.146(1.8);0.022(0.7);0.008(14.8);0.000(407.7);-0.009(14.6);-0.021(0.7);-0.150(1.7)
I-1-19	2.09	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.480(11.4);8.918(11.1);7.922(7.8);7.717(12.7);7.700(11.4);7.558(7.9);7.482(10.1);7.461(16.0);7.440(9.3);4.056(1.0);4.038(2.9);4.020(2.9);4.003(1.0);3.331(49.8);2.992(1.1);2.738(1.1);2.672(1.1);2.503(162.3);2.330(1.1);1.989(11.8);1.236(2.5);1.193(3.3);1.175(6.2);1.157(3.1);0.000(30.9)
I-1-20	2.04	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.644(10.9);11.579(2.0);8.926(16.0);8.666(2.9);8.317(0.8);7.790(1.0);7.769(2.9);7.761(2.9);7.750(6.3);7.745(6.0);7.738(10.7);7.729(3.6);7.723(7.9);7.714(14.2);7.702(6.0);7.691(5.2);7.666(1.1);7.650(1.3);7.629(1.4);7.607(2.6);7.586(1.5);7.561(1.3);7.540(0.6);7.488(8.3);7.467(14.1);7.446(6.7);7.376(1.6);7.355(2.7);7.334(1.3

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		); 4.056(0.6); 4.038(1.9); 4.020(1.9); 4.002(0.6); 3.891(0.5); 3.857(0.4); 3.329(235.0); 2.676(1.4); 2.671(1.9); 2.667(1.4); 2.524(5.9); 2.511(120.1); 2.507(233.7); 2.502(299.7); 2.498(217.0); 2.494(107.6); 2.333(1.4); 2.329(1.9); 2.325(1.4); 1.989(8.1); 1.243(2.4); 1.236(1.3); 1.193(2.2); 1.175(4.5); 1.157(2.2); 0.146(0.6); 0.008(5.5); 0.000(136.1); -0.008(6.8); -0.150(0.6)
I-1-21	1.89	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.285(0.7); 11.196(5.8); 11.040(0.4); 8.935(0.6); 8.887(3.6); 8.001(0.7); 7.991(4.5); 7.972(4.7); 7.956(0.6); 7.927(3.8); 7.908(4.0); 7.751(0.8); 7.735(1.9); 7.730(1.9); 7.714(6.6); 7.696(5.8); 7.693(5.9); 7.677(1.1); 7.611(0.4); 7.544(0.6); 7.524(1.0); 7.494(5.5); 7.478(16.0); 7.457(12.0); 7.436(4.4); 7.250(2.5); 7.231(5.6); 7.216(4.2); 7.212(3.8); 7.197(1.4); 5.757(3.7); 3.325(18.8); 2.675(0.8); 2.671(1.1); 2.666(0.8); 2.506(124.6); 2.502(156.0); 2.497(114.6); 2.333(0.8); 2.328(1.0); 2.324(0.7); 1.324(0.4); 1.235(0.3); 0.000(62.9); -0.008(2.9)
I-1-22	1.54	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.516(7.5); 8.915(6.3); 8.401(0.4); 8.317(0.7); 8.163(14.3); 8.142(16.0); 7.981(1.3); 7.961(1.4); 7.938(0.5); 7.858(8.6); 7.842(8.3); 7.809(3.0); 7.772(11.7); 7.765(11.8); 7.752(12.1); 7.613(0.8); 7.592(0.8); 7.544(0.8); 7.459(12.5); 7.365(1.0); 5.757(7.1); 5.667(0.4); 3.329(209.4); 3.018(0.4); 2.800(0.4); 2.671(2.2); 2.506(269.5); 2.502(333.5); 2.498(251.1); 2.329(2.2); 2.057(1.4); 1.234(0.5); 0.000(27.8)
I-1-23	1.24	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.481(3.3); 8.919(1.5); 8.517(2.0); 8.076(1.3); 7.732(1.0); 7.716(1.5); 7.697(1.2); 7.540(1.8); 7.501(0.5); 7.479(2.2); 7.458(3.6); 7.436(1.9); 5.757(16.0); 3.327(39.3); 2.676(0.4); 2.671(0.6); 2.667(0.4); 2.525(1.6); 2.511(34.8); 2.507(68.2); 2.502(87.5); 2.498(62.0); 2.494(29.3); 2.333(0.4); 2.329(0.6); 2.325(0.4); 0.008(0.4); 0.000(10.3); -0.009(0.4)
I-1-24	1.73	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.839(3.6); 11.663(12.6); 9.140(0.4); 9.098(12.5); 9.081(3.7); 9.040(12.6); 9.015(3.5); 9.010(3.7); 8.966(16.0); 8.927(8.5); 8.845(0.9); 8.831(1.4); 8.663(3.9); 8.401(2.8); 8.365(1.8); 8.358(1.9); 8.317(1.2); 8.238(2.0); 8.231(1.9); 8.028(0.4); 8.005(0.7); 7.983(0.6); 7.766(1.3); 7.746(3.5); 7.729(5.8); 7.710(4.4); 7.692(2.2); 7.664(1.4); 7.646(2.1)

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		;7.629(2.7);7.614(2.7);7.593(2.3);7.576(1.2);7.571(1.5);7.555(1.0);7.531(0.7);7.494(9.0);7.473(15.8);7.452(8.2);7.386(5.1);7.364(7.6);7.344(4.0);7.204(0.4);6.414(0.5);5.757(10.1);5.667(3.4);4.454(0.4);4.436(0.4);4.408(1.7);4.391(3.3);4.375(1.7);3.529(0.3);3.506(0.8);3.469(0.4);3.432(0.6);3.420(0.6);3.375(3.8);3.330(363.4);3.279(2.0);3.263(3.1);3.247(3.0);3.229(1.4);2.676(2.6);2.672(3.3);2.668(2.6);2.507(377.2);2.503(466.9);2.499(350.4);2.435(2.8);2.421(2.1);2.407(2.8);2.330(3.0);1.798(0.3);1.783(0.7);1.766(0.9);1.749(0.8);1.732(0.6);1.710(0.8);1.693(2.1);1.675(3.4);1.657(3.8);1.646(3.2);1.630(3.9);1.613(2.8);1.596(1.3);1.551(3.5);1.538(3.1);1.355(0.5);1.348(1.0);1.331(0.9);1.312(0.5);1.235(1.6);1.204(0.5);0.928(11.5);0.911(11.4);0.895(1.3);0.880(1.2);0.855(0.8);0.839(0.6);0.000(27.0)
I-1-26	2.25	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.334(7.2);8.865(7.2);8.318(0.7);7.950(11.9);7.935(16.0);7.890(10.4);7.834(8.2);7.818(9.7);7.753(8.6);7.716(12.5);4.056(0.9);4.038(2.6);4.020(2.7);4.002(0.9);3.332(356.1);2.999(0.7);2.714(0.7);2.680(0.5);2.676(1.1);2.671(1.6);2.667(1.2);2.662(0.6);2.525(3.1);2.520(4.8);2.511(82.9);2.507(176.1);2.502(237.5);2.498(173.0);2.493(83.6);2.338(0.5);2.334(1.1);2.329(1.6);2.324(1.1);1.989(11.7);1.236(1.5);1.192(3.2);1.175(6.3);1.157(3.1);0.000(1.2)
I-1-27	2.06	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.251(6.2);8.847(5.9);8.341(1.5);8.316(1.3);7.968(1.8);7.953(10.8);7.936(16.0);7.926(10.1);7.922(10.5);7.891(8.8);7.845(0.7);7.837(1.2);7.823(0.8);7.810(1.1);7.803(1.1);7.791(0.3);7.785(0.3);7.571(4.4);7.543(5.0);7.524(8.0);7.507(5.9);7.489(7.0);7.471(4.0);7.441(5.2);7.423(6.3);5.624(1.9);4.055(0.6);4.038(1.7);4.020(1.7);4.002(0.6);3.390(0.3);3.375(0.5);3.330(711.4);3.296(0.8);2.680(0.9);2.676(2.0);2.671(2.8);2.666(2.1);2.524(5.9);2.520(8.9);2.511(149.4);2.507(316.0);2.502(424.9);2.497(307.8);2.493(147.7);2.338(0.9);2.333(2.0);2.329(2.8);2.324(2.1);2.320(1.0);1.989(7.6);1.336(0.5);1.193(2.1);1.175(4.2);1.157(2.1);0.000(2.1)
I-1-28	2.21	合成実施例4を参照
I-1-29	2.39	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.977(3.7);8.840(5

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		. 6); 8.340(0.4); 7.971(0.5); 7.954(3.2); 7.936(5.3); 7.928(3.0); 7.922(2.9); 7.893(3.0); 7.886(2.4); 7.879(1.4); 7.874(1.3); 7.869(1.4); 7.455(1.9); 7.436(2.3); 7.432(2.3); 7.411(3.0); 7.392(2.2); 7.329(3.9); 7.311(2.8); 7.289(2.0); 7.270(3.0); 7.252(1.3); 5.625(0.5); 3.330(5.8.0); 2.921(0.6); 2.902(0.6); 2.770(1.7); 2.751(5.3); 2.732(5.4); 2.713(1.9); 2.671(0.4); 2.506(45.1); 2.502(57.9); 2.498(44.2); 2.329(0.4); 1.989(0.5); 1.193(7.5); 1.174(16.0); 1.155(7.7); 1.133(0.8); 0.000(20.7)
I-1-30	2.15	合成実施例1を参照
I-1-31	1.95	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.263(1.4); 8.849(1.4); 8.316(0.3); 7.777(1.6); 7.759(2.0); 7.667(0.6); 7.645(1.7); 7.627(3.3); 7.611(1.9); 7.602(2.3); 7.582(1.5); 7.548(1.3); 7.528(2.0); 7.510(1.3); 7.491(1.6); 7.472(0.9); 7.446(1.3); 7.428(1.6); 7.411(0.7); 4.055(1.2); 4.038(3.7); 4.020(3.7); 4.002(1.2); 3.325(91.6); 2.675(0.5); 2.671(0.7); 2.666(0.5); 2.524(2.2); 2.510(43.7); 2.506(86.0); 2.502(111.7); 2.497(80.4); 2.493(38.6); 2.333(0.5); 2.328(0.7); 2.324(0.5); 1.989(16.0); 1.193(4.3); 1.175(8.5); 1.157(4.2); 0.146(0.4); 0.008(3.6); 0.000(89.8); -0.009(3.3); -0.150(0.4)
I-1-32	2.08	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.183(8.0); 8.845(7.1); 8.346(0.6); 8.316(0.9); 7.923(7.2); 7.904(7.4); 7.778(7.6); 7.760(9.6); 7.734(0.7); 7.714(0.5); 7.698(0.6); 7.693(0.6); 7.685(0.7); 7.667(2.9); 7.646(8.1); 7.628(16.0); 7.612(8.2); 7.605(9.5); 7.601(9.1); 7.583(2.9); 7.565(0.6); 7.549(0.8); 7.541(0.9); 7.533(1.2); 7.482(12.3); 7.474(12.2); 7.232(3.5); 7.221(5.6); 7.212(5.5); 7.202(5.2); 7.192(2.8); 5.756(10.6); 5.604(0.6); 3.323(13.9); 2.675(1.6); 2.670(2.1); 2.666(1.6); 2.523(6.5); 2.510(118.6); 2.506(236.2); 2.501(309.2); 2.497(223.4); 2.492(107.3); 2.337(0.7); 2.333(1.4); 2.328(2.0); 2.324(1.4); 1.989(0.9); 1.398(0.4); 1.259(0.5); 1.235(1.8); 1.193(0.4); 1.175(0.6); 1.157(0.3); 0.853(0.3); 0.146(1.4); 0.008(12.2); 0.000(313.6); -0.009(11.4); -0.150(1.4)
I-1-33	2.10	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.578(4.8); 11.347(5.7); 8.878(5.4); 8.317(0.7); 7.846(6.8); 7.831(9.5); 7.827(9.9); 7.821(8.9); 7.798(7.4); 7.780(6.3); 7.766(9.7); 7.762(9.1); 7.747(9.3); 7.743(10.2); 7.720(16.0); 7.704(15.0); 7.656(8.4); 7.636(5.7); 7.609(5.2); 7.587(6.8); 7.566(3.8); 7.453(0.3); 5.757(2.2); 3.324(81.6); 2.9

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		98(0.8);2.714(0.8);2.680(0.9);2.675(1.8);2.671(2.5);2.666(1.8);2.662(0.9);2.524(9.0);2.511(142.5);2.506(282.3);2.502(369.4);2.497(264.7);2.493(125.9);2.338(0.9);2.333(1.8);2.328(2.5);2.324(1.8);1.234(0.4);0.146(0.5);0.008(4.8);0.000(125.4);-0.008(4.1);-0.150(0.5)
I-1-34	2.30	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.416(0.8);11.247(9.9);8.866(8.7);8.317(1.5);7.923(2.9);7.919(2.9);7.904(3.2);7.900(3.1);7.738(3.9);7.717(14.4);7.702(15.9);7.697(16.0);7.682(11.0);7.652(16.0);7.641(10.5);7.622(7.2);7.608(7.7);7.585(10.9);7.564(4.9);7.533(3.7);7.517(9.1);7.501(11.0);7.481(12.7);7.460(7.9);4.038(0.7);4.020(0.7);3.327(394.7);3.000(0.5);2.775(0.4);2.680(1.2);2.676(2.5);2.671(3.4);2.667(2.4);2.662(1.2);2.524(9.0);2.511(193.6);2.507(386.9);2.502(506.7);2.497(364.8);2.493(173.7);2.333(2.4);2.329(3.3);2.324(2.4);2.237(0.3);1.989(3.0);1.236(1.2);1.193(0.8);1.175(1.6);1.157(0.8);0.146(1.0);0.008(7.7);0.000(222.8);-0.008(7.5);-0.150(0.9)
I-1-35	2.04	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.188(1.7);8.858(1.5);7.923(1.5);7.904(1.5);7.739(0.6);7.718(1.5);7.703(1.6);7.697(1.4);7.683(1.3);7.652(2.4);7.632(1.4);7.608(1.3);7.585(2.0);7.565(0.9);7.483(2.6);7.475(2.6);7.232(0.7);7.222(1.2);7.214(1.2);7.203(1.1);4.055(0.8);4.038(2.4);4.020(2.5);4.002(0.8);3.324(18.2);2.670(0.3);2.524(1.1);2.510(20.1);2.506(38.9);2.501(50.1);2.497(36.1);2.493(17.5);1.989(10.6);1.398(16.0);1.192(2.9);1.175(5.7);1.157(2.8);0.008(2.0);0.000(43.4);-0.008(1.6)
I-1-36	1.83	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.376(5.1);11.267(6.0);8.977(0.3);8.863(6.1);8.317(0.4);7.794(3.4);7.792(5.7);7.789(3.5);7.774(4.7);7.771(4.8);7.738(2.6);7.717(7.1);7.702(7.6);7.697(6.7);7.682(5.9);7.651(10.7);7.631(6.4);7.606(7.2);7.584(13.1);7.563(8.6);7.547(16.0);7.544(16.0);7.539(13.0);7.533(13.2);7.530(13.9);7.513(6.7);7.509(6.8);7.493(7.3);7.474(4.2);7.462(2.8);7.450(8.4);7.442(7.7);7.436(6.8);7.430(10.2);7.429(9.8);7.424(8.0);7.416(5.3);7.409(5.2);5.756(6.9);3.507(0.5);3.327(26.7);2.676(0.9);2.671(1.2);2.667(0.9);2.662(0.5);2.566(0.3);2.524(4.2);2.511(67.7);2.507(135.3);2.502(177.8);2.498(128.9);2.493(62.8);2.338(0.4);2.333(0.8);2.329(1.2);2.324(

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		0.8); 1.235 (1.1); 0.146 (0.4); 0.008 (3.0); 0.000 (80.9); -0.008 (3.0); -0.149 (0.4)
I-1-37	2.19	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.228 (5.1); 8.746 (5.4); 8.318 (0.7); 7.839 (4.4); 7.821 (5.6); 7.774 (4.2); 7.758 (4.1); 7.699 (8.3); 7.535 (3.7); 7.367 (3.8); 7.346 (4.0); 7.242 (4.6); 3.332 (154.5); 2.675 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.9); 2.525 (2.8); 2.511 (70.7); 2.507 (140.8); 2.502 (181.8); 2.498 (129.3); 2.333 (1.1); 2.329 (1.3); 2.325 (1.1); 2.245 (16.0); 1.743 (0.6); 0.146 (0.6); 0.008 (5.1); 0.000 (140.0); -0.009 (5.1); -0.149 (0.6)
I-1-38	1.99	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.134 (3.9); 8.727 (2.8); 8.316 (0.6); 8.181 (2.6); 7.722 (1.4); 7.708 (1.5); 7.699 (1.5); 7.685 (1.5); 7.524 (6.9); 7.488 (5.3); 7.443 (3.5); 7.426 (3.8); 7.357 (3.1); 7.336 (3.1); 7.252 (2.3); 7.236 (3.6); 7.218 (2.1); 7.073 (1.0); 7.066 (1.2); 7.049 (1.0); 7.042 (1.2); 6.991 (0.7); 6.983 (0.6); 6.969 (1.2); 6.962 (1.1); 6.948 (0.6); 6.940 (0.5); 3.326 (239.7); 2.675 (1.1); 2.671 (1.4); 2.666 (1.1); 2.524 (4.4); 2.510 (82.7); 2.506 (163.1); 2.502 (213.8); 2.497 (157.6); 2.493 (78.6); 2.333 (1.3); 2.328 (1.7); 2.324 (1.4); 2.257 (16.0); 2.232 (5.3); 2.180 (1.6); 2.097 (0.5); 1.055 (0.6); 0.146 (0.7); 0.008 (6.3); 0.000 (152.7); -0.008 (6.5); -0.150 (0.7)
I-1-39	2.13	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.063 (11.3); 8.727 (7.9); 8.317 (0.8); 7.920 (7.6); 7.902 (8.2); 7.674 (0.5); 7.464 (16.0); 7.358 (7.7); 7.337 (7.8); 7.254 (6.3); 7.233 (12.1); 7.212 (11.9); 4.038 (0.4); 4.020 (0.4); 3.328 (312.6); 2.671 (2.0); 2.667 (1.6); 2.506 (230.4); 2.502 (302.4); 2.497 (233.0); 2.328 (2.8); 2.324 (2.5); 2.237 (14.3); 1.989 (2.1); 1.235 (0.5); 1.192 (0.5); 1.175 (0.9); 1.157 (0.5); 0.146 (0.7); 0.008 (6.3); 0.000 (144.4); -0.150 (0.7)
I-1-40	2.26	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.266 (4.8); 11.016 (0.3); 8.753 (5.2); 8.575 (0.3); 8.565 (0.3); 8.318 (0.8); 7.822 (4.9); 7.771 (4.5); 7.757 (4.8); 7.719 (8.1); 7.573 (6.3); 7.546 (4.6); 7.527 (6.0); 7.471 (5.7); 4.037 (0.8); 4.020 (0.9); 3.369 (0.4); 3.330 (254.3); 2.671 (1.8); 2.506 (243.6); 2.502 (297.4); 2.497 (208.1); 2.329 (1.9); 2.110 (16.0); 1.989 (4.0); 1.950 (0.4); 1.914 (0.4); 1.899 (0.4); 1.820 (0.4); 1.761 (0.6); 1.752 (0.7); 1.733 (0.7); 1.697 (0.8); 1.684 (0.8); 1.192 (0.9); 1.175 (2.0); 1.157 (0.9); 0.146 (0.8); 0.008 (8.4); 0.000 (184.5); -0.009 (6.9); -0.150 (0.8)
I-1-41	2.04	¹ H NMR (600.1 MHz, d6-DMSO): δ = 11.572 (0.4); 11.182 (4.5); 9.324 (1.6); 8.721 (5.3); 8.240 (1.3); 8.228

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		(1.4); 7.807 (1.0); 7.795 (2.4); 7.785 (1.3); 7.782 (1.2); 7.772 (1.5); 7.771 (1.5); 7.759 (0.7); 7.757 (0.7); 7.693 (0.3); 7.671 (1.4); 7.669 (1.4); 7.658 (2.2); 7.646 (1.5); 7.644 (1.5); 7.595 (6.3); 7.569 (11.9); 7.557 (15.0); 7.522 (15.5); 7.513 (16.0); 7.471 (9.1); 7.445 (13.5); 3.391 (0.5); 3.341 (3.0); 2.611 (0.3); 2.499 (53.6); 2.383 (0.4); 2.107 (12.5); 2.048 (2.9); 2.043 (3.2); 2.039 (3.5); 2.035 (2.9); 2.031 (2.2); 1.889 (0.6); 1.854 (0.5); 1.838 (0.5); 0.000 (2.0)
I-1-42	2.55	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.566(0.4); 11.254(6.4); 11.001(0.4); 8.788(6.7); 8.609(0.4); 8.317(0.9); 8.258(1.4); 7.848(5.5); 7.833(10.0); 7.829(10.1); 7.819(9.5); 7.805(8.5); 7.802(8.8); 7.785(6.4); 7.782(7.0); 7.767(10.8); 7.764(10.1); 7.749(10.7); 7.745(10.8); 7.724(13.0); 7.722(12.9); 7.708(11.6); 7.640(2.3); 7.581(16.0); 7.502(7.0); 7.498(7.6); 7.492(7.5); 7.485(8.1); 7.425(1.8); 7.419(1.6); 7.408(1.5); 7.402(1.4); 7.318(0.7); 4.056(0.7); 4.038(2.2); 4.020(2.3); 4.002(0.8); 3.365(68.8); 2.998(2.0); 2.714(1.9); 2.680(0.7); 2.675(1.5); 2.671(2.0); 2.666(1.5); 2.662(0.6); 2.524(4.8); 2.511(11.9.6); 2.506(243.7); 2.502(321.5); 2.497(231.8); 2.493(110.5); 2.378(9.3); 2.338(3.2); 2.333(3.5); 2.329(3.8); 2.324(3.0); 2.203(0.5); 2.179(0.5); 2.161(0.4); 2.149(0.4); 1.989(10.6); 1.965(0.8); 1.909(1.0); 1.259(0.4); 1.236(2.2); 1.192(2.9); 1.175(5.8); 1.157(3.2); 1.081(15.6); 1.074(15.2); 1.055(11.0); 1.036(4.7); 0.922(1.1); 0.854(1.6); 0.836(1.4); 0.146(0.8); 0.008(6.5); 0.000(199.8); -0.009(6.8); -0.150(0.8)
I-1-43	2.36	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.173(2.8); 8.769(3.3); 8.316(0.7); 7.781(0.4); 7.765(0.4); 7.578(16.0); 7.544(6.2); 7.522(6.3); 7.484(9.7); 7.437(4.8); 7.423(5.0); 7.310(0.5); 4.056(0.3); 4.038(1.1); 4.020(1.1); 4.002(0.4); 3.326(245.0); 2.675(1.1); 2.671(1.5); 2.666(1.1); 2.524(3.8); 2.510(86.6); 2.506(168.6); 2.502(217.9); 2.497(158.5); 2.376(3.8); 2.338(2.9); 2.333(3.2); 2.328(3.3); 2.324(2.8); 2.189(0.4); 1.989(4.7); 1.235(0.5); 1.193(1.4); 1.175(2.7); 1.157(1.6); 1.069(8.7); 0.146(0.4); 0.008(3.7); 0.000(100.0); -0.008(3.5); -0.150(0.5)
I-1-44	2.26	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.576(7.0); 11.340(3.5); 8.950(0.4); 8.848(3.5); 8.316(1.1); 7.974(0.6); 7

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		. 956(0. 6) ; 7. 953(0. 6) ; 7. 924(0. 4) ; 7. 847(5. 8) ; 7. 831(9. 5) ; 7. 827(9. 4) ; 7. 817(8. 0) ; 7. 798(12. 0) ; 7. 784(10. 9) ; 7. 780(11. 7) ; 7. 766(16. 0) ; 7. 747(10. 6) ; 7. 743(10. 9) ; 7. 724(10. 2) ; 7. 722(10. 3) ; 7. 701(8. 5) ; 7. 696(8. 6) ; 7. 675(6. 9) ; 7. 658(3. 9) ; 7. 582(0. 7) ; 7. 548(0. 8) ; 7. 528(0. 9) ; 7. 509(0. 7) ; 5. 756(1. 9) ; 4. 327(0. 8) ; 4. 309(0. 9) ; 3. 322(61. 8) ; 2. 998(0. 8) ; 2. 714(0. 8) ; 2. 675(2. 0) ; 2. 671(2. 8) ; 2. 666(2. 0) ; 2. 662(1. 0) ; 2. 524(11. 2) ; 2. 511(162. 6) ; 2. 506(318. 8) ; 2. 502(415. 7) ; 2. 497(301. 4) ; 2. 493(148. 6) ; 2. 337(1. 0) ; 2. 333(2. 0) ; 2. 328(2. 7) ; 2. 324(2. 0) ; 1. 342(0. 9) ; 1. 324(1. 8) ; 1. 307(0. 9) ; 0. 008(0. 5) ; 0. 000(13. 2) ; -0. 009(0. 5)
I-1-45	2. 09	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO) : δ = 11. 240(0. 6) ; 8. 832(0. 7) ; 7. 787(1. 8) ; 7. 767(2. 6) ; 7. 710(0. 7) ; 7. 691(2. 2) ; 7. 673(1. 9) ; 7. 652(0. 8) ; 7. 581(0. 3) ; 7. 547(0. 6) ; 7. 463(1. 0) ; 7. 445(0. 8) ; 7. 416(0. 8) ; 7. 401(0. 8) ; 4. 056(1. 1) ; 4. 038(3. 5) ; 4. 020(3. 6) ; 4. 002(1. 2) ; 3. 320(49. 5) ; 2. 675(0. 5) ; 2. 670(0. 7) ; 2. 666(0. 5) ; 2. 541(0. 4) ; 2. 524(1. 9) ; 2. 510(4. 1) ; 2. 506(83. 4) ; 2. 501(109. 2) ; 2. 497(77. 1) ; 2. 492(36. 0) ; 2. 333(0. 5) ; 2. 328(0. 7) ; 2. 323(0. 5) ; 1. 988(16. 0) ; 1. 193(4. 3) ; 1. 175(8. 7) ; 1. 157(4. 3) ; 0. 146(0. 5) ; 0. 008(4. 9) ; 0. 000(133. 8) ; -0. 009(4. 5) ; -0. 150(0. 6)
I-1-46	2. 03	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO) : δ = 13. 374(4. 8) ; 11. 260(3. 2) ; 8. 831(4. 0) ; 8. 316(0. 5) ; 7. 976(1. 0) ; 7. 974(1. 1) ; 7. 956(1. 3) ; 7. 953(1. 1) ; 7. 861(0. 3) ; 7. 791(11. 9) ; 7. 788(12. 7) ; 7. 773(11. 4) ; 7. 769(16. 0) ; 7. 766(15. 9) ; 7. 691(7. 1) ; 7. 672(7. 4) ; 7. 657(2. 4) ; 7. 651(3. 9) ; 7. 639(1. 3) ; 7. 636(1. 1) ; 7. 573(3. 5) ; 7. 557(4. 2) ; 7. 547(14. 8) ; 7. 544(15. 3) ; 7. 538(11. 5) ; 7. 537(11. 5) ; 7. 533(11. 1) ; 7. 529(11. 6) ; 7. 513(6. 2) ; 7. 509(6. 4) ; 7. 487(5. 2) ; 7. 462(3. 4) ; 7. 449(6. 3) ; 7. 442(7. 0) ; 7. 436(6. 5) ; 7. 430(7. 5) ; 7. 428(7. 2) ; 7. 423(7. 5) ; 7. 416(6. 0) ; 7. 409(4. 9) ; 7. 236(0. 5) ; 7. 216(0. 5) ; 5. 756(1. 1) ; 4. 345(0. 6) ; 4. 327(1. 9) ; 4. 309(1. 9) ; 4. 292(0. 6) ; 3. 326(19. 0) ; 2. 675(0. 9) ; 2. 671(1. 3) ; 2. 666(1. 0) ; 2. 662(0. 5) ; 2. 549(0. 6) ; 2. 524(4. 9) ; 2. 511(76. 2) ; 2. 506(150. 6) ; 2. 502(197. 0) ; 2. 497(143. 2) ; 2. 493(70. 2) ; 2. 338(0. 5) ; 2. 333(0. 9) ; 2. 328(1. 3) ; 2. 324(1. 0) ; 1. 342(2. 0) ; 1. 324(4. 1) ; 1. 307(2. 0) ; 1. 234(0. 4) ; 0. 000(6. 7)
I-1-47	2. 04	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO) : δ = 11. 102(2. 8) ; 8. 651(3. 1) ; 8. 317(0. 9) ; 7. 523(4. 6) ; 7. 484(4. 5) ; 7. 425(4. 4) ; 7. 389(4. 3) ; 7. 370(6. 0) ; 7. 353(4. 9) ; 7. 273(8. 8) ; 3. 329(232. 9) ; 2. 675(1. 4) ; 2. 671(1. 9) ; 2. 666(1. 4) ; 2. 524(5. 5) ; 2. 510(112. 1) ; 2. 506(229. 5) ; 2. 502(303. 7) ; 2. 497(219. 1) ; 2.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		493(105.8);2.333(1.5);2.328(1.9);2.324(1.5);2.062(6.2);2.029(16.0);0.146(0.6);0.008(5.0);0.000(139.8);-0.009(5.2);-0.150(0.6)
I-1-48	2.26	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.179(2.2);8.667(2.6);8.318(0.7);7.821(2.2);7.769(2.1);7.756(2.1);7.713(3.8);7.377(2.2);7.362(2.0);7.285(4.3);7.190(0.5);4.037(0.4);4.020(0.4);3.330(113.2);3.306(0.5);2.675(0.6);2.671(0.8);2.666(0.6);2.510(51.2);2.506(99.6);2.502(127.4);2.497(89.9);2.493(41.9);2.333(0.6);2.328(0.8);2.324(0.6);2.038(16.0);1.989(3.0);1.876(0.4);1.689(1.2);1.192(0.5);1.174(1.0);1.157(0.5);0.146(0.4);0.008(4.0);0.000(92.8);-0.009(3.1);-0.150(0.4)
I-1-49	2.15	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.142(3.7);8.556(4.1);8.318(0.6);7.835(2.6);7.820(3.4);7.772(2.9);7.756(2.9);7.703(5.7);7.438(3.3);7.420(2.4);7.107(3.1);7.089(3.1);7.019(3.1);7.002(3.1);4.037(0.4);4.020(0.5);3.762(16.0);3.329(170.5);2.675(0.9);2.671(1.2);2.666(0.9);2.510(75.0);2.506(145.4);2.502(186.5);2.497(133.6);2.493(65.3);2.333(0.9);2.328(1.2);2.324(0.9);2.058(12.7);1.989(2.3);1.551(0.6);1.398(0.5);1.192(0.5);1.175(1.0);1.157(0.5);0.146(0.4);0.008(3.4);0.000(78.6);-0.008(3.5);-0.150(0.3)
I-1-50	1.95	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.061(1.8);8.539(1.9);8.313(0.3);7.524(2.9);7.484(2.7);7.449(3.6);7.430(5.3);7.412(3.6);7.098(3.0);7.079(2.7);7.008(2.2);6.993(2.2);4.038(0.4);4.020(0.4);3.751(16.0);3.430(0.4);3.344(619.2);3.312(1.8);3.287(0.5);3.272(0.4);2.676(0.6);2.671(0.7);2.667(0.6);2.524(2.0);2.507(84.5);2.502(108.2);2.498(78.1);2.333(0.5);2.329(0.7);2.325(0.5);2.052(4.6);1.988(2.2);1.192(0.4);1.175(0.8);1.157(0.4)
I-1-51	2.49	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.342(7.2);8.908(6.4);8.316(1.0);7.889(8.6);7.869(10.1);7.841(8.7);7.822(10.9);7.771(6.7);7.755(7.2);7.704(16.0);7.614(6.4);7.594(9.0);7.575(4.7);7.511(0.7);7.497(0.6);4.056(0.8);4.038(2.6);4.020(2.7);4.002(0.9);3.323(239.4);2.998(0.3);2.714(0.3);2.679(0.9);2.675(1.9);2.670(2.7);2.666(1.9);2.661(0.9);2.541(1.4);2.524(6.2);2.519(9.5);2.510(148.1);2.506(307.9);2.501(408.9);2.497(288.1);2.492(133.2);2.337(0.9);2.333(1.9);2.328(2.6);2.324(1.9);2.319(0.9);1.989(11.9);1.235(0.7)

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		) ; 1.193 (3.2) ; 1.175 (6.4) ; 1.157 (3.1) ; 0.146 (0.5) ; 0.008 (3.5) ; 0.000 (117.6) ; -0.009 (3.5) ; -0.150 (0.5)
I-1-52	2.29	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ= 11.258 (10.6) ; 8.891 (8.0) ; 8.316 (0.6) ; 7.890 (11.6) ; 7.888 (11.6) ; 7.869 (13.0) ; 7.867 (13.5) ; 7.694 (4.7) ; 7.613 (10.3) ; 7.593 (16.0) ; 7.573 (11.7) ; 7.551 (11.5) ; 7.531 (14.6) ; 7.513 (7.8) ; 7.495 (10.6) ; 7.476 (5.6) ; 7.449 (8.1) ; 7.431 (9.8) ; 7.414 (4.0) ; 4.056 (0.4) ; 4.038 (1.3) ; 4.020 (1.3) ; 4.002 (0.4) ; 3.873 (0.6) ; 3.324 (215.5) ; 2.675 (1.2) ; 2.671 (1.7) ; 2.666 (1.2) ; 2.541 (0.8) ; 2.524 (4.1) ; 2.511 (97.1) ; 2.506 (198.0) ; 2.502 (261.1) ; 2.497 (186.3) ; 2.493 (88.2) ; 2.333 (1.2) ; 2.328 (1.7) ; 2.324 (1.2) ; 2.288 (1.1) ; 1.989 (5.6) ; 1.193 (1.5) ; 1.175 (2.9) ; 1.157 (1.4) ; 0.008 (2.3) ; 0.000 (67.2) ; -0.008 (2.1)
I-1-53	2.58	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ= 13.580 (0.7) ; 11.331 (7.3) ; 8.878 (6.3) ; 8.316 (1.1) ; 7.977 (9.1) ; 7.841 (8.3) ; 7.822 (10.8) ; 7.757 (11.1) ; 7.700 (13.4) ; 7.680 (16.0) ; 7.660 (8.8) ; 7.511 (0.6) ; 7.495 (0.5) ; 7.462 (0.4) ; 4.056 (0.5) ; 4.038 (1.5) ; 4.020 (1.6) ; 4.002 (0.5) ; 3.364 (0.3) ; 3.323 (245.7) ; 3.287 (0.4) ; 2.998 (0.7) ; 2.714 (0.7) ; 2.675 (2.0) ; 2.671 (2.8) ; 2.666 (1.9) ; 2.661 (1.0) ; 2.559 (0.5) ; 2.541 (1.5) ; 2.524 (7.1) ; 2.519 (12.0) ; 2.511 (164.3) ; 2.506 (329.3) ; 2.502 (427.2) ; 2.497 (300.1) ; 2.493 (138.1) ; 2.333 (2.0) ; 2.328 (2.6) ; 2.324 (1.9) ; 2.319 (0.9) ; 1.989 (6.9) ; 1.398 (0.6) ; 1.234 (0.4) ; 1.193 (1.9) ; 1.175 (3.9) ; 1.157 (1.8) ; 0.146 (1.1) ; 0.008 (10.5) ; 0.000 (292.3) ; -0.009 (8.5) ; -0.020 (0.5) ; -0.150 (1.1)
I-1-54	2.55	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ= 11.359 (6.1) ; 8.973 (1.5) ; 8.908 (5.6) ; 8.316 (0.6) ; 8.898 (4.9) ; 7.863 (2.3) ; 7.843 (7.4) ; 7.824 (9.9) ; 7.804 (6.9) ; 7.783 (10.2) ; 7.763 (6.6) ; 7.761 (6.7) ; 7.756 (6.7) ; 7.695 (16.0) ; 7.524 (0.4) ; 4.038 (0.5) ; 4.020 (0.5) ; 3.325 (233.6) ; 2.675 (1.1) ; 2.671 (1.5) ; 2.666 (1.1) ; 2.662 (0.5) ; 2.541 (0.9) ; 2.524 (4.0) ; 2.511 (86.1) ; 2.506 (172.0) ; 2.502 (223.3) ; 2.497 (156.6) ; 2.493 (72.3) ; 2.333 (1.0) ; 2.329 (1.4) ; 2.324 (1.0) ; 1.989 (2.2) ; 1.398 (0.7) ; 1.236 (0.4) ; 1.193 (0.6) ; 1.175 (1.2) ; 1.157 (0.6) ; 0.008 (2.1) ; 0.000 (58.4) ; -0.009 (1.7)
I-1-55	2.34	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ= 11.272 (12.5) ; 8.893 (10.4) ; 8.315 (1.1) ; 7.880 (4.1) ; 7.802 (10.1) ; 7.781 (13.9) ; 7.695 (11.9) ; 7.690 (11.1) ; 7.673 (8.4) ; 7.669 (7.6) ; 7.551 (13.2) ; 7.533 (16.0) ; 7.516 (8.5) ; 7.497 (11.4) ; 7.478 (6.1) ; 7.451 (8.9) ; 7.433 (10.6) ; 7.416 (4.3) ; 4.055 (0.4) ; 4.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		038(1.3);4.020(1.4);4.002(0.5);3.321(274.4);2.675(3.0);2.670(3.8);2.666(2.8);2.541(2.6);2.506(476.8);2.501(585.1);2.497(415.8);2.332(3.0);2.328(3.8);2.324(2.7);1.989(5.7);1.398(3.1);1.193(1.5);1.175(3.1);1.157(1.6);0.146(0.6);0.000(125.7);-0.008(4.7);-0.150(0.6)
I-1-57	2.10	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.413(1.6);8.936(1.2);7.845(2.2);7.826(2.8);7.799(1.0);7.776(1.3);7.760(1.3);7.723(2.2);7.706(2.3);7.529(1.2);5.760(0.4);4.056(1.2);4.038(3.8);4.020(3.8);4.002(1.3);3.329(109.4);2.672(0.5);2.507(57.5);2.502(72.0);2.498(54.3);2.329(0.5);1.989(16.0);1.193(4.2);1.175(8.3);1.157(4.1);0.146(0.4);0.008(5.8);0.000(82.6);-0.150(0.4)
I-1-58	1.91	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.333(11.8);8.923(8.0);8.455(1.2);8.317(0.3);7.871(1.6);7.859(1.9);7.847(4.2);7.835(4.6);7.824(4.7);7.812(4.5);7.800(2.2);7.788(1.8);7.711(0.4);7.698(0.4);7.687(0.5);7.676(0.4);7.652(0.3);7.587(5.2);7.569(7.0);7.555(9.4);7.535(16.0);7.521(11.2);7.502(11.4);7.482(4.8);7.454(7.0);7.436(8.9);7.418(3.7);5.761(1.7);4.056(0.6);4.038(1.8);4.020(1.8);4.002(0.6);3.331(236.9);2.671(1.0);2.506(117.9);2.502(150.7);2.499(119.7);2.329(1.0);1.989(7.6);1.236(0.9);1.193(2.0);1.175(3.9);1.157(2.0);0.146(0.9);0.000(179.1);-0.150(1.0)
I-1-59	2.03	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.260(14.8);8.922(8.9);8.454(1.8);8.317(0.5);7.929(9.3);7.909(9.8);7.873(1.8);7.860(2.1);7.848(4.4);7.836(4.7);7.825(4.7);7.813(4.6);7.801(2.2);7.789(1.9);7.711(0.5);7.699(0.6);7.688(0.6);7.676(0.6);7.664(0.4);7.652(0.4);7.561(2.4);7.556(3.1);7.551(3.1);7.546(3.1);7.538(4.7);7.532(5.6);7.528(5.5);7.522(5.1);7.514(3.5);7.489(14.5);7.478(16.0);7.441(1.1);7.435(1.1);7.431(1.0);7.425(0.9);7.418(0.5);7.412(0.5);7.407(0.4);7.401(0.4);7.242(4.0);7.232(6.3);7.221(6.1);7.212(6.5);7.200(3.5);5.761(2.6);4.038(1.0);4.020(1.0);3.329(151.5);2.676(0.8);2.671(1.2);2.667(0.9);2.524(2.5);2.511(61.9);2.506(127.4);2.502(171.3);2.497(129.3);2.493(66.2);2.333(0.9);2.329(1.2);2.324(0.9);1.989(4.3);1.397(0.4);1.235(2.3);1.193(1.2);1.175(2.3);1.157(1.1);0.000(9.8);-0.008(0.4)
I-1-60	2.21	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.061(3.8);8.920(4

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		. 9); 7. 872(0. 5); 7. 859(0. 6); 7. 847(1. 1); 7. 835(1. 1); 7. 825(1. 1); 7. 813(1. 1); 7. 800(0. 6); 7. 788(0. 5); 7. 562(0. 6); 7. 556(0. 7); 7. 552(0. 7); 7. 546(0. 7); 7. 538(1. 1); 7. 533(1. 3); 7. 528(1. 2); 7. 522(1. 1); 7. 515(0. 6); 7. 509(0. 7); 7. 504(0. 6); 7. 499(0. 5); 7. 463(1. 9); 7. 443(2. 7); 7. 422(2. 6); 7. 419(2. 3); 7. 404(2. 0); 7. 400(1. 7); 7. 339(3. 3); 7. 320(2. 4); 7. 303(1. 9); 7. 284(2. 6); 7. 266(1. 2); 4. 055(0. 4); 4. 038(1. 1); 4. 020(1. 2); 4. 002(0. 4); 3. 326(25. 9); 2. 922(0. 5); 2. 904(0. 5); 2. 775(1. 5); 2. 756(4. 5); 2. 737(4. 7); 2. 718(1. 6); 2. 671(0. 4); 2. 511(23. 0); 2. 506(44. 5); 2. 502(58. 0); 2. 497(42. 6); 2. 493(21. 1); 2. 329(0. 4); 1. 989(5. 0); 1. 195(6. 9); 1. 176(16. 0); 1. 157(7. 8); 1. 134(0. 7); 0. 146(0. 4); 0. 008(4. 2); 0. 000(82. 5); -0. 009(3. 5); -0. 150(0. 4)
I-1-61	2. 05	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ= 11. 369(9. 2); 8. 878(7. 7); 8. 317(1. 0); 7. 842(8. 1); 7. 824(10. 4); 7. 772(6. 9); 7. 758(7. 2); 7. 717(12. 4); 7. 704(13. 5); 7. 649(9. 7); 7. 627(16. 0); 7. 605(9. 3); 7. 536(0. 5); 7. 523(0. 5); 7. 512(0. 4); 7. 501(0. 4); 4. 038(0. 5); 4. 020(0. 5); 3. 328(271. 4); 2. 714(0. 3); 2. 676(1. 6); 2. 671(2. 1); 2. 667(1. 6); 2. 507(235. 1); 2. 502(304. 9); 2. 498(228. 5); 2. 333(1. 5); 2. 329(2. 0); 2. 324(1. 5); 1. 989(2. 1); 1. 235(0. 3); 1. 193(0. 6); 1. 175(1. 2); 1. 157(0. 6); 0. 146(0. 6); 0. 008(6. 2); 0. 000(132. 8); -0. 008(7. 0); -0. 150(0. 6)
I-1-62	1. 85	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ= 11. 288(10. 2); 8. 865(7. 2); 8. 317(0. 5); 7. 647(8. 6); 7. 625(16. 0); 7. 603(9. 2); 7. 579(5. 1); 7. 554(7. 1); 7. 532(10. 2); 7. 516(6. 0); 7. 498(8. 0); 7. 479(4. 2); 7. 451(6. 2); 7. 433(7. 7); 7. 415(3. 2); 3. 328(135. 6); 2. 675(0. 9); 2. 671(1. 2); 2. 667(0. 9); 2. 506(139. 1); 2. 502(177. 6); 2. 498(133. 8); 2. 333(0. 9); 2. 329(1. 2); 2. 325(0. 9); 1. 989(1. 1); 1. 175(0. 6); 0. 146(0. 4); 0. 000(74. 7); -0. 150(0. 4)
I-1-63	2. 00	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ= 11. 212(3. 1); 8. 862(2. 0); 7. 926(2. 0); 7. 906(2. 1); 7. 648(2. 2); 7. 626(4. 1); 7. 605(2. 2); 7. 484(2. 9); 7. 473(3. 6); 7. 238(0. 9); 7. 229(1. 2); 7. 218(1. 4); 7. 210(1. 3); 7. 196(0. 8); 4. 055(1. 2); 4. 038(3. 8); 4. 020(3. 8); 4. 002(1. 3); 3. 327(43. 8); 2. 671(0. 4); 2. 506(45. 7); 2. 502(61. 4); 2. 497(47. 2); 2. 329(0. 4); 1. 989(16. 0); 1. 235(0. 9); 1. 193(4. 2); 1. 175(8. 4); 1. 157(4. 2); 0. 000(3. 0)
I-1-64	2. 14	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ= 11. 017(3. 5); 8. 861(5. 0); 7. 648(2. 4); 7. 626(4. 1); 7. 604(2. 4); 7. 457(1. 7); 7. 438(2. 8); 7. 419(2. 3); 7. 400(1. 7); 7. 336(2. 9); 7. 318(2. 0

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		) ; 7.300(1.6) ; 7.281(2.2) ; 7.262(1.0) ; 4.056(0.8) ; 4.038(2.3) ; 4.020(2.4) ; 4.002(0.8) ; 3.331(26.7) ; 2.924(0.5) ; 2.905(0.5) ; 2.772(1.3) ; 2.753(3.8) ; 2.734(3.9) ; 2.716(1.3) ; 2.506(19.2) ; 2.502(25.1) ; 2.498(19.0) ; 1.989(10.0) ; 1.193(7.8) ; 1.175(16.0) ; 1.156(7.1) ; 1.135(0.6) ; 0.008(0.5) ; 0.000(11.2) ; -0.008(0.5)
I-1-65	2.49	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 11.474(3.2) ; 8.989(0.5) ; 8.953(2.5) ; 8.908(0.6) ; 8.484(11.6) ; 8.317(1.1) ; 7.953(0.4) ; 7.936(0.5) ; 7.932(0.4) ; 7.846(3.4) ; 7.827(4.5) ; 7.775(2.7) ; 7.758(2.9) ; 7.725(4.6) ; 7.707(5.1) ; 7.638(0.5) ; 7.621(0.5) ; 7.601(0.3) ; 7.498(0.4) ; 6.185(0.4) ; 5.864(16.0) ; 4.055(0.4) ; 4.038(1.3) ; 4.020(1.4) ; 4.002(0.4) ; 3.368(0.4) ; 3.326(380.2) ; 2.998(0.7) ; 2.714(0.8) ; 2.675(2.0) ; 2.671(2.7) ; 2.666(2.1) ; 2.662(1.1) ; 2.524(6.9) ; 2.511(141.7) ; 2.506(291.2) ; 2.502(390.9) ; 2.497(289.0) ; 2.493(143.2) ; 2.338(0.8) ; 2.333(1.8) ; 2.329(2.6) ; 2.324(1.9) ; 2.121(0.7) ; 1.989(5.9) ; 1.398(0.9) ; 1.362(0.4) ; 1.236(1.7) ; 1.224(0.4) ; 1.206(0.5) ; 1.193(1.6) ; 1.175(3.2) ; 1.157(1.6) ; 1.045(0.5) ; 1.029(0.5) ; 0.146(2.7) ; 0.008(22.3) ; 0.000(597.1) ; -0.009(24.1) ; -0.036(0.4) ; -0.150(2.6)
I-1-66	2.28	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 11.399(15.8) ; 9.893(0.5) ; 8.943(11.8) ; 8.894(0.3) ; 8.715(0.4) ; 8.484(10.4) ; 8.317(1.3) ; 8.202(0.5) ; 8.184(0.5) ; 7.968(0.4) ; 7.955(0.8) ; 7.937(0.8) ; 7.934(0.7) ; 7.781(0.4) ; 7.750(0.8) ; 7.749(0.8) ; 7.730(0.9) ; 7.705(0.7) ; 7.686(0.8) ; 7.672(0.7) ; 7.660(0.5) ; 7.642(0.9) ; 7.623(1.2) ; 7.587(6.7) ; 7.570(8.9) ; 7.557(8.7) ; 7.537(16.0) ; 7.520(10.0) ; 7.505(13.7) ; 7.485(6.8) ; 7.455(9.0) ; 7.437(11.6) ; 7.419(5.4) ; 5.863(14.5) ; 4.056(0.9) ; 4.038(2.7) ; 4.020(2.7) ; 4.002(0.9) ; 3.326(291.6) ; 2.675(2.2) ; 2.671(2.9) ; 2.667(2.2) ; 2.524(7.2) ; 2.506(333.8) ; 2.502(442.3) ; 2.497(331.1) ; 2.333(2.2) ; 2.329(2.9) ; 2.324(2.2) ; 2.180(0.6) ; 1.989(11.6) ; 1.398(1.3) ; 1.235(8.4) ; 1.193(3.2) ; 1.175(6.3) ; 1.157(3.1) ; 1.045(0.7) ; 1.029(0.7) ; 0.854(0.8) ; 0.836(0.4) ; 0.146(2.8) ; 0.008(23.2) ; 0.000(611.3) ; -0.008(28.8) ; -0.150(2.8)
I-1-67	2.43	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO) : δ = 13.304(0.4) ; 11.323(12.6) ; 8.942(8.9) ; 8.483(3.1) ; 8.316(0.6) ; 7.986(2.5) ; 7.967(2.7) ; 7.930(8.0) ; 7.910(8.5) ; 7.708(1.9) ; 7.689(2.2) ; 7.663(0.3) ; 7.643(0.3) ; 7.490(14.3) ; 7.478(16.0) ; 7.457(2.7) ; 7.245(4.6) ; 7.234(6.4) ; 7.225(7.4) ; 7.214(6.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		2); 7.203(3.6); 5.863(4.7); 4.055(0.6); 4.038(1.9); 4.020(1.9); 4.002(0.7); 3.327(206.0); 2.671(1.9); 2.506(228.9); 2.502(282.2); 2.498(224.3); 2.329(1.9); 1.989(7.8); 1.398(0.4); 1.236(1.6); 1.193(2.1); 1.175(4.2); 1.157(2.1); 0.146(1.5); 0.000(309.9); -0.150(1.6)
I-1-68	2.61	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 12.817(0.5); 11.130(4.6); 8.940(5.8); 7.767(1.0); 7.747(1.0); 7.479(0.6); 7.463(3.2); 7.444(4.3); 7.425(2.9); 7.406(2.2); 7.341(3.7); 7.322(3.7); 7.304(2.9); 7.294(1.2); 7.285(3.0); 7.275(1.5); 7.267(1.4); 7.257(0.7); 3.327(39.4); 2.942(0.6); 2.923(1.9); 2.905(2.0); 2.886(0.7); 2.771(1.6); 2.752(4.9); 2.733(5.0); 2.715(1.7); 2.671(0.4); 2.506(44.9); 2.502(57.2); 2.498(44.3); 2.328(0.4); 1.989(1.2); 1.235(0.4); 1.191(6.7); 1.172(16.0); 1.154(11.1); 1.135(2.4); 0.146(0.3); 0.000(65.3)
I-1-70	2.15	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.288(8.0); 8.842(7.4); 8.316(1.4); 7.905(7.5); 7.887(8.5); 7.839(8.1); 7.820(10.3); 7.770(6.9); 7.755(7.0); 7.697(16.0); 7.622(6.4); 7.604(9.7); 7.586(6.2); 7.538(7.2); 7.520(10.0); 7.503(5.3); 4.056(0.5); 4.038(1.5); 4.020(1.5); 4.002(0.5); 3.323(318.2); 2.675(2.0); 2.670(2.8); 2.666(2.1); 2.524(6.1); 2.510(149.6); 2.506(311.6); 2.501(423.9); 2.497(325.1); 2.493(171.9); 2.333(1.9); 2.328(2.7); 2.324(2.1); 1.988(6.6); 1.236(0.8); 1.193(1.7); 1.175(3.5); 1.157(1.7); 0.146(2.7); 0.008(20.9); 0.000(574.9); -0.008(31.9); -0.150(2.6)
I-1-71	1.96	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.206(8.2); 8.826(6.4); 8.315(0.7); 7.904(8.4); 7.884(8.9); 7.656(4.4); 7.621(6.9); 7.603(10.4); 7.583(7.7); 7.540(14.0); 7.536(13.6); 7.522(16.0); 7.503(9.6); 7.498(9.6); 7.473(4.8); 7.448(6.7); 7.430(7.6); 7.413(3.5); 4.038(0.4); 4.020(0.4); 3.323(141.6); 2.675(1.3); 2.670(1.5); 2.666(1.1); 2.510(123.3); 2.506(200.1); 2.501(229.8); 2.497(159.4); 2.493(74.2); 2.333(1.3); 2.328(1.5); 2.324(1.0); 1.988(1.6); 1.236(1.5); 1.193(0.4); 1.175(0.9); 1.157(0.4); 0.146(1.2); 0.008(26.2); 0.000(281.2); -0.008(12.4); -0.150(1.3)
I-1-72	2.09	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.305(0.6); 11.133(9.3); 8.826(6.6); 8.316(0.5); 8.088(0.6); 8.068(0.6); 7.988(0.9); 7.968(1.0); 7.925(7.5); 7.905(16.0); 7.885(9.9); 7.709(1.3); 7.689(2.5); 7.660(3.8); 7.622(5.6); 7.604(9.5); 7.585(5.3); 7.540(6.4); 7.518(9.2); 7.498(6.5)

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		;7.469(12.9);7.361(0.4);7.340(0.5);7.319(0.4);7.247(1.1);7.227(4.8);7.212(6.0);7.192(3.1);4.037(0.4);4.019(0.4);3.324(66.6);2.675(0.7);2.670(1.0);2.666(0.8);2.523(2.3);2.510(56.0);2.505(116.5);2.501(158.3);2.497(120.8);2.492(63.8);2.332(0.7);2.328(1.0);2.323(0.8);1.988(1.8);1.235(0.3);1.192(0.5);1.174(0.9);1.157(0.5);0.146(0.8);0.008(5.5);0.000(159.3);-0.008(8.4);-0.150(0.8)
I-1-73	2.34	¹ H-NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.937(3.6);8.823(6.7);7.904(3.1);7.887(3.2);7.884(3.4);7.665(1.3);7.645(2.6);7.624(1.9);7.621(2.1);7.606(3.0);7.603(3.2);7.586(1.4);7.583(1.5);7.539(2.0);7.535(2.0);7.520(2.7);7.516(2.7);7.501(1.3);7.497(1.3);7.447(1.8);7.428(3.1);7.412(2.9);7.393(2.1);7.332(3.8);7.314(2.6);7.294(1.9);7.275(2.8);7.257(1.2);3.323(52.3);2.903(0.3);2.779(1.7);2.760(5.2);2.741(5.4);2.722(1.8);2.675(0.3);2.670(0.5);2.666(0.4);2.523(1.1);2.506(57.1);2.501(77.5);2.497(59.8);2.332(0.4);2.328(0.5);2.324(0.4);1.200(7.5);1.181(16.0);1.163(7.3);1.153(1.2);1.134(0.5);0.008(2.3);0.000(67.0);-0.008(3.8);-0.150(0.3)
I-1-75	2.20	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.272(2.8);8.793(2.5);8.087(3.0);8.068(3.2);7.836(2.6);7.818(3.4);7.768(2.5);7.753(2.4);7.699(4.5);7.589(5.7);7.500(0.4);7.359(1.9);7.339(3.1);7.320(1.7);4.055(1.3);4.038(3.8);4.020(3.9);4.002(1.4);3.325(47.4);2.670(0.4);2.666(0.3);2.524(0.4);2.506(61.3);2.501(84.6);2.497(66.4);2.328(0.7);2.324(0.6);1.988(16.0);1.235(1.5);1.192(4.1);1.175(8.3);1.157(4.2);0.008(1.9);0.000(77.6);-0.150(0.4)
I-1-76	2.01	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.378(0.4);11.188(9.2);8.776(6.6);8.315(1.4);8.086(10.9);8.066(12.3);7.770(1.2);7.751(1.4);7.696(0.4);7.595(11.4);7.578(16.0);7.548(11.1);7.527(15.3);7.509(7.8);7.489(9.2);7.471(5.6);7.446(7.6);7.428(9.5);7.412(5.3);7.361(6.6);7.356(5.9);7.339(10.6);7.325(5.2);7.319(6.4);4.056(0.5);4.038(1.2);4.020(1.3);4.002(0.5);3.324(443.3);2.675(1.2);2.671(2.2);2.666(1.6);2.510(152.6);2.506(335.8);2.501(469.5);2.497(372.5);2.493(211.0);2.333(3.4);2.328(4.3);2.324(3.6);1.988(5.3);1.398(0.4);1.258(0.4);1.235(1.2);1.192(1.4);1.175(2.6);1.157(1.4);0.146(1.7);0.008(11.8);0.000(418.4);-0.15

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		0(2.2)
I-1-77	2.15	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.305(0.8); 11.116(12.2); 8.778(8.3); 8.316(1.2); 8.089(12.8); 8.069(13.9); 7.984(1.0); 7.964(1.1); 7.925(8.7); 7.905(9.3); 7.704(0.8); 7.684(1.0); 7.615(3.4); 7.598(12.3); 7.583(14.2); 7.470(16.0); 7.362(6.7); 7.356(5.0); 7.341(9.9); 7.319(5.6); 7.271(0.4); 7.224(5.8); 7.211(6.8); 7.190(3.6); 4.055(0.4); 4.037(1.2); 4.020(1.2); 4.002(0.4); 3.323(22.0.8); 2.675(1.9); 2.670(2.7); 2.666(2.0); 2.524(6.0); 2.510(153.5); 2.506(316.7); 2.501(425.4); 2.497(318.3); 2.493(163.2); 2.333(2.0); 2.328(2.8); 2.324(2.1); 1.989(5.2); 1.235(0.5); 1.193(1.4); 1.175(2.7); 1.157(1.4); 0.146(1.8); 0.008(13.4); 0.000(396.4); -0.008(18.4); -0.150(1.8)
I-1-78	2.31	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.925(3.8); 8.774(6.6); 8.088(3.4); 8.069(3.6); 7.616(1.1); 7.599(3.1); 7.579(3.7); 7.569(3.2); 7.553(1.1); 7.449(2.0); 7.429(3.2); 7.410(2.9); 7.391(2.2); 7.360(1.9); 7.355(1.8); 7.334(4.8); 7.323(2.0); 7.314(2.8); 7.294(2.0); 7.275(2.9); 7.256(1.2); 4.037(0.4); 4.020(0.4); 3.324(26.3); 2.782(1.7); 2.763(5.3); 2.744(5.5); 2.725(1.9); 2.505(31.2); 2.501(42.2); 2.496(32.7); 2.328(0.3); 1.988(1.4); 1.203(7.6); 1.184(16.0); 1.175(1.8); 1.165(7.4); 1.153(1.0); 1.134(0.4); 0.008(1.2); 0.000(38.9)
I-1-80	2.32	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 13.578(0.4); 11.331(2.0); 8.820(2.2); 8.223(0.3); 8.205(0.4); 7.935(4.3); 7.918(5.0); 7.869(0.9); 7.821(3.7); 7.791(2.9); 7.775(2.7); 7.759(3.5); 7.712(4.9); 7.601(0.7); 7.583(0.6); 7.514(1.9); 7.495(3.1); 7.475(2.2); 5.756(0.8); 4.056(1.3); 4.038(3.9); 4.020(4.0); 4.002(1.5); 3.325(30.5); 2.671(0.7); 2.502(100.7); 2.328(0.7); 1.989(16.0); 1.236(1.0); 1.193(4.3); 1.175(8.6); 1.157(4.4); 0.000(62.1); -0.149(0.3)
I-1-81	2.45	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 10.976(2.6); 8.907(2.1); 8.843(0.5); 8.791(5.4); 8.316(0.5); 8.292(1.6); 8.167(1.6); 8.149(1.8); 7.984(0.3); 7.947(1.2); 7.936(9.0); 7.927(1.8); 7.916(9.7); 7.902(0.8); 7.866(1.9); 7.845(2.0); 7.794(0.4); 7.775(0.9); 7.756(0.7); 7.704(1.4); 7.685(1.8); 7.666(0.8); 7.534(0.4); 7.514(3.2); 7.493(5.1); 7.473(3.0); 7.448(2.0); 7.431(2.9); 7.404(3.1); 7.386(2.2); 7.327(4.0); 7.308(2.7); 7.285(2.1); 7.266(2.9); 7.248(1.2); 6.182(2.5); 5.562(1.7); 4.038(0.5); 4.020(0

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		. 5); 3. 336 (10. 7); 3. 323 (163. 4); 3. 322 (139. 0); 2. 774 (2. 0); 2. 755 (5. 4); 2. 736 (5. 4); 2. 717 (1. 8); 2. 674 (1. 4); 2. 670 (1. 6); 2. 505 (219. 6); 2. 501 (242. 1); 2. 332 (1. 4); 2. 328 (1. 6); 1. 989 (2. 1); 1. 398 (0. 7); 1. 201 (8. 0); 1. 193 (2. 5); 1. 182 (16. 0); 1. 163 (7. 3); 0. 012 (2. 6); 0. 002 (23. 0); 0. 000 (46. 3); -0. 008 (2. 2)
I-1-83	2. 21	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ = 11. 326 (1. 7); 8. 907 (0. 8); 8. 831 (1. 6); 8. 283 (0. 4); 8. 167 (0. 3); 8. 150 (0. 4); 7. 923 (2. 0); 7. 903 (2. 2); 7. 867 (0. 4); 7. 833 (1. 9); 7. 828 (1. 9); 7. 819 (2. 4); 7. 801 (1. 3); 7. 781 (1. 3); 7. 767 (2. 0); 7. 756 (1. 8); 7. 749 (2. 1); 7. 719 (2. 8); 7. 709 (2. 9); 7. 704 (2. 9); 7. 685 (1. 8); 7. 667 (0. 8); 7. 613 (0. 4); 7. 592 (1. 1); 7. 569 (2. 0); 7. 548 (1. 7); 7. 472 (1. 1); 7. 453 (1. 9); 7. 438 (1. 8); 7. 419 (0. 8); 4. 055 (1. 2); 4. 038 (3. 6); 4. 020 (3. 6); 4. 002 (1. 2); 3. 347 (17. 1); 2. 675 (0. 4); 2. 671 (0. 6); 2. 666 (0. 5); 2. 524 (1. 2); 2. 510 (32. 9); 2. 506 (68. 5); 2. 502 (92. 1); 2. 497 (67. 5); 2. 493 (33. 3); 2. 333 (0. 4); 2. 328 (0. 6); 2. 324 (0. 4); 2. 136 (1. 4); 1. 989 (16. 0); 1. 193 (4. 2); 1. 175 (8. 3); 1. 157 (4. 1)
I-1-84	2. 02	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ = 13. 379 (0. 4); 11. 560 (1. 8); 11. 249 (5. 1); 9. 339 (1. 4); 8. 907 (11. 9); 8. 865 (0. 4); 8. 816 (4. 5); 8. 316 (0. 5); 8. 290 (0. 4); 8. 223 (1. 7); 8. 205 (1. 9); 8. 201 (1. 5); 8. 167 (5. 4); 8. 154 (1. 4); 8. 149 (6. 2); 8. 146 (4. 9); 7. 923 (7. 4); 7. 903 (8. 1); 7. 821 (0. 5); 7. 802 (1. 3); 7. 791 (4. 5); 7. 784 (1. 4); 7. 780 (1. 6); 7. 774 (6. 1); 7. 770 (4. 2); 7. 759 (1. 7); 7. 756 (2. 7); 7. 753 (1. 6); 7. 729 (1. 6); 7. 710 (2. 8); 7. 704 (4. 9); 7. 684 (6. 8); 7. 670 (1. 2); 7. 666 (2. 8); 7. 590 (6. 9); 7. 568 (10. 4); 7. 547 (15. 5); 7. 544 (16. 0); 7. 539 (10. 1); 7. 533 (9. 9); 7. 529 (11. 0); 7. 513 (4. 6); 7. 509 (5. 1); 7. 491 (5. 5); 7. 473 (7. 0); 7. 459 (6. 9); 7. 450 (9. 3); 7. 442 (9. 2); 7. 439 (9. 7); 7. 431 (9. 8); 7. 424 (7. 3); 7. 416 (5. 4); 7. 409 (4. 3); 6. 183 (0. 6); 4. 056 (0. 9); 4. 038 (2. 8); 4. 020 (2. 8); 4. 002 (1. 0); 3. 414 (5. 8); 2. 676 (0. 8); 2. 671 (1. 2); 2. 667 (0. 9); 2. 662 (0. 4); 2. 525 (2. 3); 2. 511 (65. 7); 2. 507 (137. 5); 2. 502 (185. 3); 2. 498 (136. 6); 2. 493 (68. 1); 2. 338 (0. 4); 2. 333 (0. 9); 2. 329 (1. 2); 2. 324 (0. 9); 2. 137 (1. 4); 1. 989 (12. 3); 1. 397 (0. 4); 1. 235 (1. 3); 1. 193 (3. 3); 1. 175 (6. 5); 1. 157 (3. 2); 0. 000 (0. 6)
I-1-85	2. 15	¹ H NMR (400. 0 MHz, d6-DMSO): δ = 13. 301 (1. 0); 11. 492 (0. 8); 11. 165 (7. 9); 9. 336 (0. 6); 8. 906 (1. 8); 8. 810 (6. 1); 8. 775 (0. 7); 8. 315 (0. 5); 8. 227 (0. 7); 8. 206 (0. 7); 8. 167 (1. 3); 8. 146 (1. 3); 7. 988 (2. 1); 7. 969 (2. 2); 7. 948 (0. 9); 7. 923 (14. 2); 7. 903 (15. 3); 7. 803 (0. 5); 7. 780 (0. 5); 7. 774 (0.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		8); 7.756(0.6); 7.729(0.6); 7.710(2.5); 7.691(2.4); 7.684(2.1); 7.664(0.7); 7.590(3.9); 7.568(8.2); 7.546(5.5); 7.474(16.0); 7.459(9.3); 7.454(10.1); 7.439(6.8); 7.418(2.9); 7.343(0.4); 7.331(0.4); 7.248(1.6); 7.229(4.6); 7.220(4.9); 7.211(5.6); 7.201(4.5); 6.180(2.0); 4.055(0.4); 4.037(1.4); 4.019(1.3); 4.001(0.5); 3.323(141.8); 2.741(0.3); 2.699(0.4); 2.670(2.2); 2.501(348.2); 2.497(312.6); 2.406(0.8); 2.385(0.4); 2.328(2.2); 1.988(5.2); 1.397(0.7); 1.192(1.5); 1.184(0.7); 1.174(3.0); 1.157(1.5); 0.145(1.3); 0.007(8.6); -0.001(247.8); -0.150(1.3)
I-1-87	2.46	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.344(6.5); 8.907(4.1); 8.800(6.5); 8.316(0.8); 8.277(6.9); 8.224(0.3); 8.167(2.4); 8.149(2.7); 8.146(2.1); 8.026(15.2); 8.007(16.0); 7.941(8.8); 7.920(8.7); 7.832(6.8); 7.816(8.6); 7.793(4.2); 7.774(6.7); 7.756(8.1); 7.753(7.8); 7.704(13.7); 7.688(10.7); 7.685(10.9); 7.666(5.1); 7.514(0.5); 7.501(0.4); 7.477(0.4); 6.182(3.7); 5.577(6.1); 4.056(0.7); 4.038(2.2); 4.020(2.2); 4.002(0.7); 3.324(131.6); 2.675(1.3); 2.671(1.8); 2.666(1.3); 2.524(4.3); 2.510(101.3); 2.506(206.5); 2.502(275.7); 2.497(205.1); 2.493(104.3); 2.333(1.3); 2.328(1.8); 2.324(1.4); 2.180(0.4); 1.989(9.5); 1.398(0.5); 1.259(0.4); 1.235(6.0); 1.193(2.5); 1.183(0.4); 1.175(5.0); 1.157(2.5); 0.854(0.6); 0.146(0.4); 0.008(2.9); 0.000(83.0); -0.008(3.8); -0.150(0.4)
I-1-88	2.26	¹ H NMR (400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.558(1.1); 11.263(3.6); 9.339(0.8); 8.907(0.3); 8.828(0.4); 8.783(4.3); 8.315(1.4); 8.223(1.1); 8.205(1.2); 8.201(1.0); 8.024(16.0); 8.004(16.0); 7.803(0.7); 7.784(0.7); 7.743(0.8); 7.730(1.7); 7.710(1.6); 7.692(0.8); 7.577(3.5); 7.560(4.1); 7.540(4.9); 7.522(7.8); 7.506(6.8); 7.486(5.6); 7.461(3.3); 7.438(4.7); 7.421(5.9); 7.404(3.6); 4.055(0.9); 4.038(2.9); 4.020(3.0); 4.002(1.0); 3.323(148.9); 2.675(1.9); 2.671(2.7); 2.666(2.0); 2.524(6.4); 2.510(146.4); 2.506(303.1); 2.501(408.1); 2.497(302.6); 2.492(151.9); 2.337(0.9); 2.333(1.9); 2.328(2.7); 2.324(2.0); 1.989(13.0); 1.398(0.7); 1.348(0.5); 1.235(1.3); 1.193(3.5); 1.175(7.0); 1.157(3.4); 1.119(0.5); 0.146(0.5); 0.008(3.9); 0.000(117.0); -0.009(5.0); -0.150(0.5)
I-1-89	1.76	合成実施例5を参照
I-2-1	2.19	合成実施例7を参照
I-2-2	2.35	合成実施例8を参照
I-2-3	2.57	合成実施例9を参照

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
I-1-90	2.31	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ = 11.268 (2.7); 10.974 (0.5); 8.897 (1.3); 8.862 (2.6); 8.316 (0.5); 8.010 (0.6); 7.992 (0.6); 7.988 (0.5); 7.898 (3.1); 7.842 (2.5); 7.824 (3.1); 7.775 (2.2); 7.764 (2.2); 7.705 (4.2); 7.627 (0.6); 7.615 (0.5); 7.609 (0.7); 7.591 (0.5); 7.545 (0.7); 7.526 (0.9); 7.508 (0.7); 7.474 (3.1); 5.755 (15.8); 4.210 (1.0); 4.184 (2.3); 4.156 (2.6); 4.129 (1.7); 4.115 (1.7); 4.087 (1.0); 4.056 (0.6); 4.038 (0.8); 4.020 (0.8); 3.323 (77.3); 2.891 (0.4); 2.680 (0.5); 2.675 (1.0); 2.671 (1.3); 2.666 (1.0); 2.524 (3.6); 2.519 (5.3); 2.510 (71.7); 2.506 (147.9); 2.502 (197.1); 2.497 (144.6); 2.493 (71.5); 2.422 (16.0); 2.349 (9.1); 2.329 (3.9); 1.989 (2.6); 1.235 (0.5); 1.215 (1.8); 1.193 (0.7); 1.188 (1.3); 1.183 (1.9); 1.175 (2.4); 1.157 (0.7); 0.146 (1.0); 0.008 (7.5); 0.000 (224.6); -0.008 (8.7); -0.150 (1.0)
I-1-91	1.82	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =11.432 (11.2); 8.939 (16.0); 8.705 (1.0); 8.612 (1.0); 8.385 (6.0); 8.365 (6.6); 8.318 (0.8); 8.283 (0.9); 8.169 (0.4); 8.151 (0.4); 8.147 (0.4); 7.821 (4.1); 7.807 (5.2); 7.791 (4.1); 7.761 (1.4); 7.741 (3.0); 7.724 (4.7); 7.705 (4.1); 7.686 (2.4); 7.668 (1.5); 7.491 (6.8); 7.469 (12.0); 7.448 (6.3); 7.366 (1.5); 6.191 (0.5); 4.056 (1.0); 4.038 (3.2); 4.020 (3.2); 4.003 (1.1); 3.362 (0.9); 3.336 (223.8); 3.185 (0.5); 2.677 (0.9); 2.672 (1.2); 2.668 (0.9); 2.526 (3.0); 2.508 (136.4); 2.503 (178.3); 2.499 (135.0); 2.335 (0.9); 2.330 (1.2); 2.326 (0.9); 1.990 (14.0); 1.397 (1.1); 1.193 (3.7); 1.175 (7.3); 1.157 (3.6); 0.008 (1.4); 0.000 (38.1); -0.008 (1.9)
I-1-92	2.04	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =13.379 (0.9); 11.387 (9.2); 8.951 (6.4); 8.909 (1.7); 8.500 (10.2); 8.318 (0.4); 8.298 (1.2); 8.280 (2.4); 8.271 (2.5); 8.260 (1.9); 8.253 (4.3); 8.245 (1.9); 8.234 (2.5); 8.226 (2.5); 8.207 (1.1); 8.168 (0.9); 8.150 (1.1); 8.146 (1.9); 8.127 (2.2); 8.119 (2.2); 8.109 (1.3); 8.100 (4.0); 8.092 (1.3); 8.082 (2.1); 8.073 (2.1); 8.055 (0.9); 7.789 (5.3); 7.786 (3.6); 7.771 (4.6); 7.768 (4.5); 7.757 (0.6); 7.704 (0.8); 7.685 (1.1); 7.667 (0.5); 7.591 (3.6); 7.573 (4.5); 7.557 (5.3); 7.545 (12.8); 7.542 (16.0); 7.537 (15.9); 7.53

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		1 (9.5); 7.527 (8.2); 7.521 (4.9); 7.506 (7.0); 7.486 (3.4); 7.482 (3.0); 7.457 (5.0); 7.455 (5.0); 7.449 (5.2); 7.441 (8.4); 7.435 (7.3); 7.429 (4.9); 7.427 (4.4); 7.423 (5.2); 7.415 (3.5); 7.408 (2.6); 6.186 (1.3); 5.854 (13.9); 4.056 (1.1); 4.038 (3.4); 4.020 (3.5); 4.002 (1.2); 3.329 (60.5); 2.681 (0.4); 2.676 (0.8); 2.672 (1.2); 2.667 (0.9); 2.525 (2.6); 2.520 (3.9); 2.512 (64.9); 2.507 (136.6); 2.503 (184.2); 2.498 (134.9); 2.494 (65.6); 2.339 (0.4); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.989 (15.5); 1.397 (3.5); 1.235 (1.8); 1.193 (4.2); 1.175 (8.2); 1.157 (4.1); 0.146 (1.0); 0.008 (7.9); 0.000 (245.1); -0.009 (8.8); -0.150 (1.0)
I-1-93	2.23	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =11.471 (11.6); 8.964 (8.9); 8.500 (8.3); 8.318 (1.1); 8.298 (1.9); 8.272 (4.8); 8.254 (6.9); 8.235 (4.9); 8.147 (0.9); 8.128 (1.7); 8.120 (1.7); 8.110 (1.2); 8.102 (3.0); 8.093 (1.2); 8.083 (1.7); 8.075 (1.6); 8.056 (0.8); 7.847 (11.0); 7.829 (14.5); 7.777 (8.7); 7.761 (9.3); 7.726 (15.9); 7.709 (16.0); 5.857 (12.7); 4.056 (0.4); 4.038 (1.2); 4.020 (1.2); 4.002 (0.4); 3.331 (334.7); 2.999 (0.4); 2.714 (0.4); 2.672 (2.7); 2.507 (324.5); 2.503 (403.1); 2.499 (304.6); 2.330 (2.7); 1.989 (5.3); 1.398 (2.4); 1.235 (0.7); 1.193 (1.4); 1.175 (2.7); 1.157 (1.4); 0.000 (57.2)
I-1-94	1.92	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =10.952 (0.3); 10.925 (12.8); 8.918 (16.0); 8.447 (0.3); 7.819 (13.4); 7.805 (14.2); 7.769 (1.0); 7.755 (2.1); 7.752 (1.6); 7.739 (3.5); 7.733 (2.7); 7.723 (2.0); 7.717 (5.6); 7.712 (2.5); 7.701 (2.8); 7.696 (3.7); 7.680 (1.7); 7.647 (0.6); 7.643 (0.8); 7.484 (8.9); 7.462 (15.0); 7.442 (7.3); 7.365 (11.1); 7.351 (10.6); 7.250 (1.1); 7.236 (1.0); 6.932 (0.9); 6.919 (0.9); 6.189 (0.4); 3.361 (0.6); 3.332 (90.6); 3.183 (0.5); 2.985 (3.5); 2.825 (3.5); 2.676 (0.6); 2.672 (0.9); 2.667 (0.6); 2.525 (2.2); 2.511 (50.1); 2.507 (99.4); 2.503 (129.7); 2.498 (96.9); 2.494 (49.5); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.6); 1.989 (1.4); 1.235 (1.2); 1.193 (0.5); 1.175 (0.8); 1.157 (0.4); 0.008 (1.1); 0.000 (28.0); -0.008 (1.3)
I-1-95	2.33	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =10.930 (3.3); 8.762 (5.2); 8.017 (2.4); 7.997 (2.9); 7.939 (1.0); 7.921

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		(2.5); 7.902 (1.9); 7.848 (1.9); 7.829 (2.6); 7.810 (1.1); 7.764 (2.5); 7.745 (2.1); 7.459 (0.6); 7.445 (1.7); 7.428 (2.7); 7.410 (2.7); 7.392 (2.0); 7.330 (3.5); 7.311 (2.3); 7.291 (1.9); 7.272 (2.8); 7.253 (1.2); 3.330 (25.7); 2.923 (0.8); 2.904 (0.9); 2.774 (1.6); 2.755 (4.9); 2.737 (5.0); 2.718 (1.7); 2.671 (0.4); 2.666 (0.3); 2.524 (1.1); 2.510 (24.4); 2.506 (49.3); 2.502 (64.8); 2.497 (48.0); 2.493 (24.1); 2.329 (0.4); 1.195 (7.3); 1.176 (16.0); 1.157 (7.3); 1.153 (3.8); 1.134 (1.1); 0.000 (8.5); -0.008 (0.4)
I-1-96	2.49	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =11.303 (2.1); 8.874 (2.1); 8.316 (0.8); 7.954 (2.0); 7.839 (1.9); 7.823 (2.4); 7.772 (1.8); 7.762 (1.8); 7.703 (3.4); 7.634 (2.9); 4.983 (1.3); 4.960 (3.6); 4.935 (3.7); 4.912 (1.5); 4.056 (1.2); 4.038 (3.6); 4.020 (3.6); 4.002 (1.2); 3.322 (90.1); 2.693 (12.6); 2.676 (3.6); 2.671 (3.5); 2.666 (2.6); 2.524 (4.6); 2.519 (6.8); 2.511 (103.8); 2.506 (216.3); 2.502 (290.2); 2.497 (213.7); 2.493 (105.7); 2.383 (5.5); 2.337 (1.3); 2.333 (1.9); 2.328 (2.4); 2.324 (1.8); 1.989 (16.0); 1.398 (4.1); 1.193 (4.3); 1.175 (8.5); 1.157 (4.2); 0.146 (2.1); 0.008 (15.7); 0.000 (462.7); -0.009 (18.0); -0.026 (0.5); -0.150 (2.1)
I-1-97	2.34	¹ H NMR (400.0 MHz, d6 DMSO): δ =13.307 (0.7); 11.308 (16.0); 8.993 (6.9); 8.618 (9.2); 8.611 (9.3); 8.317 (0.4); 7.993 (1.9); 7.991 (2.0); 7.973 (2.1); 7.971 (2.1); 7.936 (8.6); 7.916 (9.2); 7.771 (1.3); 7.763 (1.6); 7.755 (1.8); 7.748 (2.8); 7.744 (2.8); 7.736 (2.9); 7.727 (2.9); 7.723 (3.0); 7.717 (3.3); 7.713 (3.1); 7.698 (2.7); 7.694 (2.2); 7.597 (1.5); 7.577 (2.3); 7.569 (2.2); 7.562 (2.1); 7.554 (2.7); 7.549 (2.3); 7.547 (2.3); 7.541 (2.6); 7.532 (2.3); 7.528 (2.6); 7.520 (2.1); 7.513 (3.5); 7.505 (2.5); 7.495 (9.1); 7.477 (15.2); 7.460 (4.7); 7.454 (3.6); 7.447 (3.4); 7.441 (2.4); 7.436 (2.5); 7.433 (2.2); 7.430 (2.4); 7.423 (2.8); 7.417 (2.0); 7.409 (1.3); 7.250 (4.9); 7.244 (4.0); 7.230 (6.7); 7.213 (3.7); 7.207 (3.5); 5.937 (13.6); 4.056 (1.2); 4.038 (3.6); 4.020 (3.6); 4.002 (1.2); 3.329 (84.4); 2.681 (0.5); 2.676 (1.2); 2.672 (1.6); 2.667 (1.2); 2.663 (0.6); 2.525 (4.1); 2.520 (6.2); 2.512 (89.

10

20

30

40

化合物の番号	log P 中性	¹ H NMRデータ
		7); 2.507 (183.7); 2.503 (242.7); 2.498 (175.4); 2.494 (83.9); 2.338 (0.5); 2.334 (1.1); 2.329 (1.6); 2.325 (1.1); 2.320 (0.5); 1.989 (15.9); 1.234 (0.4); 1.193 (4.2); 1.175 (8.4); 1.157 (4.2); 0.146 (1.3); 0.008 (9.9); 0.000 (302.0); -0.009 (10.1); -0.150 (1.3)
I-1-98	3.21	¹ H NMR (400.0 MHz, d ₆ DMSO): δ=13.575 (0.3); 11.217 (3.2); 10.928 (0.5); 8.771 (1.4); 8.735 (3.2); 8.316 (0.6); 8.004 (0.6); 7.986 (0.6); 7.982 (0.5); 7.820 (3.5); 7.767 (2.8); 7.749 (2.4); 7.698 (5.0); 7.646 (4.6); 7.605 (1.1); 7.587 (0.8); 7.541 (0.7); 7.522 (0.9); 7.508 (0.4); 7.504 (0.5); 7.356 (3.8); 4.064 (1.8); 4.055 (2.3); 4.038 (5.9); 4.020 (5.5); 4.015 (4.9); 4.002 (3.0); 3.990 (2.2); 3.325 (84.9); 2.675 (0.8); 2.671 (1.1); 2.666 (0.8); 2.524 (2.3); 2.511 (61.7); 2.506 (128.3); 2.502 (172.9); 2.497 (128.9); 2.493 (65.1); 2.406 (16.0); 2.333 (1.4); 2.329 (1.6); 2.324 (1.3); 2.209 (9.8); 1.989 (6.9); 1.690 (0.4); 1.193 (1.8); 1.175 (3.6); 1.157 (1.7); 0.008 (0.8); 0.000 (26.9); -0.008 (1.1)

10

20

【0388】

1) log P値決定のための方法の説明（ギ酸方法）

表に示したlog P値は、逆相カラム（C18）を用いたHPLC（高性能液体クロマトグラフィー）で、EEC Directive 79/831 Annex V.A8に従って決定した。

30

温度：55℃。

酸性範囲である決定用の溶離液（pH 3.4）：

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

勾配：4.25分で10%溶離液A／90%溶離液Bから95%溶離液A／5%溶離液B。

【0389】

較正を、公知のlog P値（2つの連続したアルカノンの間の線形補間によって、保持時間をもとに決定したlog P値）を有する非分岐アルカン-2-オン（3～16個の炭素原子を有する）で行った。ラムダ最大値を、200nm～400nmのUVスペクトルを用いたクロマトグラフィー信号の最大値で決定した。

40

【0390】

2) NMRスペクトルの計測

NMRスペクトルは、フロープローブヘッド（容量60μl）が取り付けられたBruker Avance 400を使用して決定した。使用した溶媒はCD₃CNまたはDMSO-D₆であり、テトラメチルシラン（0.00ppm）を参考のために使用した。分離の場合で、NMRスペクトルは、Bruker Avance II 600を用いて決定した。使用した溶媒はCD₃CNまたはDMSO-D₆であり、テトラメチルシラン（0.00ppm）を参考のために使用した。

【0391】

50

シグナルの分裂 (splitting) は次のように示した: s (一重線)、d (二重線)、t (三重線)、q (四重線)、q u i n (五重線)、m (多重線)。

【0392】

NMRピークのリスト方法

選択した実施例に関する ^1H NMR データを、 ^1H NMR のピークリストの形態で記す場合、最初に ppm で δ 値を、次いで、丸括弧にシグナル強度を、各シグナルピークに対してリストにする。様々なシグナルピークに関する δ 値とシグナル強度の数のペアを、セミコロンでそれぞれ分離してリストにする。

【0393】

したがって、一実施例のピークの列挙は次のようになる:

δ 1 (強度 1) ; δ 2 (強度 2) ; …… ; δ i (強度 i) ; …… ; δ n (強度 n)

10

【0394】

鋭いシグナルの強度は、cm で表される、NMR スペクトルの印刷例のシグナルの高さと相関し、シグナル強度の本当の比を示す。幅の広いシグナルの場合、複数のピークまたはシグナルの中間およびその相対強度をスペクトルの一番強いシグナルと比較して示し得る。

【0395】

^1H NMR スペクトルの化学シフトの較正に関しては、特に DMSO で測定したスペクトルの場合、テトラメチルシランおよび／または溶媒の化学シフトを用いる。したがって、テトラメチルシランのピークは NMR ピークの列挙に起こり得るが必ずしもそうとは限らない。

20

【0396】

^1H NMR ピークのリストは、従来の ^1H NMR 印刷物に類似しており、したがって、従来の NMR 解釈にリストされるすべてのピークを通常含有する。

【0397】

さらに、従来の ^1H NMR 印刷物のように、 ^1H NMR ピークのリストは、溶媒のシグナル、対象である化合物の立体異性体のシグナルを示し得、これは、本発明の主題を形成し、および／または、不純物のピークを示し得る。

【0398】

溶媒および／または水のデルタ範囲で化合物シグナルを報告する場合、我々の ^1H NMR ピークのリストは通常の溶媒ピーク、たとえば、通常平均で高い強度を有する DMSO- d_6 中の DMSO のピークおよび水のピークを示す。

30

【0399】

対象となる化合物の立体異性体のピークおよび／または不純物のピークは通常、平均して、対象となる化合物のピークよりも低い強度を有する (たとえば、> 90 % の純度で)。

【0400】

そのような立体異性体および／または不純物は特定の調製プロセスの典型であり得る。したがって、これらのピークはこの場合、我々の調製プロセスの再現を、「副産物指紋」を参照して特定するのに役に立ち得る。

40

【0401】

公知の方法で対象となる化合物のピークを計算する専門家 (MestReC、ACD シミュレーション、しかし、経験的に算出した予測値でも) であれば、必要な場合、対象となる化合物のピークを、任意で追加の強度フィルターを用いて隔離できる。この隔離は従来の ^1H NMR 解釈での関連ピークピッキングと類似している。

【0402】

^1H NMR ピークのさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025 で見つかかり得る。

【0403】

使用実施例

50

次に続く実施例は、本発明に従った化合物の殺虫性、殺ダニ性および殺線虫性作用を示す。これらの実施例において、記載する本発明の化合物は、対応番号、たとえば、I-1-1を有する表1および2にリストされた化合物に関する：

【0404】

Boophilus microplus注射試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

適切な有効成分の製剤を作製するために、10mgの有効成分を0.5mlの溶媒と混合し、濃縮物を溶媒で所望する濃度まで希釈する。

【0405】

1μlの有効成分溶液を血をいっぱい吸った5匹の成虫雌オウシマダニ（*Boophilus microplus*）の腹部に注射した。この動物をシャーレに移し、気候を調節した部屋で保持する。

10

【0406】

受精卵を産んで7日後に、効能を評価する。可視的に受精していない卵は、気候を調節したキャビネットで、幼虫がかえるまで、およそ42日間保管する。100%の効能は、どのダニも受精卵を一切産まず；0%はすべてが受精卵であることを意味する。

【0407】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が1匹あたり20μgの適用率で100%の効能を示した：I-1-10、I-1-11、I-1-24、I-1-30、I-1-33、I-1-59、I-1-65。

20

【0408】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が1匹あたり20μgの適用率で90%の効能を示した：I-1-44、I-1-57。

【0409】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が1匹あたり20μgの適用率で80%の効能を示した：I-1-18。

【0410】

Cooperia curticei試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

適切な有効成分の製剤を作製するために、10mgの有効成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物をリングル液で所望する濃度まで希釈する。

30

【0411】

所望する濃度である有効成分製剤を含有する容器に、約40匹の線形動物の幼虫（*Cooperia curticei*）を入れた。

【0412】

5日後、死滅を%で決定する。100%は幼虫がすべて死滅し；0%はどの幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0413】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で100%の効能を示した：I-1-20、I-1-21、I-1-33、I-1-57、I-1-63。

40

【0414】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で90%の効能を示した：I-1-26、I-1-59。

【0415】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で80%の効能を示した：I-1-28、I-1-30、I-1-61、I-1-70、I-1-83、I-1-85。

【0416】

Haemonchus contortus試験

50

溶媒：ジメチルスルホキシド

適切な有効成分の製剤を作製するために、10mgの有効成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物をリンゲル液で所望する濃度まで希釈する。

【0417】

所望する濃度である有効成分製剤を含有する容器に、約40匹の捻転胃虫 (red stomach worm) (Haemonchus contortus) を入れた。

【0418】

5日後、死滅を%で決定する。100%は幼虫がすべて死滅し；0%はどの幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0419】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で80%の効能を示した：I-1-21。

【0420】

Lucilia cuprina試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

適切な有効成分の製剤を作製するために、10mgの有効成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物を水で所望する濃度まで希釈する。

【0421】

オーストラリアのヒツジキンバエ (Australian sheep blowfly) (Lucilia cuprina) のL1である幼虫約20匹を、馬のひき肉および所望する濃度の有効成分調製物を含有する試験容器にうつした。

【0422】

2日後、死滅を%で決定する。100%は幼虫がすべて死滅し；0%はどの幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0423】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が100ppmの適用率で100%の効能を示した：I-1-11、I-1-24。

【0424】

Musca domestica試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

適切な有効成分の製剤を作製するために、10mgの有効成分を0.5mlのジメチルスルホキシドと混合し、濃縮物を水で所望する濃度まで希釈する。

【0425】

糖溶液および所望する濃度の有効成分製剤で処理したスポンジを含有する容器に、10匹の成虫イエバエ (Musca domestica) を入れた。

【0426】

2日後、死滅を%で決定する。100%はハエがすべて死滅し；0%はどのハエも死滅しなかったことを意味する。

【0427】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が100ppmの適用率で80%の効能を示した：I-1-11、I-1-24。

【0428】

Meloidogyne incognita試験 (MELGIN)

溶媒：125.0重量部のアセトン

適切な有効成分の製剤を作製するために、1重量部の有効成分を記述した量の溶媒と混合し、濃縮物を水で所望する濃度まで希釈する。

【0429】

容器を、砂、有効成分溶液、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の種で満たす。レタスの種が発芽し、植物が育つ。虫こぶが根で育つ。

10

20

30

40

50

【0430】

14日後、殺線虫性効能を虫こぶの形成によって%で決定する。100%は虫こぶが一切見つからず；0%は処理した植物の虫こぶの数が未処理の対照群に対応することを意味する。

【0431】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で100%の効能を示した：I-1-8、I-1-10、I-1-13、I-1-14、I-1-15、I-1-18、I-1-19、I-1-20、I-1-21、I-1-24、I-1-26、I-1-28、I-1-29、I-1-30、I-1-31、I-1-32、I-1-33、I-1-35、I-1-44、I-1-45、I-1-57、I-1-58、I-1-59、I-1-60、I-1-61、I-1-62、I-1-63、I-1-64、I-1-80、I-1-83、I-1-85、I-1-89、I-1-91、I-1-93。

10

【0432】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が20ppmの適用率で90%の効能を示した：I-1-4、I-1-11、I-1-12、I-1-22、I-1-27、I-1-40、I-1-42、I-1-46、I-1-67、I-1-70、I-1-75、I-1-87、I-1-92。

【0433】

Myzus persicaeスプレー試験

20

溶媒：78重量部のアセトン

：1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

【0434】

適切な有効成分の製剤を作製するために、1重量部の有効成分を、記述した重量部の溶媒を用いて溶解し、所望する濃度が達成されるまで、濃度が1000ppmの乳化剤を含有する水と混ぜる。さらに試験濃縮物を作製するために、この調製物を乳化剤含有水で希釈する。

【0435】

全段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) を感染させたハクサイの葉 (*Brassica pekinensis*) の花盤に、所望する濃度の有効成分製剤をスプレーする。

30

【0436】

6日後、効能を%で決定する。100%はアブラムシがすべて死滅し；0%はどのアブラムシも死滅しなかったことを意味する。

【0437】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が500g/haの適用率で90%の効能を示した：I-1-72。

【0438】

Phaedon cochleariaeスプレー試験 (PHAECHO)

40

溶媒：78.0重量部のアセトン

：1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な有効成分の製剤を作製するために、1重量部の有効成分を、記述した重量部の溶媒を用いて溶解し、所望する濃度が達成されるまで、濃度が1000ppmの乳化剤を含有する水と混ぜる。さらに試験濃縮物を作製するために、この調製物を乳化剤含有水で希釈する。

【0439】

ハクサイの葉 (*Brassica pekinensis*) の花盤に、所望する濃度の有効成分製剤をスプレーし、乾燥後、マスタードビートル (*mustard beetle*) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫をさせる。

50

【0440】

7日後、効能を%で決定する。100%はビートルの幼虫がすべて死滅し；0%はどのビートルの幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0441】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が500g/haの適用率で100%の効能を示した：I-1-33、I-1-91、I-2-3。

【0442】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が500g/haの適用率で83%の効能を示した：I-1-18。

【0443】

10

Tetranychus urticaeスプレー試験、OP耐性

溶媒：78.0重量部のアセトン

：1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な有効成分の製剤を作製するために、1重量部の有効成分を、記述した重量部の溶媒を用いて溶解し、所望する濃度が達成されるまで、濃度が1000ppmの乳化剤を含有する水と混ぜる。さらに試験濃度物を作製するために、この調製物を乳化剤含有水で希釈する。

【0444】

全段階の温室ナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) を感染させたマメの葉 (Phaseolus vulgaris) の花盤に、所望する濃度の有効成分製剤をスプレーする。

20

【0445】

6日後、効能を%で決定する。100%はハダニがすべて死滅し；0%はどのハダニも死滅しなかったことを意味する。

【0446】

この試験では、たとえば、調製実施例から次の化合物が500g/haの適用率で95%の効能を示した：I-1-90。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2015/054550

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A01N43/653 A01N43/713 C07D401/04 C07D249/14 C07D257/06 A01P5/00 A01P7/00 A01P9/00 ADD. According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N C07D Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/116246 A2 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]; LOWE CHRISTIAN T [US]; TRULLINGER TONY K [U] 30 August 2012 (2012-08-30) the whole document -----	1-11
A	WO 2012/052412 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG [DE]; BRETSCHNEIDER THOMAS [DE]; KOEHLER ADELINE) 26 April 2012 (2012-04-26) the whole document -----	1-11
X	EP 0 957 094 A1 (PFIZER [US]; PFIZER LTD [GB]) 17 November 1999 (1999-11-17) RN 249893-20-7; page 17, lines 1-10 ----- -/-	8,9
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 12 May 2015		Date of mailing of the international search report 26/05/2015
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Götz, Gerhard

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2015/054550

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; ZHANG, HAI-HAO ET AL: "Synthesis and Characterization of 3-amino (nitro)-5-nitro-1, 2, 4-triazole derivatives", XP002726710, retrieved from STN Database accession no. 155:96525 the whole document RN 1312164-08-1 & ZHANG, HAI-HAO ET AL: "Synthesis and Characterization of 3-amino (nitro)-5-nitro-1, 2, 4-triazole derivatives", HANNENG CAILIAO , 18(1), 29-33 CODEN: HACAFQ; ISSN: 1006-9941, 2010, DOI: 10.3969/J.ISSN.1006-9941.2010.01.008 10.3969/J.ISSN.1006-9941.2010.01.008 -----	8
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; TRINKA, PETER ET AL: "Triazoles. XXXVI. The arylation of 5-amino-3-(methylthio)-1H-1,2,4-triazole with activated aryl chlorides", XP002726711, retrieved from STN Database accession no. 124:8707 the whole document RN 171084-75-6, 171084-85-8, 171084-89-2 & TRINKA, PETER ET AL: "Triazoles. XXXVI. The arylation of 5-amino-3-(methylthio)-1H-1,2,4-triazole with activated aryl chlorides", JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY , 32(4), 1359-71 CODEN: JHTCAD; ISSN: 0022-152X, 1995, DOI: 10.1002/JHET.5570320443 10.1002/JHET.5570320443 -----	8
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; REITER, JOZSEF ET AL: "1,2,4-Triazole derivatives", XP002726712, retrieved from STN Database accession no. 100:79835 the whole document RN 88722-61-6 & HU 25 867 A2 (GYOGYSZERKUTATO INTEZET, HUNG.) 29 August 1983 (1983-08-29) -----	8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2015/054550

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012116246 A2	30-08-2012	AR 085410 A1 BR 102012004142 A2 TW 201238487 A US 2012220453 A1 WO 2012116246 A2	02-10-2013 07-04-2015 01-10-2012 30-08-2012 30-08-2012
WO 2012052412 A1	26-04-2012	CN 103270029 A EP 2630133 A1 JP 2013544792 A US 2013261141 A1 WO 2012052412 A1	28-08-2013 28-08-2013 19-12-2013 03-10-2013 26-04-2012
EP 0957094 A1	17-11-1999	BR 9902084 A CA 2272014 A1 EP 0957094 A1 JP 3215385 B2 JP 2000026409 A US 6083965 A US 6110958 A US 2001005725 A1 US 2003130307 A1	11-04-2000 14-11-1999 17-11-1999 02-10-2001 25-01-2000 04-07-2000 29-08-2000 28-06-2001 10-07-2003

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/054550

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
INV.	A01N43/653 A01P5/00	A01N43/713 A01P7/00
	C07D401/04 A01P9/00	C07D249/14 C07D257/06
ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchiert Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) A01N C07D		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/116246 A2 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]; LOWE CHRISTIAN T [US]; TRULLINGER TONY K [U] 30. August 2012 (2012-08-30) das ganze Dokument -----	1-11
A	WO 2012/052412 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRETSCHNEIDER THOMAS [DE]; KOEHLER ADELINE) 26. April 2012 (2012-04-26) das ganze Dokument -----	1-11
X	EP 0 957 094 A1 (PFIZER [US]; PFIZER LTD [GB]) 17. November 1999 (1999-11-17) RN 249893-20-7; Seite 17, Zeilen 1-10 ----- -/-	8,9
☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
12. Mai 2015		26/05/2015
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Götz, Gerhard

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/054550

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; ZHANG, HAI-HAO ET AL: "Synthesis and Characterization of 3-amino (nitro)-5-nitro-1, 2, 4-triazole derivatives", XP002726710, gefunden im STN Database accession no. 155:96525 das ganze Dokument RN 1312164-08-1 & ZHANG, HAI-HAO ET AL: "Synthesis and Characterization of 3-amino (nitro)-5-nitro-1, 2, 4-triazole derivatives", HANNENG CAILIAO , 18(1), 29-33 CODEN: HACAQ; ISSN: 1006-9941, 2010, DOI: 10.3969/J.ISSN.1006-9941.2010.01.008 10.3969/J.ISSN.1006-9941.2010.01.008 -----	8
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; TRINKA, PETER ET AL: "Triazoles. XXXVI. The arylation of 5-amino-3-(methylthio)-1H-1,2,4-triazole with activated aryl chlorides", XP002726711, gefunden im STN Database accession no. 124:8707 das ganze Dokument RN 171084-75-6, 171084-85-8, 171084-89-2 & TRINKA, PETER ET AL: "Triazoles. XXXVI. The arylation of 5-amino-3-(methylthio)-1H-1,2,4-triazole with activated aryl chlorides", JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY , 32(4), 1359-71 CODEN: JHTCAD; ISSN: 0022-152X, 1995, DOI: 10.1002/JHET.5570320443 10.1002/JHET.5570320443 -----	8
X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; REITER, JOZSEF ET AL: "1,2,4-Triazole derivatives", XP002726712, gefunden im STN Database accession no. 100:79835 das ganze Dokument RN 88722-61-6 & HU 25 867 A2 (GYOGYSZERKUTATO INTEZET, HUNG.) 29. August 1983 (1983-08-29) -----	8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/054550

Im Recherchenbericht angeführtes Patendokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012116246 A2	30-08-2012	AR 085410 A1	02-10-2013
		BR 102012004142 A2	07-04-2015
		TW 201238487 A	01-10-2012
		US 2012220453 A1	30-08-2012
		WO 2012116246 A2	30-08-2012

WO 2012052412 A1	26-04-2012	CN 103270029 A	28-08-2013
		EP 2630133 A1	28-08-2013
		JP 2013544792 A	19-12-2013
		US 2013261141 A1	03-10-2013
		WO 2012052412 A1	26-04-2012

EP 0957094 A1	17-11-1999	BR 9902084 A	11-04-2000
		CA 2272014 A1	14-11-1999
		EP 0957094 A1	17-11-1999
		JP 3215385 B2	02-10-2001
		JP 2000026409 A	25-01-2000
		US 6083965 A	04-07-2000
		US 6110958 A	29-08-2000
		US 2001005725 A1	28-06-2001
		US 2003130307 A1	10-07-2003

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/41 (2006.01)	A 6 1 K 31/41	
C 0 7 D 401/12 (2006.01)	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 403/12 (2006.01)	C 0 7 D 403/12	
A 6 1 K 31/496 (2006.01)	A 6 1 K 31/496	
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 6 1 P 33/00	
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	N
A 0 1 N 43/713 (2006.01)	A 0 1 N 43/713	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

(74)代理人 100126099

弁理士 反町 洋

(74)代理人 100104617

弁理士 池田 伸美

(72)発明者 エイケ、ケビン、ハイルマン

ドイツ連邦共和国デュッセルドルフ、ベッツラーラー、ベーク、1 8

(72)発明者 ハイנטツェルゲン、ウルブレフスキー

ドイツ連邦共和国ランゲンフェルト、ビルネブルクシュトラーセ、7 3

(72)発明者 アクセル、トラウトバイン

ドイツ連邦共和国デュッセルドルフ、ゲンゼシュトラーセ、4 4

(72)発明者 イェルク、グロイル

ドイツ連邦共和国レーバークーゼン、マックス・シェーネンベルクシュトラーセ、6 アー

(72)発明者 ハルトビン、デンプスキ

ドイツ連邦共和国エルクラート、ザントハイダー、シュトラーセ、2 2 0

(72)発明者 ケルスティン、イルク

ドイツ連邦共和国ケルン、ノイッサー、バル、3 2

(72)発明者 ダニエラ、ポーツ

ドイツ連邦共和国フェットバイス、オストシュトラーセ、1

(72)発明者 ウルリッヒ、ジェルゲン

ドイツ連邦共和国ラーティンゲン、フェスター、シュトラーセ、3 7

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB02 BB09 CC41 DD12 DD34 EE01

4C086 BC17 BC60 BC62 GA07 GA08 MA01 MA04 NA14 ZB37

4H011 AC01 AC02 AC04 BB09 DA16 DD03 DE15